

**COMPUESTOS BICÍCLICOS UNIDOS PARA CONTROLAR Y COMBATIR PLAGAS DE
INVERTEBRADOS**

REFERENCIA CRUZADA A SOLICITUDES RELACIONADAS

Esta solicitud reivindica los derechos de prioridad frente a la solicitud provisional de los Estados Unidos n.º 63/531,348, presentada el 08 de agosto de 2023, que se incorpora como referencia en el presente documento.

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 y combate de plagas de invertebrados tales como artrópodos en entornos tanto agronómicos como no agronómicos.

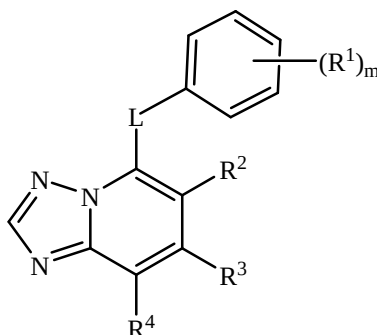
ANTECEDENTES

Controlar y combatir las plagas de invertebrados es extremadamente importante para conseguir una alta eficacia 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, puede dar como resultado un aumento de los costes para el consumidor. También es importante controlar y combatir 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 salud 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.

El documento WO 2022/003510 A1 divulga ciertos compuestos de triazolopiridina útiles como pesticidas.

SUMARIO

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



en donde

L es CR^5R^6 , $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CR}^5\text{R}^6$, OCR^5R^6 , $\text{CR}^5\text{R}^6\text{O}$; $\text{CR}^5\text{R}^6\text{NR}^7$, $\text{NR}^7\text{CR}^5\text{R}^6$, C(=E)NR^7 , $\text{NR}^7\text{C(=E)}$, $\text{C(=E)CR}^5\text{R}^6$, $\text{CR}^5\text{R}^6\text{C(=E)}$, $\text{C(=CR}^5\text{R}^6)$, $\text{CR}^5=\text{CR}^6$ o C(=E) ;

E es O, S o NR⁸;

m es 0, 1, 2, 3, 4, 5;

cada R¹ es independientemente halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF₅, C(O)NH₂, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)R¹⁴, OC(O)R¹⁴, NR¹⁰R¹¹, NR¹³C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁴, S(O)_nR¹⁴, OS(O)_nR¹⁴, Si(R¹⁴)₃, OSi(R¹⁴)₃ o MQ^a; o alquilo C₁–C₆, alquenilo C₂–C₆, alquinilo C₂–C₆, cicloalquilo C₃–C₆, alcoxi C₁–C₆, cicloalcoxi C₃–C₆, no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o dos sustituyentes R¹ en átomos de anillo adyacentes se toman junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo de 4 a 7 miembros que contiene miembros del anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

cada R², R³, R⁴ es independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF₅, C(O)H, C(O)NH₂, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)R¹⁴, OC(O)R¹⁴, NR¹⁰R¹¹, NR¹³C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁴, S(O)_nR¹⁴, OS(O)_nR¹⁴, Si(R¹⁴)₃, OSi(R¹⁴)₃ o MQ^a; o alquilo C₁–C₆, cicloalquilo C₃–C₆, alcoxi C₁–C₆, cicloalcoxi C₃–C₆, alquenilo C₂–C₆ o alquinilo C₂–C₆, no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o dos sustituyentes en átomos del anillo adyacentes (R² y R³, o R³ y R⁴) se toman junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo de 4 a 7 miembros que contiene miembros del anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

M es un enlace directo, O, S, S(O), S(O)₂ o NR⁹;

R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁–C₆, cicloalquilo C₃–C₆, haloalquilo C₁–C₆, alcoxi C₁–C₆, haloalcoxi C₁–C₆, cicloalcoxi C₃–C₆, alquiltio C₁–C₆ o haloalquiltio C₁–C₆;

o R⁵ y R⁶ unidos cada uno al mismo átomo de carbono se toman junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o

en el caso de CR⁵R⁶CR⁵R⁶, cada R⁵ y R⁶ están unidos a cada uno de un primer y un segundo carbono adyacentes y pueden, junto con el átomo de carbono al que están unidos, formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomos de carbono se seleccionan independientemente

de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

cada R⁷ es independientemente H, C(O)R¹⁵ o S(O)₂R¹⁵, o Q^b; o alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

cada R⁸ es independientemente NR¹⁰R¹¹, OR¹², C(=NR¹³)R¹⁴, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(O)R¹⁴ o S(O)_nR¹⁴; o fenilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

cada R⁹ es independientemente H, NR¹⁰R¹¹, OR¹², C(=NR¹³)R¹⁴, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(O)R¹⁴ o S(O)_nR¹⁴; o fenilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

cada R^x es independientemente halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, C(O)NH₂, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)R¹⁴, OC(O)R¹⁴, NR¹⁰R¹¹, NR¹⁴C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁴, S(O)_nR¹⁴, OS(O)_nR¹⁴, Si(R¹⁴)₃, OSi(R¹⁴)₃ o Q^b;

cada R¹⁰ es independientemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, C(O)R¹⁵ o S(O)₂R¹⁵; o fenilo o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R¹¹ es independientemente H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o

R¹⁰ y R¹¹ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R¹² es independientemente H, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R¹³ es independientemente H; OR¹⁶, S(O)_nR¹⁷, C(O)OR¹⁷, C(O)R¹⁷ o NHR¹⁸;

cada R¹⁴ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un halógeno, ciano o nitro; o C(O)OR¹⁷, C(O)NR²²R²³, NR²²R²³, NR²⁴C(O)R¹⁷, C(O)R¹⁷ o Q^b;

cada R^{15} es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o $NR^{22}R^{23}$; o fenilo o un anillo heterocíclico aromático de 5 a 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;

cada R^{16} es independientemente alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , $C(O)R^{19}$, $S(O)_n^{R20}$ o Q^b ;

cada R^{17} es independientemente alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

R^{18} es alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , $C(O)R^{19}$ o $C(O)OR^{21}$; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;

cada R^{19} es independientemente alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilalquilo C_3-C_6 ; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;

cada R^{20} es independientemente alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilalquilo C_3-C_6 ; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;

cada R^{21} es independientemente alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilalquilo C_3-C_6 o halocicloalquilalquilo C_3-C_6 ; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;

cada R^{22} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , $C(O)R^{25}$ o $S(O)_2R^{25}$; o fenilo o un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;

cada R^{23} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_4 ; o

R^{22} y R^{23} se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan

independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁–C₄, cicloalquilo C₃–C₆, haloalquilo C₁–C₄, alcoxi C₁–C₄ y haloalcoxi C₁–C₄;

5 cada R²⁴ es independientemente H o alquilo C₁–C₄;

cada R²⁵ es independientemente alquilo C₁–C₆, haloalquilo C₁–C₆, alcoxi C₁–C₆, haloalcoxi C₁–C₆; o fenilo o un anillo heterocíclico aromático de 5 a 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁–C₄, cicloalquilo C₃–C₆, haloalquilo C₁–C₄, alcoxi C₁–C₄ y haloalcoxi C₁–C₄;

10 cada Q^a es independientemente fenilo, un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros o un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 4 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁–C₄, cicloalquilo C₃–C₆, haloalquilo C₁–C₄, alcoxi C₁–C₄ y haloalcoxi C₁–C₄;

15 cada Q^b es independientemente fenilo, un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros o un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 4 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo de átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁–C₄, cicloalquilo C₃–C₆, haloalquilo C₁–C₄, alcoxi C₁–C₄ y haloalcoxi C₁–C₄; y

20 cada n es independientemente 0, 1 o 2;

siempre que, cuando R², R³, y R⁴ es H, y L es CH(OH), R¹ sea distinto de 3-trifluorometilo; cuando L es C(=O)NR⁷, con nitrógeno conectado al anillo de fenilo, al menos uno de R², R³, o R⁴ es distinto de H.

30 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 del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. En una realización, esta divulgación también proporciona una composición para controlar y combatir 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 y combatir 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 (por ejemplo, en forma de 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 dicha composición opcionalmente además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

Esta divulgación también proporciona un método para controlar y combatir 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 y combatir 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 y combatir 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 frente a 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 (por ejemplo, en forma de una composición descrita en el presente documento). Esta divulgación también se refiere a la semilla tratada (es decir, la semilla que se pone 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 cual crece la planta de cultivo o el emplazamiento (por ejemplo, medio de crecimiento) de la planta de cultivo con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1 (por ejemplo, en forma de una composición descrita en el presente documento).

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

DESCRIPCIÓN DETALLADA

Como se usan en el presente documento, se pretende que las expresiones "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene", "que tiene", "contiene", "que contiene", "caracterizado por" o cualquier otra variación de estas, abarquen una inclusión no exclusiva, sujeta a cualquier limitación indicada de forma 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, tal expresión cerraría la reivindicación frente a la inclusión de materiales que no sean los enumerados, salvo las impurezas asociadas de manera habitual a estos. 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 usa para definir una composición o 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) se debe interpretar que la descripción también describe una realización de este tipo utilizando las expresiones "que consiste esencialmente en" o "que consiste en".

Además, a menos que se indique expresamente otra cosa, "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).

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, debe leerse 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 el número esté obviamente destinado a ser singular.

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, cochinillas 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 animales. El término "helminto" incluye 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, "controlar y combatir plagas de invertebrados" significa la inhibición del desarrollo de plagas de invertebrados (incluidas la mortalidad, la reducción de la alimentación y/o la 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 fibra, e incluye el crecimiento de maíz, soja y otras leguminosas, arroz, cereales (por ejemplo, trigo, avena, cebada, centeno y arroz), hortalizas de hoja (por ejemplo, lechuga, repollo y otros cultivos de coles), hortalizas de fruto (por ejemplo, tomates, pimiento, berenjena, crucíferas y cucurbitáceas), patatas, boniatos, uvas, algodón, frutos arbóreos (por ejemplo, pomos, drupas y cítricos), frutos pequeños (por ejemplo, bayas y cerezas) y otros cultivos especiales (por ejemplo, colza, girasol y aceitunas).

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

La expresión "vigor del cultivo" se refiere a la tasa de crecimiento o acumulación de biomasa de 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 sin tratar. La expresión "rendimiento del cultivo" se refiere al retorno del material de cultivo, tanto en lo que respecta a la cantidad como a la 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 sin tratar.

La expresión "cantidad biológicamente eficaz" se refiere a la cantidad de un compuesto biológicamente activo (por ejemplo, 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 que se cultiva la planta o el emplazamiento de la planta (por ejemplo, medio de crecimiento) para proteger la planta de los daños provocados por la plaga de invertebrados o para otro efecto deseado (por ejemplo, aumentar el vigor de la planta).

Las aplicaciones no agronómicas incluyen proteger a un animal frente a una plaga de parásitos invertebrados mediante la administración de una cantidad eficaz como parasitocida (es decir, biológicamente eficaz) de un compuesto de la divulgación, normalmente en forma de una composición formulada para su uso veterinario, al animal que se ha de proteger. Como se hace referencia a los mismos en la presente divulgación y en las reivindicaciones, el término "parasitocida" y la expresión "como parasitocida" se refieren a efectos observables sobre una plaga de parásitos invertebrados para

proporcionar protección a un animal frente a la plaga. Los efectos parasiticidas normalmente se refieren a la disminución de la aparición o actividad de la plaga de parásitos invertebrados diana. Tales efectos sobre la plaga incluyen necrosis, muerte, crecimiento retardado, disminución de la movilidad o menor capacidad de permanecer sobre o en el interior del animal hospedador, reducción de la alimentación e inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre plagas de parásitos invertebrados permiten controlar y combatir (incluso prevenir, reducir o eliminar) 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 ramificado, tal como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificados 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 ramificados tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos compuestos por múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo. "Alquileno" indica un alcanodiilo de cadena lineal o ramificado. 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 ramificado 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 ramificado 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 alcoxi en 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 con alcoxi en alcoxi. "Alqueniloxi" incluye restos alqueniloxi de cadena lineal o ramificados. 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 restos alquiniloxi de cadena lineal o ramificados. 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 lineal o ramificados 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 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 con alquiltio en alcoxi. "Alquilditio" indica restos alquilditio de cadena lineal o ramificados. Los 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", "alquenilsulfinito", "alquenilsulfonilo", "alquiniltio", "alquinilsulfinito", "alquinilsulfonilo" y similares se definen de forma análoga a los ejemplos anteriores.

"Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "alquilocicloalquilo" indica una sustitución con 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 ramificados. 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 unido a la cadena de alquilo. Los ejemplos de "cicloalquilalcoxi" incluyen ciclopropilmetoxi, ciclopentiletoxí y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alcoxi de cadena lineal o ramificados. "Cianocicloalquilo" indica un grupo cicloalquilo sustituido con un grupo ciano. Los ejemplos de "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. 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 "haloalquilsulfinito" incluyen $\text{CF}_3\text{S(O)-}$, $\text{CCl}_3\text{S(O)-}$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)-}$. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S(O)}_2$, $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}_2$. Los ejemplos de "haloalquenilo" incluyen $(\text{Cl})_2\text{C=CHCH}_2$ - y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH=CHCH}_2$ -. 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 restos alquilo de cadena lineal o ramificados unidos a un resto C(=O) . Los ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{C(=O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C(=O)-}$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC(=O)-}$. 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^{25} es un anillo aromático heterocíclico de 5 a 6 miembros sustituido con al menos un sustituyente seleccionado del grupo de sustituyentes como se describe en el sumario, los sustituyentes pueden estar unidos al resto del compuesto de Fórmula 1 a través de cualquier miembro de anillo disponible del anillo heterocíclico.

Cuando Q^a o Q^b es un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros sustituido con al menos un sustituyente como se describe en el sumario, el sustituyente puede estar unido al resto del compuesto de Fórmula 1 a través de cualquier miembro de anillo disponible del anillo de 5 o 6 miembros.

Cuando se muestra que un grupo variable está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo, $(\text{R}^1)_m$ en donde r puede ser 0, entonces el hidrógeno puede estar en la posición incluso si no se cita en la definición del grupo variable. Cuando se dice que una o más posiciones en un grupo "no están sustituidas" o están "sin sustituir", entonces hay átomos de nitrógeno unidos hasta ocupar cualquier valencia libre.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica con 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; alcoialquilo C_2 designa CH_3OCH_2- ; alcoialquilo 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 alcoialquilo C_4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, incluyendo 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 más de 1) se seleccionan independientemente del grupo de sustituyentes definidos, p. ej., $[(\text{R}^1)_m]$, m es 0, 1, 2, 3, 4 o 5.

Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R^2 , R^3 o R^4 , entonces cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que esto es equivalente a que dicho grupo no esté sustituido. Cuando se dice que una o más posiciones en un grupo "no están sustituidas" o están "sin sustituir", entonces hay átomos de nitrógeno unidos hasta ocupar cualquier valencia libre.

A menos que se indique otra cosa, un "anillo" o "sistema de anillos" como componente de la Fórmula 1 es carbocíclico o heterocíclico. La expresión "sistema de anillos" indica dos o más anillos condensados. Las expresiones "sistema de anillos bicíclico" y "sistema de anillos bicíclico condensado" indican un sistema de anillos que consiste en dos anillos condensados, que pueden estar "orto-condensados", ser "bicíclicos con puente" o "espirobicíclicos". Un "sistema de anillos bicíclico orto-condensado" indica un sistema de anillos en donde los dos anillos constituyentes tienen dos átomos

adyacentes en común. Un "sistema de anillos bicíclico con puente" se forma enlazando un segmento de uno o más átomos con miembros de anillo no adyacentes de un anillo. Un "sistema de anillos espirobicíclico" se forma uniendo un segmento de dos o más átomos al mismo miembro de anillo de un anillo. La expresión "sistema de anillos heterobicíclico condensado" indica un sistema de anillos bicíclico condensado en el que al menos un átomo del anillo no es carbono. La expresión "miembro de anillo" se refiere a un átomo u otro resto (por ejemplo, $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$ o $S(O)_2$) que forma la cadena principal de un anillo o sistema de anillos.

Las expresiones "anillo carbocíclico", "carbociclo" o "sistema de anillos carbocíclico" indican un anillo o sistema de anillos en donde los átomos que forman la cadena principal del anillo se seleccionan solamente de carbono. Los términos "anillo heterocíclico", "heterociclo" o "sistema de anillos heterocíclico" indican un anillo o sistema de anillos en el que al menos un átomo que forma la cadena principal del anillo no es carbono, por ejemplo, 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 de acuerdo con 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 $C=C=N$). La expresión "anillo parcialmente insaturado" representa 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 aloja potencialmente un número de dobles enlaces no acumulados entre miembros de anillo adyacentes (es decir, en su forma homóloga totalmente insaturada) superior al número de dobles enlaces presentes (es decir, en su forma parcialmente insaturada).

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

"Aromático" indica que cada uno de los átomos anulares 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 al anillo para cumplir la regla de Hückel. La expresión "sistema de anillos aromático" indica un sistema de anillos heterocíclico o carbocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. Cuando un anillo carbocíclico totalmente insaturado cumple la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina "anillo aromático" o "anillo carbocíclico aromático".

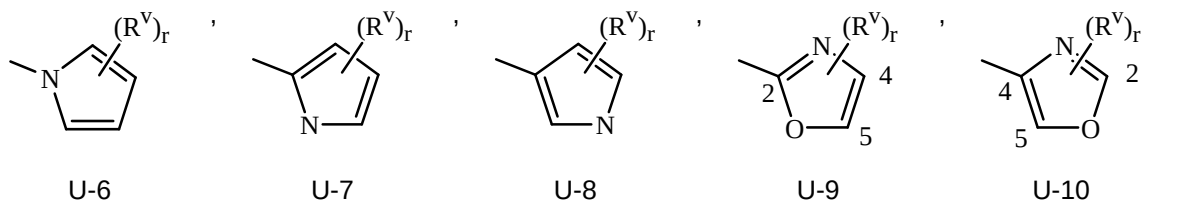
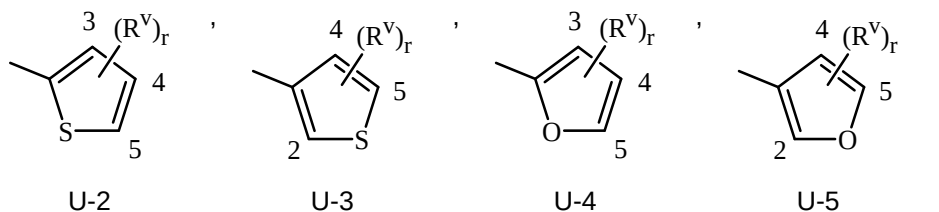
La expresión "sistema de anillos carbocíclico aromático" indica un sistema de anillos carbocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. Cuando un anillo heterocíclico totalmente insaturado cumple la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina "anillo heteroaromático".

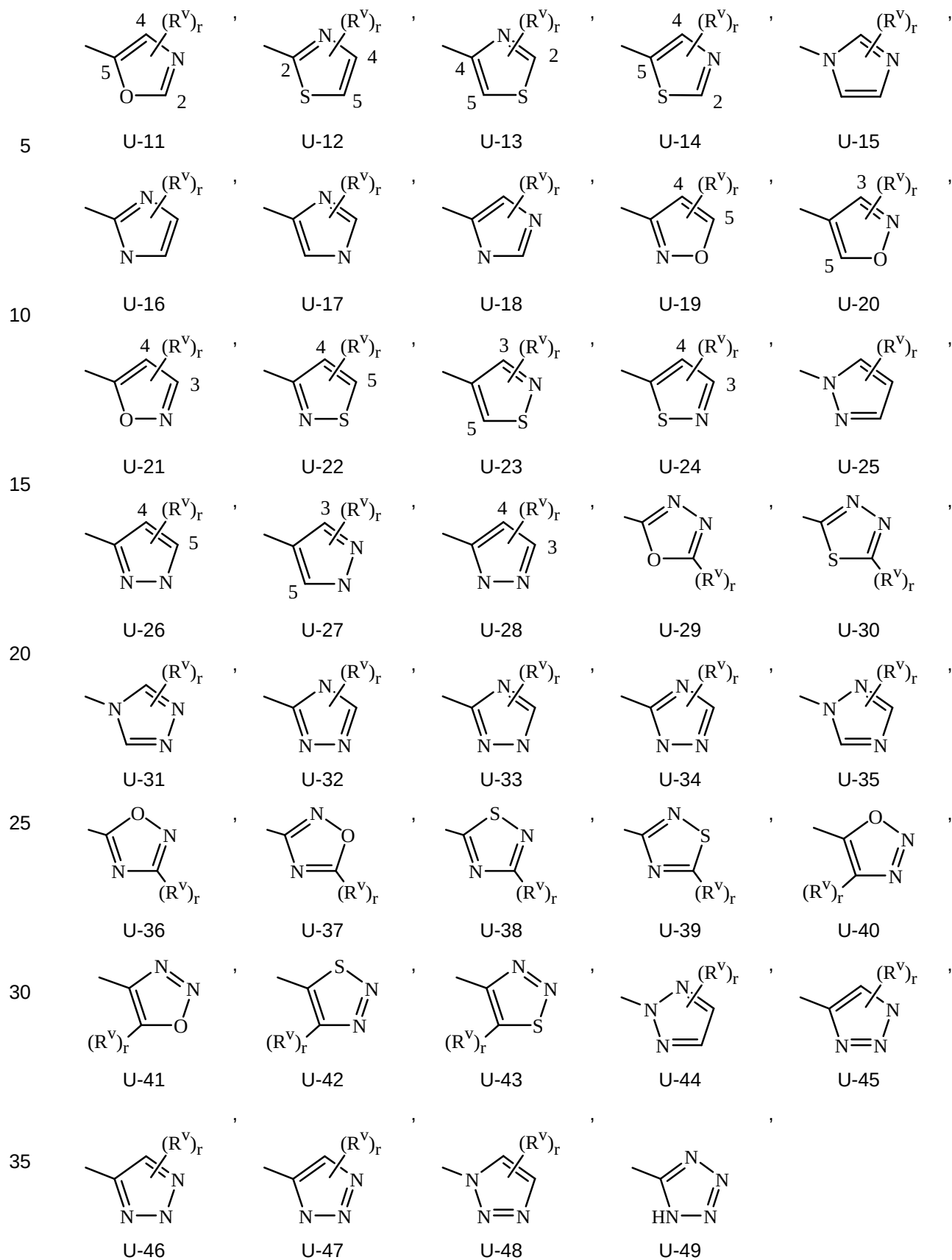
o anillo heterocíclico aromático. La expresión "sistema de anillos heterocíclico aromático" indica un sistema de anillos heterocíclico en el que al menos un anillo del sistema de anillos es aromático. La expresión "sistema de anillos no aromático" indica un sistema de anillos carbocíclico o heterocíclico que puede estar totalmente saturado, así como parcial o totalmente insaturado, siempre que ninguno de los anillos del sistema de anillos sea aromático. La expresión "sistema de anillos carbocíclico no aromático" indica un anillo carbocíclico en el que ningún anillo del sistema de anillos es aromático. La expresión "sistema de anillos heterocíclico no aromático" indica un sistema de anillos heterocíclico en el que ningún anillo del sistema de anillos es aromático.

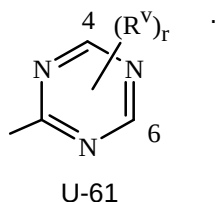
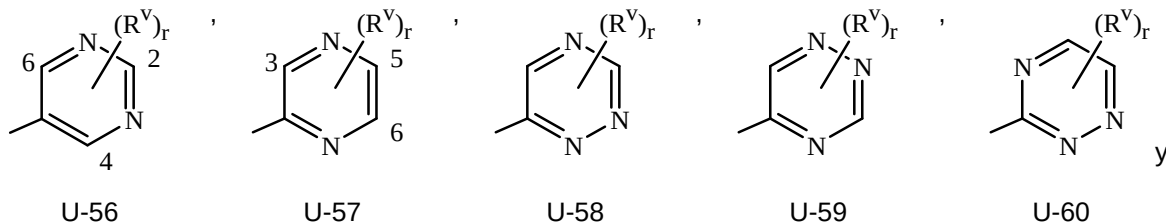
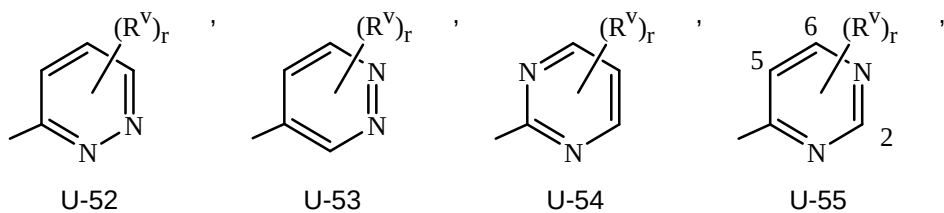
La expresión "opcionalmente sustituido" con respecto a los anillos heterocíclicos se refiere a grupos que no están sustituidos o que tienen al menos un sustituyente distinto de hidrógeno que no anula la actividad biológica que posee el análogo no sustituido. Como se utilizan en el presente documento,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

Como se ha indicado anteriormente, sustituyentes tales como por ejemplo Q^a , o Q^b pueden ser (entre otros) un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Sumario. Los ejemplos de un anillo heterocíclico aromático insaturado de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente 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 Sumario 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 se limita al número entero 1, y cuando R^v es H y r es 1 esto significa que el grupo U no está sustituido y hay un hidrógeno presente en la posición indicada por $(R^v)_r$.

Presentación 1





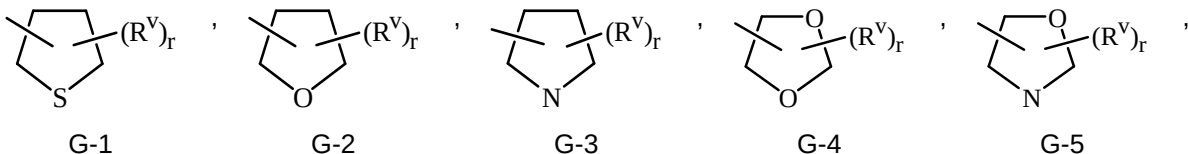


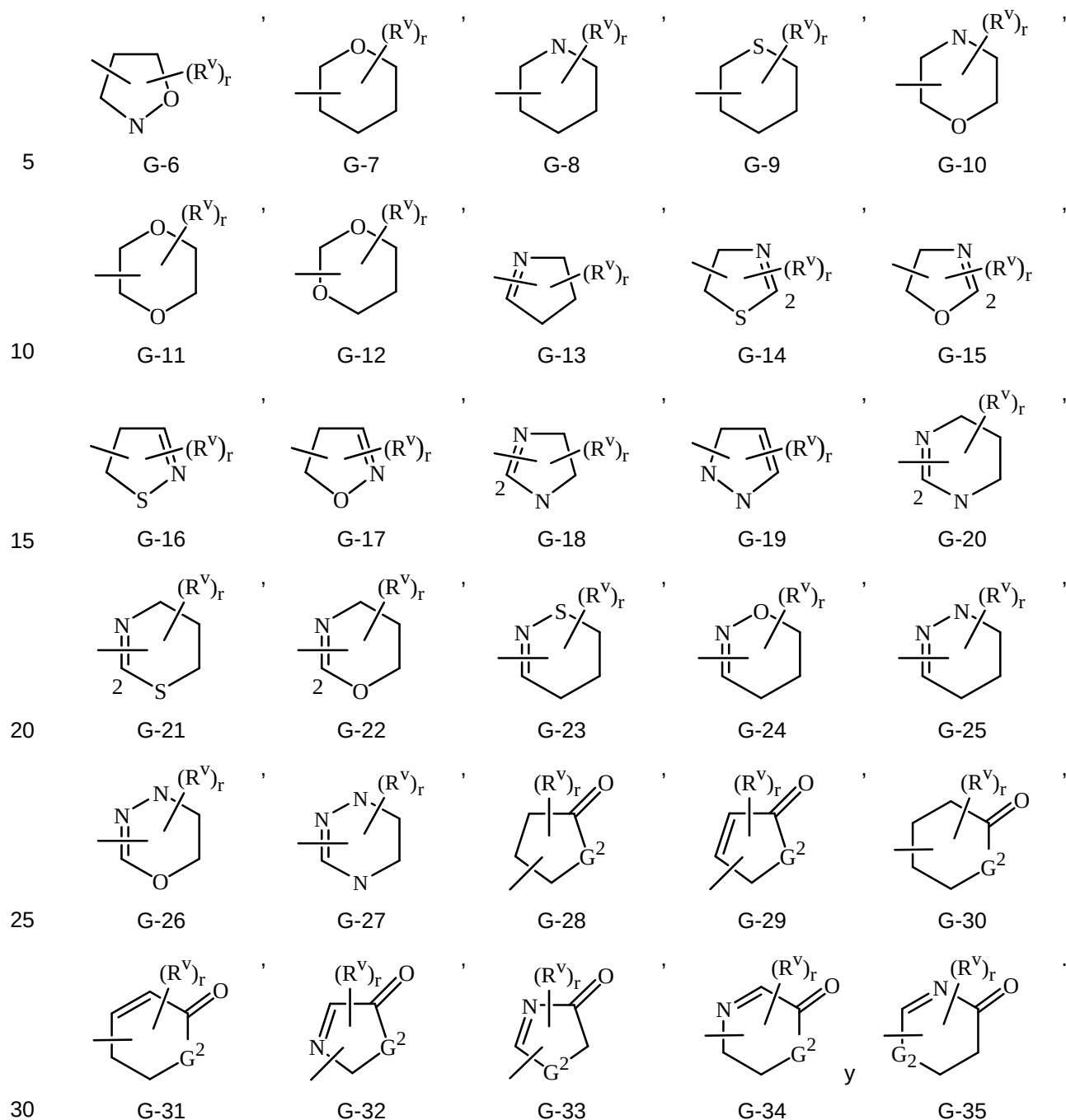
Obsérvese que cuando un sustituyente es un anillo heterocíclico no aromático saturado o insaturado de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo de sustituyentes como los definidos en el Sumario, uno o dos miembros anulares de carbono del heterociclo pueden 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. Nótese 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 descritos en el Sumario, designados como R^v a continuación, 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 un sustituyente comprende un anillo seleccionado de G-28 a 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 los que se definen en el Sumario.

Presentación 2





Aunque en las estructuras U-2 a U-61 se muestren grupos R^v , cabe destacar 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 . Nótese 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. Nótese 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. Nótese que algunos anillos U sólo pueden estar sustituidos con menos de 4 grupos R^v (por ejemplo, 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 de anillos heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para revisiones exhaustivas, véase el conjunto de ocho volúmenes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, redactores jefes A. R. Katritzky y C. W. Rees, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce volúmenes 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 isómeras. 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.

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 octuplete de la cuña se une al átomo sobresaliendo 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 en donde el extremo octuplete de la cuña se une al átomo más alejado del observador. Un enlace ondulado indica que se desconoce la estereoquímica del enlace.

Los compuestos de Fórmula 1 pueden comprender centros quirales. Por ejemplo, los sustituyentes de la Fórmula 1 pueden contener centros quirales. Esta divulgación comprende mezclas racémicas, así como estereoconfiguraciones enriquecidas y esencialmente puras en estos centros quirales adicionales.

Los compuestos de esta 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. Un experto en la materia apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar N-óxidos, puesto que el nitrógeno necesita 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, e incluyen 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. Estos métodos para la preparación de *N*-óxidos se han descrito y revisado ampliamente en la bibliografía, véanse, por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, págs. 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 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*, vol. 43, págs. 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 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*, vol. 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 sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Por tanto, una gran variedad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para controlar y combatir 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 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. En consecuencia, la presente divulgación comprende compuestos seleccionados de Fórmula 1, *N*-óxidos y sales adecuadas de los mismos.

Los compuestos seleccionados de Fórmula 1, estereoisómeros, tautómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos, 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 esencialmente un tipo monocristalino 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 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** pueden conseguirse mediante métodos conocidos por los expertos en la materia que incluyen, por ejemplo, la cristalización usando disolventes y temperaturas seleccionados. Los compuestos de esta divulgación pueden existir como uno o más polimorfos cristalinos. Esta divulgación comprende tanto polimorfos individuales como mezclas de polimorfos, incluidas las mezclas enriquecidas en un polimorfo con respecto a otros. Para consultar 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 Sumario 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 que se especifican en el Sumario, a menos que se definan adicionalmente en las Realizaciones.

Realización 1: Un compuesto de Fórmula **1** en donde L es CR^5R^6 , $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CR}^5\text{R}^6$, OCR^5R^6 , $\text{CR}^5\text{R}^6\text{O}$; $\text{CR}^5\text{R}^6\text{NR}^7$, $\text{NR}^7\text{CR}^5\text{R}^6$, C(=E)NR^7 , $\text{NR}^7\text{C(=E)}$, $\text{C(=E)CR}^5\text{R}^6$, $\text{CR}^5\text{R}^6\text{C(=E)}$, $\text{C(=CR}^5\text{R}^6)$ o $\text{CR}^5=\text{CR}^6$.

Realización 1a: Un compuesto de Fórmula **1** en donde L es CR^5R^6 , $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CR}^5\text{R}^6$, OCR^5R^6 , $\text{CR}^5\text{R}^6\text{O}$; $\text{CR}^5\text{R}^6\text{NR}^7$ o $\text{NR}^7\text{CR}^5\text{R}^6$.

Realización 1b: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1 en donde L es C(=E)NR^7 , $\text{NR}^7\text{C(=E)}$, $\text{C(=E)CR}^5\text{R}^6$, $\text{CR}^5\text{R}^6\text{C(=E)}$, $\text{C(=CR}^5\text{R}^6)$ o $\text{CR}^5=\text{CR}^6$.

Realización 1c: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1 en donde L es CR^5R^6 .

Realización 1d: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1 en donde L es $\text{CR}^5\text{R}^6\text{CR}^5\text{R}^6$.

Realización 1e: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1 en donde L es OCR^5R^6 .

Realización 1f: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{CR}^5\text{R}^6\text{O}$.

Realización 1g: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{CR}^5\text{R}^6\text{NR}^7$.

Realización 1h: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{NR}^7\text{CR}^5\text{R}^6$.

Realización 1i: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es C(=E)NR^7 .

Realización 1j: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{NR}^7\text{C(=E)}$.

Realización 1k: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{C(=E)CR}^5\text{R}^6$.

Realización 1l: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{CR}^5\text{R}^6\text{C(=E)}$.

Realización 1m: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{C(=CR}^5\text{R}^6)$.

Realización 1n: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 1a en donde L es $\text{CR}^5=\text{CR}^6$.

Realización 2: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1, 1b, 1i, 1j, 1k o 1l en donde E es O o S.

Realización 2a: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 2 en donde E es O.

Realización 2b: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 2 en donde E es S.

Realización 2c: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 2 en donde E es NR^8 .

Realización 3: Un compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^1 es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

Realización 3a: Un compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^1 es $S(O)_nR^{14}$ o $OS(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

Realización 3b: El compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^1 es $S(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

Realización 3c: El compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^1 es $S(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 o alcoxi C_1-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

Realización 3d: El compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^1 es $S(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 o alcoxi C_1-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

Realización 3e: El compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^1 es $S(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alcoxi C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

Realización 3f: Un compuesto de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^1 es $S(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

Realización 3g: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 2b, en donde R^1 es MQ^a .

Realización 3h: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 3e en donde M es un enlace directo, O, S, $S(O)$, $S(O)_2$ o NR^9 .

Realización 3i: El compuesto de Fórmula **1** o la Realización 3f, en donde M es un enlace directo, O, S, $S(O)$, $S(O)_2$ o $S(O)_2$.

Realización 3j: El compuesto de Fórmula **1** o la Realización 3g, en donde M es un enlace directo, o S, $S(O)$ o $S(O)_2$,

Realización 3k: El compuesto de Fórmula **1** o la Realización 3j en donde M es un enlace directo u O.

Realización 3l: Los compuestos de Fórmula **1** o cualquiera de las realizaciones 3g a 3k en donde cada Q^a es independientemente fenilo, un anillo heterocíclico aromático de 5 a 6 miembros o un anillo heterocíclico no aromático de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados entre átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente entre un átomo de

oxígeno, un átomo de azufre y hasta 4 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros de anillo que son átomos de carbono se seleccionan independientemente entre C(=O) y C(=S) y el miembro de anillo que es un átomo de azufre se selecciona entre S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente entre el grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

Realización 4: Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R² es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF₅, C(O)H, C(O)NH₂, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)R¹⁴, OC(O)R¹⁴, NR¹⁰R¹¹, NR¹³C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁴, S(O)_nR¹⁴, OS(O)_nR¹⁴, Si(R¹⁴)₃, OSi(R¹⁴)₃ o MQ^a; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

Realización 4a: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R² es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF₅, C(O)NH₂, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)R¹⁴, OC(O)R¹⁴, NR¹⁰R¹¹, NR¹³C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁴, S(O)_nR¹⁴, OS(O)_nR¹⁴, Si(R¹⁴)₃, OSi(R¹⁴)₃ o MQ^a; o alquilo C₁-C₆.

Realización 4b: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R² es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo o alquilo C₁-C₆.

Realización 4c: Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones anteriores en donde R² es hidrógeno o halógeno; o alquilo C₁-C₆.

Realización 4d: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R² es hidrógeno.

Realización 4e: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones 1 a 4c, en donde R² es alquilo C₁-C₆.

Realización 5: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R³ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF₅, C(O)H, C(O)NH₂, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)R¹⁴, OC(O)R¹⁴, NR¹⁰R¹¹, NR¹³C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁴, S(O)_nR¹⁴, OS(O)_nR¹⁴, Si(R¹⁴)₃, OSi(R¹⁴)₃ o MQ^a; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, no sustituido o sustituido con al menos un R^x.

Realización 5a: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R³ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF₅, C(O)NH₂, C(O)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)NR¹⁰R¹¹, C(=NR¹³)R¹⁴, OC(O)R¹⁴, NR¹⁰R¹¹, NR¹³C(O)R¹⁴, C(O)R¹⁴, S(O)_nR¹⁴, OS(O)_nR¹⁴, Si(R¹⁴)₃, OSi(R¹⁴)₃ o MQ^a; o alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆.

Realización 5b: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R³ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo, o alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆.

Realización 5c: Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R³ es hidrógeno o halógeno; o alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆.

Realización 5d: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^3 es H, alquilo C_1-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 .

Realización 5e: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^3 es H, Me o c-Pr.

Realización 5f: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^3 es Me o c-Pr.

Realización 5g: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^3 es Me.

Realización 5f: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^3 es c-Pr.

Realización 6: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)H$, $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 6a: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores en donde R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ; o alquilo C_1-C_6 .

Realización 6b: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo o alquilo C_1-C_6 .

Realización 6c: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^4 es hidrógeno o halógeno; o alquilo C_1-C_6 .

Realización 6d: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde R^4 es hidrógeno.

Realización 6e: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-6c, en donde R^4 es Me.

Realización 6f: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-6c, en donde R^4 es F.

Realización 7: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-6f, en donde R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 .

Realización 7a: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7, en donde R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 o alquiltio C_1-C_6 .

Realización 7b: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7a, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o cicloalcoxi C₃-C₆.

Realización 7c: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7b, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆.

Realización 7d: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7c, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆.

Realización 7e: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7d, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆.

Realización 7f: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7e, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆.

Realización 7g: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7f, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆.

Realización 7h: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7g, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆.

Realización 7i: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7h, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, halógeno o alcoxi C₁-C₆.

Realización 7j: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-7i, en donde R⁵ y R⁶ son independientemente hidrógeno, F o MeO.

Realización 7k: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-6f, en donde R⁵ y R⁶ unidos cada uno al mismo carbono se toman junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados entre átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares que son átomos de carbono se seleccionan independientemente entre C(=O) y C(=S) y el miembro anular que es un átomo de azufre se selecciona entre S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o

en el caso de CR⁵R⁶CR⁵R⁶, cada R⁵ y R⁶ están unidos a cada uno de un primer y un segundo carbono adyacentes y pueden, junto con el átomo de carbono al que están unidos, formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados entre átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares que son átomos de carbono se seleccionan independientemente entre C(=O) y C(=S) y el miembro anular que es un átomo de azufre se selecciona entre S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x.

Realización 7i: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-6f, en donde R^5 y R^6 unidos cada uno al mismo carbono se toman junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados entre átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares que son átomos de carbono se seleccionan independientemente entre $C(=O)$ y $C(=S)$ y el miembro anular que es un átomo de azufre se selecciona entre S, $S(O)$ o $S(O)_2$, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 7j: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1-1e y 3-6f, en donde en el caso de $CR^5R^6CR^5R^6$, cada R^5 y R^6 están unidos a cada uno de un primer y un segundo carbono adyacentes y pueden, junto con el átomo de carbono al que están unidos, formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados entre átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 miembros anulares que son átomos de carbono se seleccionan independientemente entre $C(=O)$ y $C(=S)$ y el miembro anular que es un átomo de azufre se selecciona entre S, $S(O)$ o $S(O)_2$, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 8: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1, 1f-1g y 3-6f, en donde R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$ o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 8a: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1, 1f-1g y 3-6f y 8, en donde R^7 es alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 8b: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 1, 1f-1g, 3-6f y 8, en donde R^7 es H, alquilo C_1-C_6 , $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$ o Q^b ;

Realización 8c: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 8b, en donde R^7 es H, alquilo C_1-C_6 , $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$;

Realización 8d: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 8c, en donde R^7 es H o $S(O)_2R^{15}$;

Realización 8e: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 8b, en donde R^7 es H, alquilo C_1-C_6 o $C(O)R^{15}$;

Realización 8f: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 8e, en donde R^7 es H, alquilo C_1-C_6 .

Realización 8g: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 8f, en donde R^7 es H.

Realización 8h: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 8f, en donde R^7 es alquilo C_1-C_6 .

Realización 9: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 2-8h, en donde R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 9a: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 2-9 anteriores, en donde R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$.

Realización 9b: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones 2-9, en donde R^8 es fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 9c: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 9b, en donde R^8 es fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 .

Realización 9d: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 9a, en donde R^8 es OR^{12} ;

Realización 9e: Un compuesto de Fórmula **1** o la Realización 9d, en donde R^{12} es alquilo C_1-C_4 ;

Realización 10: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde n es 0, 1 o 2.

Realización 11: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde m es 0, 1, 2 o 3.

Realización 11a: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde m es 0, 1 o 2.

Realización 11b: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde m es 1 o 2.

Realización 11c: Un compuesto de Fórmula **1** o una cualquiera de las realizaciones anteriores, en donde m es 1.

Realización X. Un método para controlar y combatir 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**.

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

Realización X2. Un método de la Realización X1, en donde el miembro de los hemípteros 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*.

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 blancas de la familia *Aleyrodidae*.

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

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 pardo pequeño), *Macrostelus quadrilineatus* Forbes (saltapuntas), *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 hemíptero 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), *Graptostethus* 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.

Las combinaciones de las Realizaciones 1 a X8 se ilustran mediante las siguientes Realizaciones: Realización A1. Los compuestos de Fórmula 1 en donde

L es CR^5R^6 , $CR^5R^6CR^5R^6$, OCR^5R^6 , o CR^5R^6O ; $CR^5R^6NR^7$, $NR^7CR^5R^6$, $C(=E)NR^7$, $NR^7C(=E)$, $C(=E)CR^5R^6$, $CR^5R^6C(=E)$, $C(=CR^5R^6)$, $CR^5=CR^6$ o $C(=E)$;

E es O o S;

n es 0, 1 o 2;

m es 1, 2 o 3;

R^1 es alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ; o MQ^a ;

R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 ;

R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ; o alquilo C_1-C_6 ;

R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ;

R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$ o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ; y

R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización A2.

Los compuestos de Fórmula 1 en donde

L es CR^5R^6 , OCR^5R^6 , o CR^5R^6O ; $C(=E)NR^7$, $NR^7C(=E)$ o $C(=E)$;

E es O o S;

n es 0, 1 o 2;

m es 1, 2 o 3;

R^1 es alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ; o MQ^a ;

R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 ;

5 R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ; o alquilo C_1-C_6 ;

10 R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ;

R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$ o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ; y

15 R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización A3. El compuesto de Fórmula 1 o la Realización 1A, en donde

L es CR^5R^6 , OCR^5R^6 , o CR^5R^6O ; $C(=E)NR^7$, $NR^7C(=E)$ o $C(=E)$;

E es O;

20 n es 0, 1 o 2;

m es 1, 2 o 3;

R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 ;

R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ;

25 R^4 es hidrógeno, halógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ;

R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$ o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ; y

30 R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización A4. El compuesto de Fórmula I o la Realización 1A, en donde

L es CR^5R^6 , OCR^5R^6 o CR^5R^6O ;

35 n es 0, 1 o 2;

m es 1, 2 o 3;

R^1 es alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 ;

R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$,
 5 $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ;
 o alquilo C_1-C_6 ;

R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ;

y

10 R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 ,
 cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un
 R^x .

Realización A5. El compuesto de Fórmula I o la Realización A1, en donde

L es $C(=E)NR^7$, $NR^7C(=E)$ o $C(=E)$;

15 E es O o S;

n es 0, 1 o 2;

m es 1, 2 o 3;

R^1 es alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

20 R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 ;

R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$,
 25 $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ;
 o alquilo C_1-C_6 ;

R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$ o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6
 o alquino C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ; y

30 R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 ,
 cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un
 R^x .

Realización A6. El compuesto de Fórmula I o la Realización 1A, en donde

L es CR^5R^6 , OCR^5R^6 o CR^5R^6O ;

n es 0, 1 o 2;

35 m es 1;

R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 ;

R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ; o alquilo C_1-C_6 ;

R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ; y

R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización A7. El compuesto de Fórmula I o la Realización 1A, en donde

L es $C(=E)NR^7$, $NR^7C(=E)$ o $C(=E)$;

E es O;

n es 0, 1 o 2;

m es 1;

R^1 es alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 ;

R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro o hidroxilo; o alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ;

R^4 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, SF_5 , $C(O)NH_2$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})NR^{10}R^{11}$, $C(=NR^{13})R^{14}$, $OC(O)R^{14}$, $NR^{10}R^{11}$, $NR^{13}C(O)R^{14}$, $C(O)R^{14}$, $S(O)_nR^{14}$, $OS(O)_nR^{14}$, $Si(R^{14})_3$, $OSi(R^{14})_3$ o MQ^a ; o alquilo C_1-C_6 ;

R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$ o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ; y

R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 o alquino C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización A8. Los compuestos de Fórmula 1, en donde

L es CR^5R^6 , $CR^5R^6CR^5R^6$, OCR^5R^6 , o CR^5R^6O ; $C(=E)NR^7$, $NR^7C(=E)$ o $C(=E)$;

E es O;

R^1 es $S(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

R^2 es hidrógeno;

R^3 es alquilo C_1-C_6 ;

R^4 es hidrógeno;

R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ;

R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$, o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

n es 0, 1 o 2; y

m es 1.

Realización A9. Los compuestos de Fórmula 1, en donde

L es CR^5R^6 , $CR^5R^6CR^5R^6$, OCR^5R^6 , o CR^5R^6O ; $C(=E)NR^7$, $NR^7C(=E)$ o $C(=E)$;

E es O;

R^1 es $S(O)_nR^{14}$; o alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

R^2 es hidrógeno;

R^3 es alquilo C_1-C_6 ;

R^4 es hidrógeno;

R^5 y R^6 son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ;

R^7 es H, $C(O)R^{15}$ o $S(O)_2R^{15}$, o Q^b ; o alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

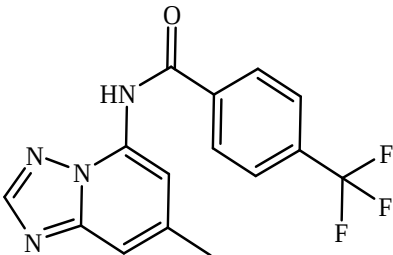
R^8 es $NR^{10}R^{11}$, OR^{12} , $C(=NR^{13})R^{14}$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, $C(O)R^{14}$ o $S(O)_nR^{14}$; o fenilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o alquinilo C_2-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x ;

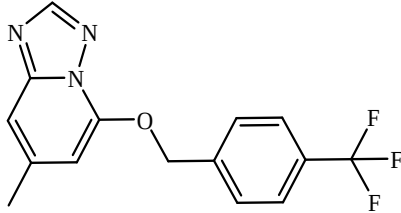
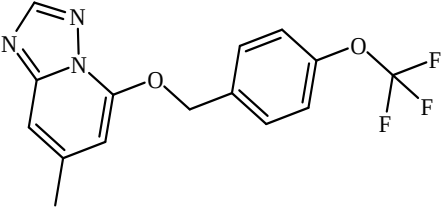
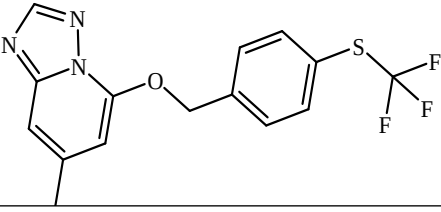
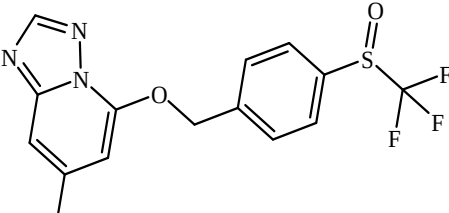
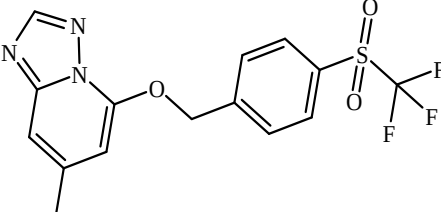
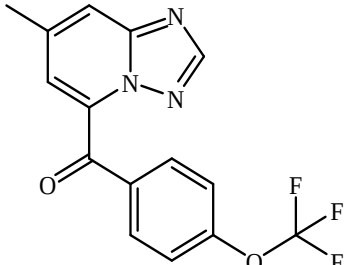
n es 0, 1 o 2; y

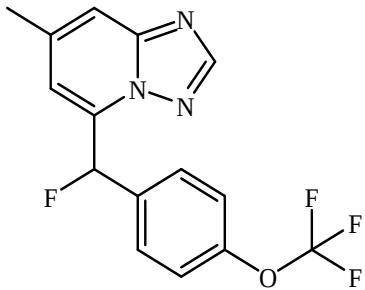
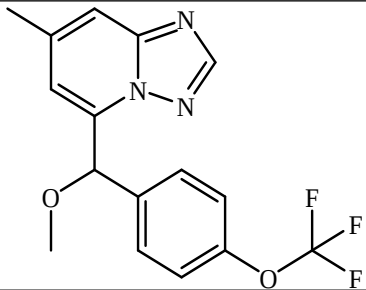
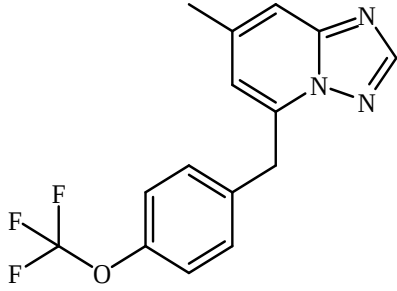
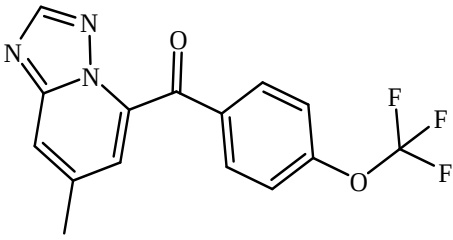
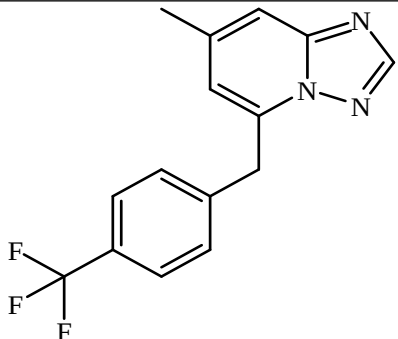
m es 1.

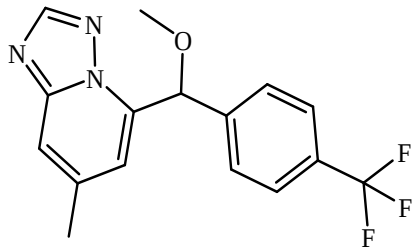
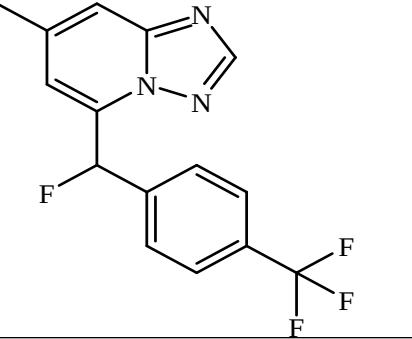
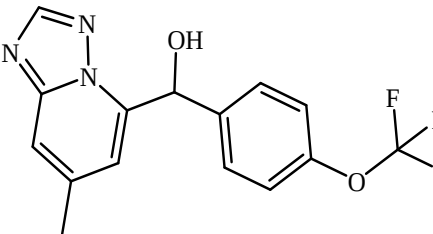
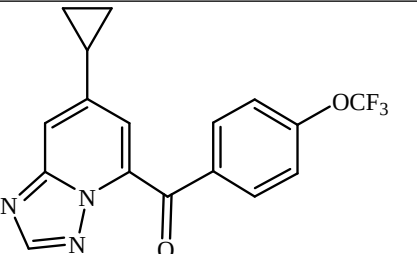
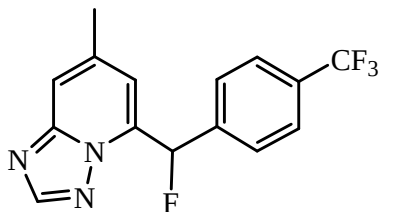
Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 seleccionados del grupo que consiste en los representados en la Tabla 1

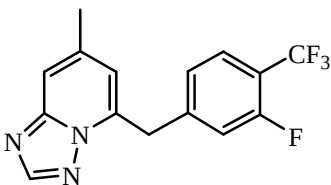
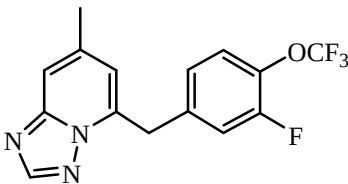
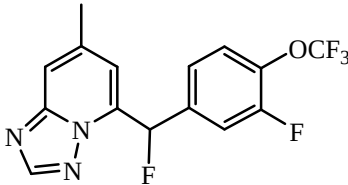
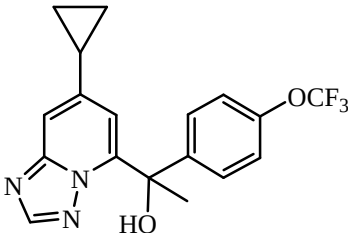
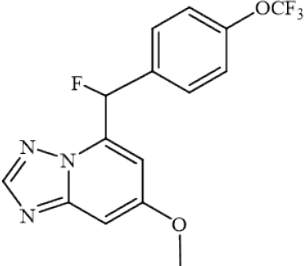
Tabla 1

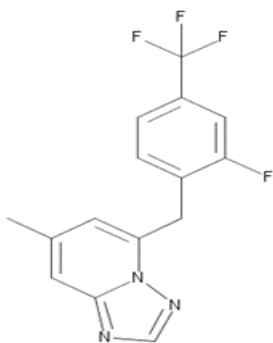
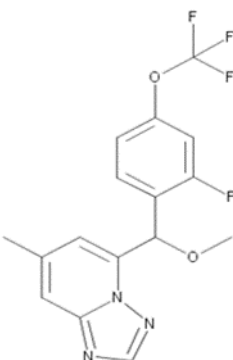
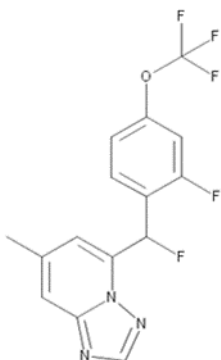
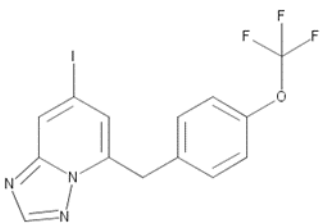
Compuesto (Comp.)	Estructura	Nombre químico ^{1,2}
1		N-(7-Metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)-4-(trifluorometil)benzamida ²

5	2		7-Metil-5-[[4-(trifluorometil)fenil]metoxi][1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ²
10	3		7-metil-5-((4-(trifluorometoxi)bencil)oxi)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
15	4		7-metil-5-((4-(trifluorometil)tio)bencil)oxi)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
20	5		7-metil-5-((4-(trifluorometil)sulfinil)bencil)oxi)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
25	6		7-metil-5-((4-(trifluorometil)sulfonil)bencil)oxi)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina
30	7		(7-Metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina-5-il)[4-(trifluorometoxi)fenil]metanona ²

5	8		5-[Fluoro[4-(trifluoromethoxy)phenyl]methyl]-7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ²
10	9		5-[Metoxi[4-(trifluoromethoxy)fenil]metil]-7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ²
15	10		7-Metil-5-[[4-(trifluoromethoxy)fenil]metil][1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ²
20	11		(7-Metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)(4-(trifluoromethoxy)fenil)metanona ¹
30	12		7-Metil-5-[[4-(trifluorometil)fenil]metil][1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ²
35			

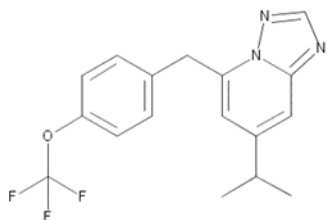
5	13		5-(metoxi(4-(trifluorometil)fenil)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
10	14		5-[Fluoro[4-(trifluorometil)fenil]metil]-7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ²
15	15		(7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)(4-(trifluorometoxi)fenil)metanol ¹
20	19		(6-ciclopropil-3aH-inden-4-il)(4-(trifluorometoxi)fenil)metanona ¹
25	48		5-(fluoro(4-(trifluorometil)fenil)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹

5	49		5-(3-fluoro-4-(trifluorometil)bencil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
10	52		5-(3-fluoro-4-(trifluorometoxi)bencil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
15	53		5-(fluoro(3-fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
20	79		1-(7-ciclopropil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)-1-(4-(trifluorometoxi)fenil)etan-1-ol ¹
30	33		5-(fluoro(4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-7-metoxi-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹

5	82		5-(2-fluoro-4-(trifluorometil)bencil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
10	84		5-((2-fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)(metoxi)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
15	86		5-(fluoro(2-fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
20	141		7-yodo-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
25			
30			

5

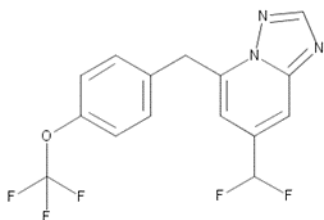
159



7-isopropil-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-
[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina¹

10

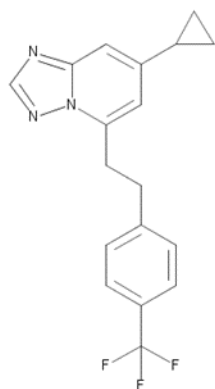
160



7-(difluorometil)-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-
[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina¹

15

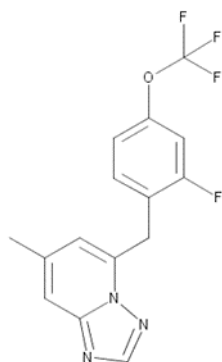
103



7-ciclopropil-5-(4-(trifluorometil)bencil)-
[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina¹

20

83

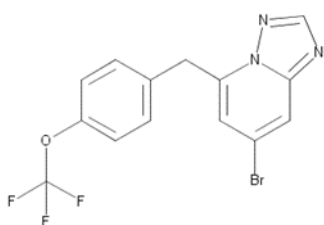


5-(2-fluoro-4-(trifluorometoxi)bencil)-7-metil-
[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina¹

25

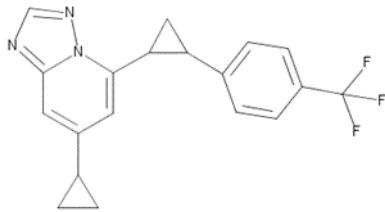
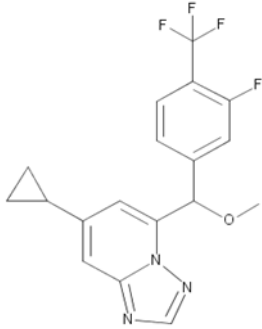
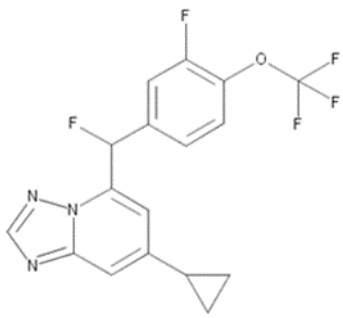
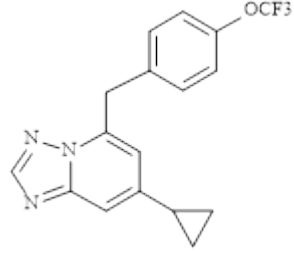
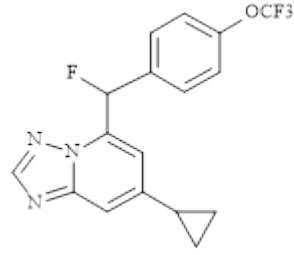
30

128



7-bromo-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-
[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina¹

35

5	130		7-ciclopropil-6-(2-(3-(trifluorometil)fenil)ciclopropil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
10	226		7-ciclopropil-5-((3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)(metoxi)metil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
15	221		7-ciclopropil-5-(fluoro(3-fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
20	21		7-ciclopropil-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
25	18		7-ciclopropil-5-(fluoro(4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina ¹
30			
35			

¹ Nombres químicos generados automáticamente con ChemDraw Professional, versión 17.0.

² Nombre CAS.

, y cualquier combinación de los compuestos anteriores.

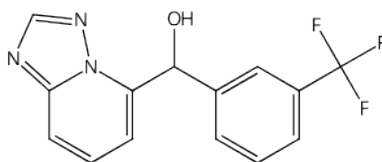
Realizaciones más específicas incluyen:

Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en:

- 5 N-(7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)-4-(trifluorometil)benzamida,
7-metil-5-[[4-(trifluorometil)fenil]metoxi][1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
(7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)[4-(trifluorometoxi)fenil]metanona,
5-[fluoro[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
5-[metoxi[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-metil-5-[[4-(trifluorometoxi)fenil]metil][1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-metil-5-[[4-(trifluorometil)fenil]metil][1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
10 5-[fluoro[4-(trifluorometil)fenil]metil]-7-metil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
(6-ciclopropil-3aH-inden-4-il)(4-(trifluorometoxi)fenil)metanona,
5-(fluoro(4-(trifluorometil)fenil)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
5-(3-fluoro-4-(trifluorometil)bencil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
5-(3-fluoro-4-(trifluorometoxi)bencil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
15 5-(fluoro(3-fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
1-(7-ciclopropil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)-1-(4-(trifluorometoxi)fenil)etan-1-ol, 5-(fluoro(4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-7-metoxi-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
5-(2-fluoro-4-(trifluorometil)bencil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
5-((2-fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)(metoxi)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina, 5-(fluoro(2-
20 fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina, 7-yodo-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-isopropil-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-(difluorometil)-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-ciclopropil-5-(4-(trifluorometil)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
25 5-(2-fluoro-4-(trifluorometoxi)bencil)-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-bromo-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-ciclopropil-6-(2-(3-(trifluorometil)fenil)ciclopropil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
7-ciclopropil-5-((3-fluoro-4-(trifluorometil)fenil)(metoxi)metil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina, 7-
ciclopropil-5-(fluoro(3-fluoro-4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina, 7-ciclopropil-5-(4-(trifluorometoxi)bencil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina y 7-ciclopropil-5-(fluoro(4-(trifluorometoxi)fenil)metil)-
30 [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina,
y cualquier combinación de los compuestos anteriores.

Realización Y1. Una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las reivindicaciones anteriores 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.

Realización Y1'. Una composición que comprende α -[3-(trifluorometil)fenil][1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina-5-metanol que tiene la siguiente estructura:



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.

Realización Y2. La composición de la realización Y1 o Y1', en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acefato,

acequinocilo, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfós-metilo, bendiocarb, benfuracarb, bensultap, bifentrina, bifenazato, bistriflurón, borato, bromantraniliprol, buprofezina, carbarilo, carbofurano, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorofluazurón, cloropraletrina, clorpirifós, clorpirifós-metilo, cromafenozida, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, ciclobutifluram, cicloprotrina, cicloxaprid, cipirifeno, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalodiamida, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciproflañilida, ciromazina, deltametrina, diafentiurón, diazinón, diclorantraniliprol, dieldrina, diflovidazina, diflubenzurón, dimeflutrina, dimehipo, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenazaquín, óxido de fenbutatina, fenitrotión, fenmezoditiaz, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpiroximato, fenpropatrina, fenvalerato, fipronil, flometoquina, flonicamida, fluaciripirim, fluazaindolinina, flubendiamida, fluclordiniliprol, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurón, flufenoxiestrobina, fluensulfona, fluhexafón, flupentiofenox, fluopiram, flupirimina, flupiradifurona, fluvalinato, tau-fluvalinato, fluxametamida, fonofós, formetanato, fostiazato, halofenozida, heptaflutrina, hexaflumurón, hexitiazox, hidrametilnón, hidropreno, imidacloprid, indazaproxamet (N-(1-metilciclopropil)-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida), indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfós, isocicloseram, kappa-teflutrina, cinopreno, lufenurón, malatión, meperflutrina, metaflumizona, metaldehído, metamidofós, metidatión, metiocarb, metomilo, metopreno, metoxiclor, metilfenozida, metoflutrina, monocrotofós, monofluorotrina, nicofluprol, 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, oxazosulfilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidón, pirimicarbo, profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbuta, piflubumida, pimetozina, pirafluprol, piretrinas (piretro), piridabeno, piridalilo, pirifluquinazón, pirimidifeno, piriminoestrobina, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, silafluofeno, espidoxamat, espinetoram, espinosad, espirobudifeno, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramat, sulprofós, sulfoxaflor, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, teflutrina, kappa-teflutrina, terbufós, tetraclorantraniliprol, tetraclorvinfós, tetrametrina, tetrametilflutrina, tetraniliprol, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap, tiosultap-sodio, tiorantraniliprol, tioazafeno, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfón, trifluenfurionato, triflumezopirim, triflumurón, ciclopirazoflor, *Bacillus sphaericus*, delta-

endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos, esencia botánica incluyendo extractos sintéticos y aceites sin refinar, supresores de diana mediados por ARN de interferencia, tiorantraniliprol y triflufenuronato.

Realización Y3. La composición de la realización Y2, en donde el al menos un compuesto o agente

5 biológicamente activo adicional se selecciona entre el grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, amitraz, avermectina, azadiractina, benfuracarb, bensultap, bifentrina, buprofezina, 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, 10 diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flometoquina, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurón, flufenoxistrobina, fluensulfona, flupiprol, flupiradifurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptaflutrina, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, lufenurón, meperflutrina, metaflumizona, metiocarb, metomilo, metopreno, metoxifeno, metoflutrina, monofluorotrina, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamilo, 15 piflubumida, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriminostrobina, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufeno, 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.

20 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 de empapado del suelo que comprende la composición de una 25 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 atrayente y opcionalmente 30 un humectante.

Realización Y9. Un dispositivo trampa para controlar una plaga de invertebrados, que comprende: la composición de cebo de la Realización Y8 y una carcasa adaptada para recibir dicha composición de cebo, en donde la carcasa tiene al menos una abertura con el 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 35 dicha composición de cebo desde un lugar exterior 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.

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

Realización Y11. La composición de la Realización Y10, en donde la composición es dispersable 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, un surco durante la siembra, un pulverizador manual, un pulverizador de mochila, un pulverizador de brazo, un pulverizador terrestre, una aplicación aérea, un 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 en un volumen ultrabajo.

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

Cabe destacar en particular que, por razones del espectro de control de plagas de invertebrados y por su importancia económica, la protección de cultivos agronómicos frente al daño o lesión provocados por las plagas de invertebrados mediante el control y el combate 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 se ponen 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 del 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.

También son dignas de mención como realizaciones de la presente divulgación las composiciones para controlar y combatir 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 del 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 y combatir 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 (por ejemplo, en forma de 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 y combatir 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 y combatir 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 y combatir 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 atrayente y opcionalmente un humectante. Las realizaciones de la divulgación también incluyen un dispositivo para controlar y combatir una plaga de invertebrados que comprende dicha composición de cebo y una carcasa adaptada para recibir dicha 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 dicha composición de cebo desde un lugar exterior a la carcasa, y en donde la carcasa está además adaptada para colocarse en o cerca de un emplazamiento de actividad posible o conocida para la plaga de invertebrados.

Las realizaciones de la divulgación también incluyen métodos para proteger una semilla frente a 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 frente a una plaga de parásitos invertebrados que comprenden administrar al animal una cantidad eficaz como parasiticida de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores.

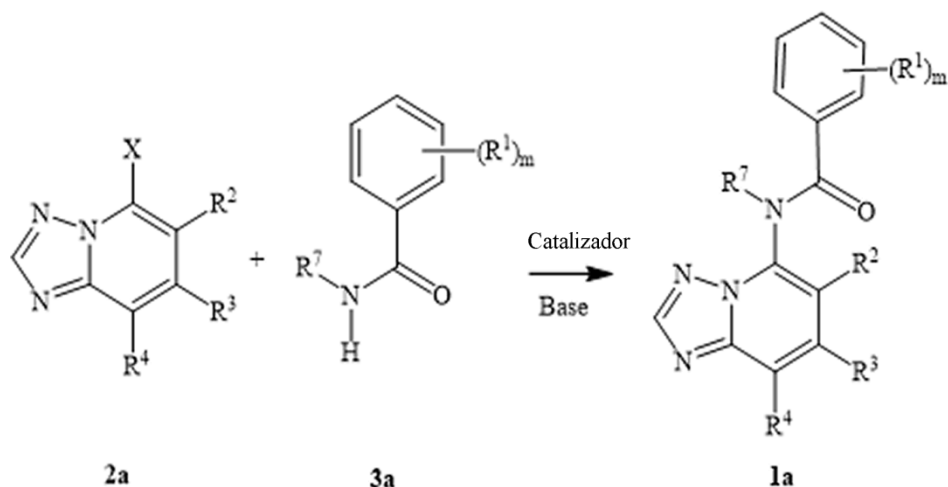
Las Realizaciones de la divulgación también incluyen métodos para controlar y combatir una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo (por ejemplo, en forma de 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 dicha composición opcionalmente 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** pueden utilizarse uno o más de los siguientes métodos y variaciones como se describen en los Esquemas 1–10. Las definiciones de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , X, LG y m en los compuestos de las fórmulas a continuación son como se han definido anteriormente en el Sumario de la divulgación, a menos que se indique otra cosa. La temperatura ambiente se define como de aproximadamente 20–25 °C.

Los compuestos de triazol de Fórmula **1a** (Fórmula **1** en donde L es NR^7CO) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 1 mediante la reacción de un compuesto heterocíclico de Fórmula **2a** (en donde X es un átomo de halógeno o un grupo saliente adecuado) con una arilamida de Fórmula **3a** en presencia de una base y un catalizador, tal como yoduro de cobre (I). Las bases habituales empleadas incluyen carbonatos tales como carbonato sódico o carbonato potásico, fosfatos tales como trifosfato potásico, y aminas tales como trietilamina. Los disolventes habituales incluyen THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO, acetonitrilo o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 1

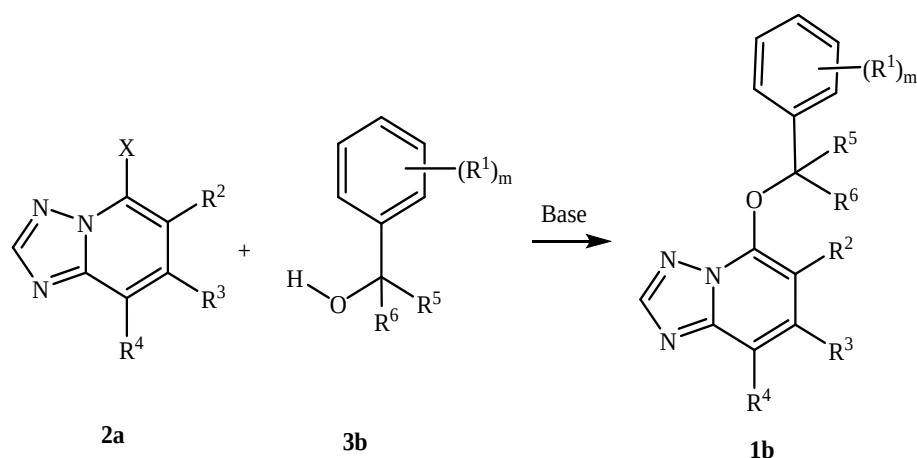


Los compuestos de triazol de Fórmula **1b** (Fórmula **1** en donde L es OCR^5R^6) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 2 mediante la reacción de un compuesto heterocíclico de Fórmula **2a** (en donde X es un átomo de halógeno o un grupo saliente adecuado) con un alcohol de Fórmula **3b** en presencia de una base y en presencia o ausencia de un catalizador, tal como yoduro de cobre (I). Las bases habituales empleadas incluyen carbonatos tales como carbonato sódico o carbonato potásico, fosfatos tales como trifosfato potásico, y aminas tales como trietilamina. Los disolventes habituales incluyen THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO, acetonitrilo o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 2

5

10



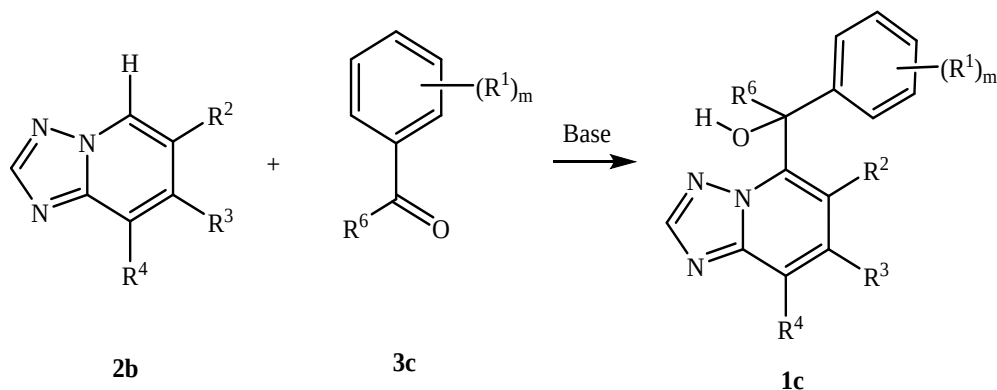
15

Los compuestos de triazol de Fórmula **1c** (Fórmula **1** en donde L es CR⁵R⁶ y R⁵ es hidroxil) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 3 mediante la reacción de un compuesto heterocíclico de Fórmula **2b** con un compuesto carbonílico de Fórmula **3c** en presencia de una base fuerte. Las bases habituales utilizadas incluyen BuLi, *s*-BuLi, *t*-BuLi, MeMgBr, MeMgCl, PhMgCl, LDA, LiHMDS, NaHMDS, KHMDS. Los disolventes habituales incluyen THF, dioxano, tolueno, dietil éter o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de -100 °C a temperatura ambiente. Los métodos y procedimientos generales para las reacciones de metalación regioselectivas son bien conocidos en la bibliografía; véase, por ejemplo, B. L. Finkelstein, *J. Org. Chem.* **1992**, 57, 5538-5540.

20

Esquema 3

25



30

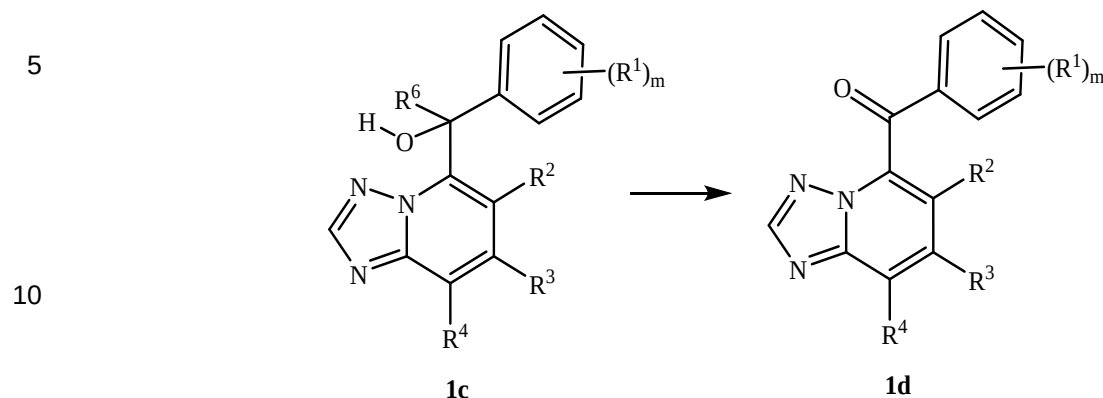
Los compuestos de triazol de Fórmula **1d** (Fórmula **1** en donde L es C(=O)) pueden prepararse como se muestra en el Esquema 4 mediante la reacción del compuesto de Fórmula **1c** (en donde R⁶ es un átomo de hidrógeno) con un agente oxidante. Los agentes oxidantes habituales utilizados incluyen aire, oxígeno, *t*-BuO₂H, NaOCl, NBS, CrO₃, KMnO₄, DMSO/Ac₂O, Cl₂/piridina. Los disolventes habituales incluyen agua, THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO, acetonitrilo o mezclas de los mismos.

35

La etapa de oxidación puede realizarse en un amplio intervalo de temperaturas, que varían de aproximadamente -70 °C a aproximadamente 200 °C. Caben destacar las temperaturas de aproximadamente 20 a aproximadamente 100 °C, que normalmente proporcionan tiempos de reacción rápidos y rendimientos de producto altos. Los métodos y procedimientos generales para oxidar un alcohol

para formar acetona son bien conocidos en la bibliografía; véase, por ejemplo, R. C. Larock, *Comprehensive Organic Transformations*, VCH, **1989**, New York, New York.

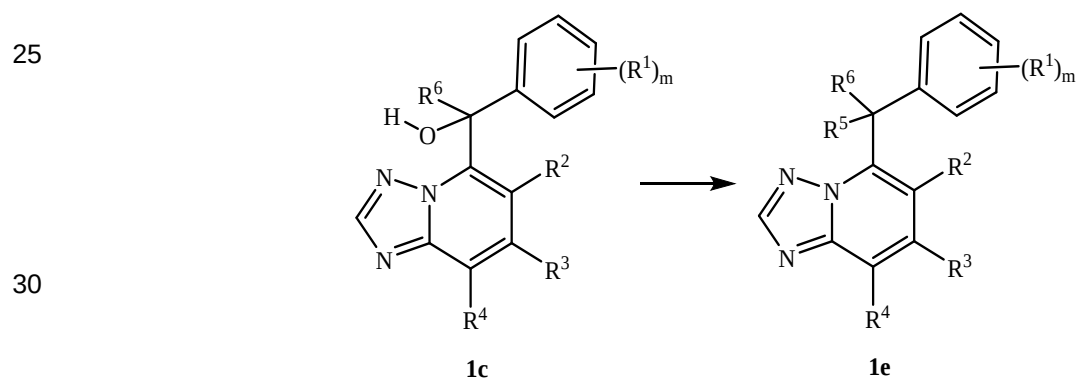
Esquema 4



15 Los compuestos de triazol de Fórmula **1e** (Fórmula **1** en donde L es CR⁵R⁶ y R⁵ no es OH) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 5 mediante la reacción de un compuesto de Fórmula **1c** con varios agentes. Los disolventes habituales incluyen agua, THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO, acetonitrilo o mezclas de los mismos.

20 Dicha transformación de grupos funcionales puede realizarse en un amplio intervalo de temperaturas, que varían de aproximadamente -70 °C a aproximadamente 200 °C. Caben destacar las temperaturas de aproximadamente 0 a aproximadamente 100 °C, que normalmente proporcionan tiempos de reacción rápidos y rendimientos de producto altos. Los métodos y procedimientos generales para convertir un alcohol en otros grupos funcionales son bien conocidos en la bibliografía; véase, por ejemplo, R. C. Larock, *Comprehensive Organic Transformations*, VCH, **1989**, New York, New York.

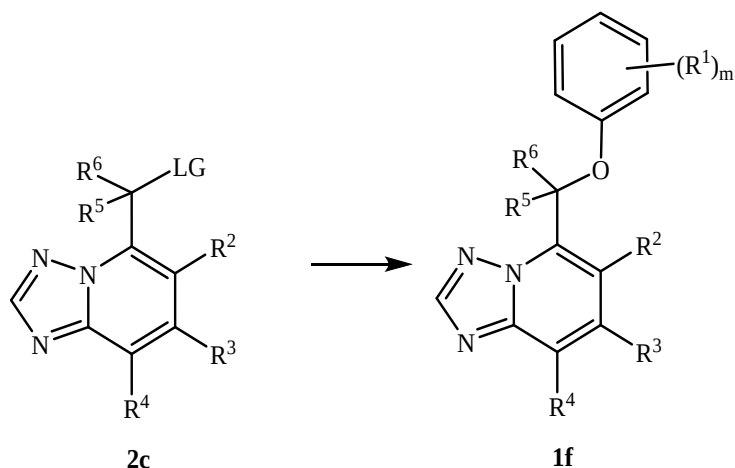
Esquema 5



35 Los compuestos de triazol de Fórmula **1f** (Fórmula **1** en donde L es CR⁵R⁶O) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 6 mediante la reacción del compuesto de Fórmula **2c** (en donde LG es un grupo saliente, tal como un átomo de halógeno, un grupo sulfonato) con los fenoles deseados, en presencia de una base. Las bases habituales empleadas incluyen carbonatos tales como carbonato sódico o carbonato potásico, fosfatos tales como trifosfato potásico, y aminas tales como trietilamina. Los disolventes habituales incluyen DCM, THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO, acetonitrilo o mezclas de los

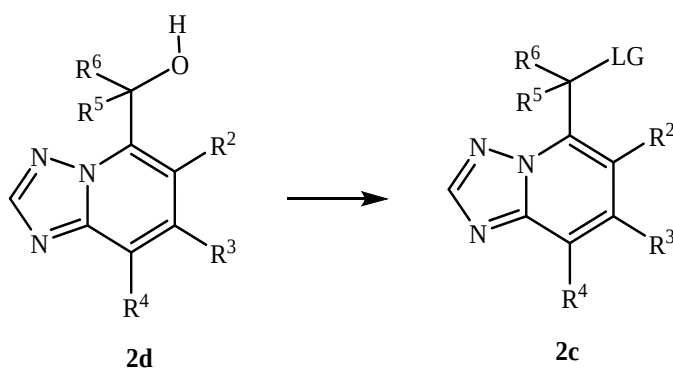
mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 6



Los compuestos de triazol de Fórmula **2c** (en donde LG es un grupo saliente, tal como un átomo de halógeno, un grupo sulfonato) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 7 mediante la reacción del compuesto de Fórmula **2d** (en donde R suele ser un grupo alquilo) con SOCl_2 , $(\text{COCl})_2$, POCl_3 , PCl_3 , PCl_5 , y PPh_3/BR^2 (para instalar un átomo de halógeno, véase *Yingyong Huaxue*, **1995**, 12(3), 82-84) o con MeSO_2Cl , ToISO_2Cl (para instalar el grupo sulfonato), y en presencia de una base. Las bases habituales empleadas incluyen carbonatos, tales como carbonato sódico o carbonato potásico, fosfatos, tales como trifosfato potásico, y bases orgánicas, tales como trietilamina y piridina. Los disolventes habituales incluyen DCM, THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO, acetonitrilo o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente.

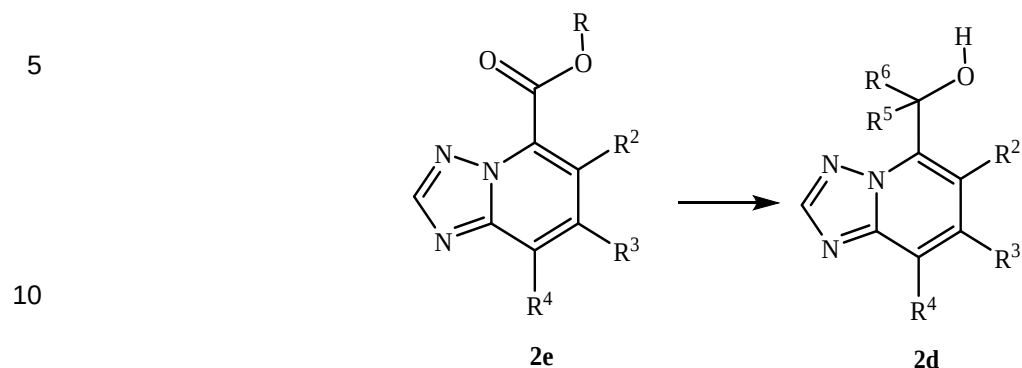
Esquema 7



Los compuestos de triazol de Fórmula **2d** se pueden preparar como se muestra en el Esquema 8 mediante la reacción del compuesto de Fórmula **2e** (en donde R suele ser un grupo alquilo) con hidruros metálicos, tales como LiAlH_4 , NaBH_4 , $\text{NaBH}_3(\text{CN})$ (cuando R^5 o R^6 o ambos son átomos de hidrógeno), o reactivos de Grignard. Los disolventes habituales incluyen DCM, THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO,

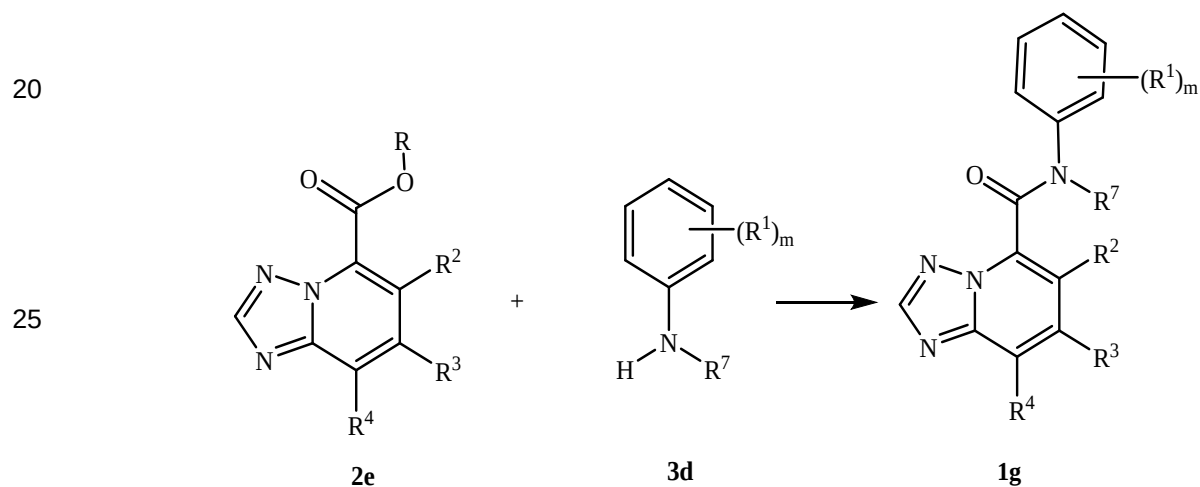
acetonitrilo, metanol o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de -70 °C al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 8

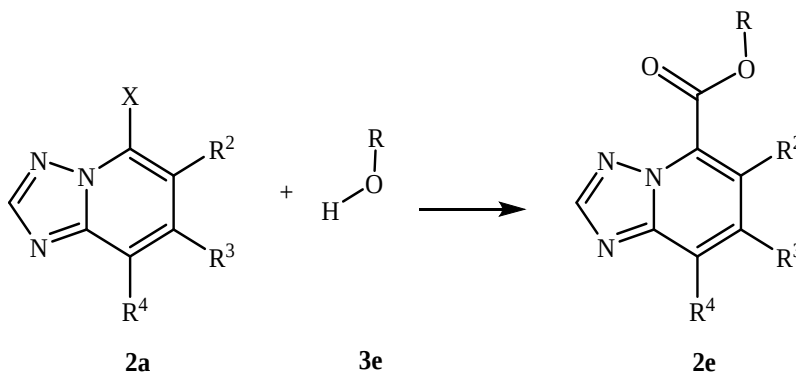


Los compuestos de triazol de Fórmula **1g** (Fórmula **1** en donde L es CONR⁷) se pueden preparar como se muestra en el Esquema 9 mediante la reacción de un compuesto heterocíclico de Fórmula **2e** (en donde R es normalmente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo) con una amina de Fórmula **3d**. Los disolventes habituales incluyen THF, dioxano, tolueno, DMF, DMSO, acetonitrilo o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de -70 °C al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 9



Los compuestos de triazol de Fórmula **2e** se pueden preparar como se muestra en el Esquema 10 mediante la reacción de carbonilación catalítica de un compuesto de Fórmula **2a** (en donde X es un grupo saliente adecuado, tal como halógenos) con monóxido de carbono y un alcohol de Fórmula **3e** en presencia de un catalizador y ligando adecuado. Los catalizadores pueden generarse a partir de metales de transición tales como Pd (por ejemplo, Pd(OAc)₂ o Pd₂(dba)₃) y ligandos mono- o bidentados tales como PPh₃, PCy₃, Pt-Bu₃, x-fos, xantfós, s-fós y dppf). Las bases habituales empleadas incluyen carbonatos, tales como carbonato sódico o carbonato de cesio, fosfatos, tales como trifosfato potásico, y aminas, tales como etildisopropilamina. Los disolventes habituales incluyen THF, dioxano, tolueno, etanol, DMF o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción habituales varían de la temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 10

Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para la preparación de compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con determinados grupos funcionales presentes en los intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de los 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 etapas de síntesis rutinarias adicionales no descritas 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 las etapas ilustradas 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 productos intermedios descritos en el presente documento pueden someterse a diversas reacciones electrofílicas, nucleofílicas, radicales, organometálicas, de oxidación y de reducción para añadir sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

Sin más detalles, se cree que un experto en la materia que utilice la descripción anterior puede utilizar la presente divulgación en toda su extensión. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos de síntesis han de interpretarse como meramente ilustrativos y no limitantes de la divulgación en modo alguno. Las etapas de los siguientes Ejemplos de síntesis ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación de síntesis global, y puede que el material de partida para cada etapa no se haya preparado necesariamente mediante una serie preparativa particular cuyo procedimiento se describa en otros Ejemplos o Etapas. 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 de líquidos a media presión en gel de sílice. Los espectros de RMN ^1H se reportan en ppm campo abajo respecto al 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 "s a" significa singlete ancho. Para los datos de espectros de masas, el valor numérico

publicado es el peso molecular del ion molecular original (M) formado por la adición de H^+ (peso molecular de 1) a la molécula para proporcionar un pico $M+1$ observado mediante espectrometría de masas utilizando ionización química a presión atmosférica (AP^+).

Los Esquemas 1 a 10 ilustran métodos para preparar compuestos de Fórmula 1 con una gran diversidad de sustituyentes. Pueden prepararse compuestos de Fórmula 1 que tienen sustituyentes distintos de los indicados particularmente para los Esquemas 1 a 10 mediante métodos generales conocidos en la técnica de la química de síntesis orgánica, que incluyen métodos análogos a los descritos para los Esquemas 1 a 10.

EJEMPLO DE SÍNTESIS 1

Preparación de (7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)-[4 (trifluorometoxi)fenil]metanol (Compuesto 15)

Se añadió gota a gota n-butilitio (2.441 ml, 1.6 M en hexanos, 3.905 mmol) a una solución de 7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina (0.4 g, 3.004 mmol) en tetrahidrofurano anhidro a $-78^\circ C$. La reacción se agitó a $-78^\circ C$ durante 30 minutos. Después, se añadió 4-(trifluorometoxi)benzaldehído (0.742 g, 3.905 mmol) como una solución en tetrahidrofurano anhidro durante 3 min. La mezcla de reacción se agitó a $-78^\circ C$ durante 15 min. Se dejó que la reacción se agitara a $25^\circ C$ durante 45 minutos y después se inactivó con NH_4Cl saturado (30 ml), se extrajo con acetato de etilo (30 ml, 3 veces) y se secó con sulfato de sodio anhidro. La mezcla se concentró al vacío y se purificó mediante cromatografía en columna normal (columna de sílice, acetato de etilo al 35-70 % en hexano) para dar (7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-5-il)-[4-(trifluorometoxi)fenil]metanol (629 mg) como un sólido, un compuesto de la presente invención. ^1H RMN (600 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 8.31 (s, 1H), 7.55 (d, $J = 9$ Hz, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.25 (m, 2H, superpuesto con $CDCl_3$), 6.58 (s, 1H), 6.32 (d, $J = 5$ Hz, 1H), 4.81 (s, $J = 5$ Hz, 1H), 2.45 (s, 3H).

EJEMPLO DE SÍNTESIS 2

Preparación de 5-[fluoro-[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina (Compuesto 8)

Se añadieron a un vial 100 mg (0.309 mmol) del compuesto preparado en el Ejemplo de Síntesis 1 y cloruro de metileno (3 ml). A continuación, se añadió trifluoruro de dietilaminoazufre (0.1 g, 0.619 mmol) a $0^\circ C$ y la mezcla se dejó en agitación durante la noche a $25^\circ C$. Se añadió otro medio equivalente de trifluoruro de dietilaminoazufre al vial de reacción para asegurar el consumo del sustrato. Una vez que se completó la reacción como se muestra por TLC, la reacción se inactivó con $NaHCO_3$ sat. (20 ml) y se diluyó con diclorometano (20 ml). La mezcla se extrajo con diclorometano (3x, 20 ml), se concentró al vacío y se purificó mediante cromatografía en columna en fase normal (columna de sílice, 15-50 % de ion acetato de etilo, hexano) para dar 5-[fluoro-[4-(trifluorometoxi)fenil]metil]-7-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina (56 mg), un compuesto de la presente invención. ^1H RMN (600 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 8.26 (s, 1H), 7.59 (d, $J = 8$ Hz, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.24 (d, $J = 8$ Hz, 2H), 7.15 (d, $J = 45$ Hz, 1H), 7.08 (s, 1H), 2.54 (s, 3H)

Tablas 1–6. A se refiere a la estructura mostrada a continuación.

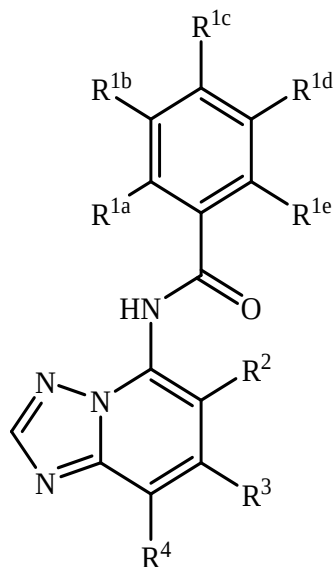


TABLA 1

$R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2, R^3$ y R^4 son H

R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}	R^{1a}
H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2, R^3$ y R^4 son H

R^{1b}	R^{1b}	R^{1b}	R^{1b}	R^{1b}	R^{1b}
H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo

5	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	c-Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R², R³ y R⁴ son H

10	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
15	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	c-Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R³ y R⁴ son H; R² es Me

25	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
30	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	c-Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^3$ y R^4 son H; R^2 es Me

	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
5	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
10	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
15	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R^3$ y R^4 son H; R^2 es Me

	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
20	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
25	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluoro-p
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
30	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^3$ y R^4 son H; R^2 es Cl

	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
35	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo

5	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	c-Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R³ y R⁴ son H; R² es Cl

10	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
15	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
20	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	c-Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R³ y R⁴ son H; R² es Cl

25	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
30	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
35	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	c-Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^3$ y R^4 son H; R^2 es MeO

	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
5	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
10	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	
15						

$R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^3$ y R^4 son H; R^2 es MeO

	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
20	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
25	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	
30						

$R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R^3$ y R^4 son H; R^2 es MeO

	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
35	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo

5	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R² y R⁴ son H; R³ es Me

10	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
15	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
20	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R² y R⁴ son H; R³ es Me

25	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}	<u>R</u> ^{1b}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
30	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
35	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^4 son H; R^3 es Me

	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
5	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
10	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

15

$R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^4 son H; R^3 es Cl

	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
20	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
25	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

30

$R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^4 son H; R^3 es Cl

	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
35	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo

5	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R² y R⁴ son H; R³ es Cl

10	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}	<u>R</u> ^{1c}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
15	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
20	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R² y R⁴ son H; R³ es MeO

25	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}	<u>R</u> ^{1a}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
30	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
35	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^4 son H; R^3 es MeO

	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
5	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
10	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

15

$R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^4 son H; R^3 es MeO

	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
20	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
25	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

30

$R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es Me

	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
35	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo

5	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$\underline{R}^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es Me

10	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
15	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
20	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$\underline{R}^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es Me

25	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
30	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
35	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es Cl

	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
5	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
10	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

15

$\underline{R}^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es Cl

	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
20	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
25	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

30

$\underline{R}^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es Cl

	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$	$\underline{R}^{1c}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
35	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo

5	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1b}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es MeO

10	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$	$\underline{R}^{1a}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
15	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
20	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$\underline{R}^{1a}, R^{1c}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es MeO

25	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$	$\underline{R}^{1b}$
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
30	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
35	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

$R^{1a}, R^{1b}, R^{1d}, R^{1e}, R^2$ y R^3 son H; R^4 es MeO

	R^{1c}	R^{1c}	R^{1c}	R^{1c}	R^{1c}	R^{1c}
	H	<i>t</i> -Bu	NO ₂	O- <i>i</i> -Pr	S(O)CF ₃	2-fluorofenilo
5	F	CF ₃	OH	OCH ₂ CH=CH ₂	SO ₂ CF ₃	3-fluorofenilo
	Cl	CH ₂ F	OCOCH ₃	OCH ₂ C≡CH	CO ₂ Me	4-fluorofenilo
	Br	CHF ₂	NHMe	O- <i>c</i> -Pr	CO ₂ Et	<i>N</i> -Me-4-pirazolilo
	I	OMe	NMe ₂	OCF ₃	ciano	3-Me-5-isoxazolilo
10	Me	OEt	NHCHO	OCHF ₂	C(O)NHMe	4-fluorofenoxilo
	Et	O- <i>n</i> -Pr	NHAc	OCH ₂ CF ₃	C(O)NMe ₂	
	Pr	OPh	NMeAc	SF ₅	C(=NOMe)Me	
	<i>i</i> -Pr	CH=CH ₂	COMe	SCF ₃	C(=NOEt)Me	
15	<i>c</i> -Pr	C≡CH	SiMe ₃	SCHF ₂	fenilo	

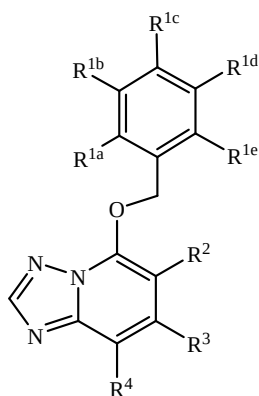


TABLA 2

La Tabla 2 es idéntica a la Tabla 1, con la excepción de que la estructura genérica se cambia a la estructura anterior.

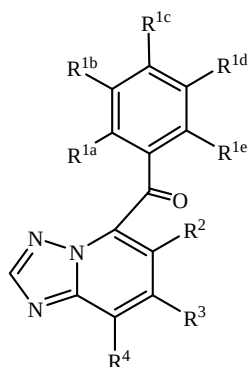
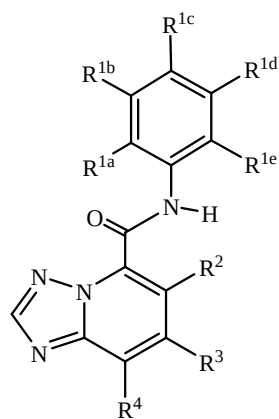
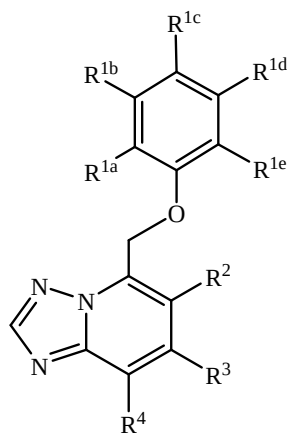


TABLA 3

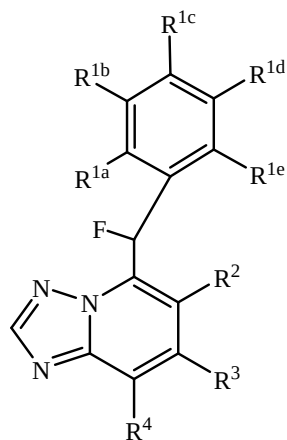
La Tabla 3 es idéntica a la Tabla 1, con la excepción de que la estructura genérica se cambia a la estructura anterior.

**TABLA 4**

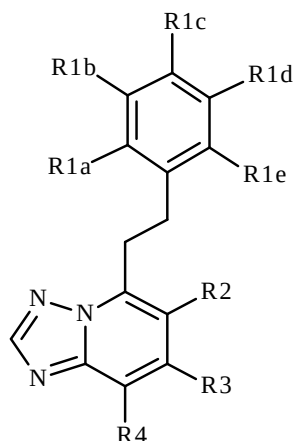
La Tabla 4 es idéntica a la Tabla 1, con la excepción de que la estructura genérica se cambia a la estructura anterior.

**TABLA 5**

La Tabla 5 es idéntica a la Tabla 1, con la excepción de que la estructura genérica se cambia a la estructura anterior.

**TABLA 6**

La Tabla 6 es idéntica a la Tabla 1, con la excepción de que la estructura genérica se cambia a la estructura anterior.

**TABLA 7**

La Tabla 7 es idéntica a la Tabla 1, con la excepción de que la estructura genérica se cambia a la estructura anterior.

Un compuesto de esta divulgación se utilizará generalmente como principio 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 portador. 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 pueden espesarse para proporcionar 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 formadoras de película 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 tanto de una formulación de concentrado emulsionable como de una formulación granular seca. Las composiciones de concentración elevada se usan principalmente como intermedios para su formulación adicional.

Las formulaciones pulverizables suelen extenderse en un medio adecuado antes de la pulverización. Tales formulaciones líquidas y sólidas se formulan de modo 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 pueden mezclarse 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 pueden dosificarse directamente en los sistemas de riego por goteo o dosificarse en el surco durante la plantación. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse a las semillas de cultivos y a otra vegetación deseable como tratamientos de semillas antes de su 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 tensioactivo dentro de los siguientes intervalos aproximados que suman en total el 100 por ciento en peso.

	Porcentaje en peso		
	<u>Principio activo</u>	<u>Diluyente</u>	<u>Tensioactivo</u>
Gránulos, Comprimidos y Polvos	0.001–90	0–99.999	0–15
Dispersables y Solubles en Agua			
20 Dispersiones, Suspensiones, Emulsiones y Soluciones Oleosas (incluidos los Concentrados Emulsionables)	1–50	40–99	0–50
Polvos finos	1–25	70–99	0–5
25 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. Los diluyentes sólidos típicos se describen en Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2^{da} Ed., Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey.

Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida), limoneno, sulfóxido de dimetilo, *N*-alquilpirrolidonas (por ejemplo, *N*-metilpirrolidinona), alquilfosfatos (por ejemplo, trietilfosfato), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, 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 tetrahidrofurfurílico, alcohol diacetónico, cresol y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (normalmente

C_6-C_{22}), tales como aceites de semillas y frutos vegetales (por ejemplo, aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, semilla de uva, cártamo, semilla de algodón, soja, colza, coco y palmiste), grasas de origen animal (por ejemplo, sebo de vacuno, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados) en 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 habituales en Marsden, *Solvents Guide*, 2ª 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 (conocidos también como "agentes tensioactivos") generalmente modifican y, la mayoría de las veces, 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 sin limitación: 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 los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como los aceites de soja, 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 los mismos); 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 los mismos); ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol, derivados a base de lanolina, ésteres polietoxilados tales como ésteres de ácidos grasos y sorbitano polietoxilados, ésteres de ácidos grasos y sorbitol polietoxilados, y ésteres de ácidos grasos y glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitano

tales como ésteres de sorbitano; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros aleatorios, copolímeros de bloques, resinas alquílicas de PEG (polietilenglicol), polímeros de injerto o peine y polímeros en estrella; polietilenglicoles (PEG); ésteres de ácidos grasos y polietilenglicol; tensioactivos a base de silicona; y derivados de azúcares tales como ésteres de sacarosa, poliglucósidos de alquilo y polisacáridos de alquilo.

5 Los tensioactivos aniónicos útiles incluyen, pero no se limitan a: ácidos alquilarilsulfónicos y sus sales; etoxilatos de alquilfenol o alcohol carboxilado; derivados de sulfonato de difenilo; 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 alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos a base de proteínas; derivados de sarcosina; sulfato de éter estiril fenólico; 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*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno, y dodecilo y tridecibencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados
10
15 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, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, 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.
20

También son útiles para las composiciones de la presente las mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o las mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Se divulgan tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados en diversidad de referencias publicadas que incluyen *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, ediciones anuales estadounidenses e internacionales 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.
25

Las composiciones de esta divulgación también pueden contener auxiliares y aditivos de formulación, conocidos por los expertos en la materia como auxiliares de formulación (algunos de los cuales puede considerarse que también actúan como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Dichos auxiliares 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 el envase (antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (tintes/dispersiones de pigmentos), la eliminación con el lavado (formadores de película o adhesivos), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de la formulación. Los formadores de película
30
35

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 estadounidenses e internacionales 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 en las presentes composiciones disolviendo el principio activo en un disolvente o moliendo en un diluyente líquido o seco. Las soluciones, incluyendo los concentrados emulsionables, pueden prepararse mezclando simplemente 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 tras la dilución con agua. Las suspensiones de principios activos, con diámetros de partícula de hasta 2000 μm , pueden molerse en húmedo usando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio inferiores a 3 μm . Las suspensiones espesas acuosas pueden convertirse en concentrados en suspensión acabados (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3,060,084) o procesarse 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 unos diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 μm . Los polvos finos y los polvos pueden prepararse mezclando y, por lo general, moliendo (tal como con un molino de martillos o un molino por energía de un fluido). Los gránulos y los microgránulos pueden prepararse 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 siguientes, y el documento WO 91/13546. Los microgránulos se pueden preparar como se describe en el documento U.S. 4,172,714. Se pueden preparar gránulos dispersables en agua e hidrosolubles como se enseña 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 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., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120-133. Véanse también U.S. 3,235,361, Col. 6, línea 16 hasta Col. 7, línea 19 y Ejemplos 10-41; U.S. 3,309,192, Col. 5, línea 43 hasta Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; U.S. 2,891,855, Col. 3, línea 66 hasta Col. 5, línea 17 y 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*, 8va Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

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–C. Sin entrar en más detalles, se cree que un experto en la materia, empleando la descripción anterior, puede sacar el máximo provecho de la presente divulgación. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos han de interpretarse como

5 meramente ilustrativos y no limitantes de la divulgación en modo alguno. Los porcentajes son en peso, excepto donde se indique otra cosa.

Ejemplo A

Concentrado de Alta Resistencia

	compuesto 1	98.5%
10	aerogel de sílice	0.5%
	sílice fina amorfa sintética	1.0%

Ejemplo B

Polvo humectable

15	compuesto 4	65.0%
	dodecilfenol polietilenglicol éter	2.0%
	ligninsulfonato de sodio	4.0%
	silicoaluminato de sodio	6.0%
	montmorillonita (calcinada)	23.0%

20

Ejemplo C

Gránulo

	compuesto 8	10.0%
	gránulos de atapulgita (materia poco volátil, 0.71/0.30 mm; U.S.S. Tamices N.º 25-50)	90.0%

25

Ejemplo D

Microgránulos Extruidos

	compuesto 10	25.0%
	sulfato de sodio anhidro	10.0%
	ligninsulfonato de calcio en bruto	5.0%
30	alquilnaftalenosulfonato de sodio	1.0%
	bentonita de calcio/magnesio	59.0%

Ejemplo E

Concentrado emulsionable

	compuesto 15	10.0%
35	hexoleato de sorbitol polioxietilenado	20.0%
	éster metílico de ácidos grasos C ₆ -C ₁₀	70.0%

Ejemplo F**Microemulsión**

5	compuesto 2	5.0%
	copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30.0%
	alquilpoliglicósido	30.0%
	monooleato de glicerilo	15.0%
	agua	20.0%

Ejemplo G**Tratamiento de semillas**

10	compuesto 7	20.00%
	copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5.00%
	cera de ácido montánico	5.00%
	ligninsulfonato de calcio	1.00%
15	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%

Ejemplo H

20	<u>Barra fertilizante</u>	
	compuesto 9	2.5%
	copolímero de pirrolidona-estireno	4.8%
	16-etoxilato de triestirilfenilo	2.3%
25	talco	0.8%
	almidón de maíz	5.0%
	fertilizante de liberación lenta	36.0%
	caolín	38.0%
	agua	10.6%

Ejemplo I

30	<u>Concentrado en suspensión</u>	
	compuesto 13	35%
	copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4.0%
	copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol	1.0%
35	polímero acrílico de estireno	1.0%
	goma xantana	0.1%
	propilenglicol	5.0%
	antiespumante a base de silicona	0.1%
	1,2-benzoisotiazolin-3-ona	0.1%

	agua	53.7%
--	------	-------

Ejemplo J**Emulsión en agua**

	compuesto 11	10.0%
5	copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4.0%
	copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol	1.0%
	polímero acrílico de estireno	1.0%
	goma xantana	0.1%
	propilenglicol	5.0%
10	antiespumante a base de silicona	0.1%
	1,2-benzisotiazolin-3-ona	0.1%
	hidrocarburo aromático a base de petróleo	20.0
	agua	58.7%

Ejemplo K

15	<u>Dispersión en aceite</u>	
	compuesto 12	25%
	hexaoleato de sorbitol polioxietileno	15%
	arcilla bentonita modificada orgánicamente	2.5%
	éster metílico de ácido graso	57.5%

Ejemplo L**Suspoemulsión**

	compuesto 3	10.0%
	imidacloprid	5.0%
	copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4.0%
25	copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol	1.0%
	polímero acrílico de estireno	1.0%
	goma xantana	0.1%
	propilenglicol	5.0%
	antiespumante a base de silicona	0.1%
30	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 salud pública o salud animal. Los expertos en la materia apreciarán que no todos los compuestos son igual de eficaces contra todas las fases de crecimiento de todas las plagas.

Por lo tanto, los presentes 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. Algunos 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 de proceso de los productos cosechados. Las plantas transgénicas pueden modificarse para que expresen múltiples 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*, tales 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 por lo tanto la expresión fenotípica o la eficacia de los rasgos o aumentando la eficacia de control de plagas de invertebrados de los compuestos y composiciones de la presente. En particular, los compuestos y composiciones de la presente 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, por ejemplo, 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 barras o comprimidos. Las formulaciones sólidas que comprenden una composición

fertilizante pueden prepararse mezclando el compuesto o la composición de la presente divulgación con la composición fertilizante junto con los ingredientes de formulación y, después, preparando la formulación mediante métodos tales como granulación o extrusión. Como alternativa, pueden prepararse 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, por ejemplo, gránulos, pequeñas barras o comprimidos, y después 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 presentes compuestos y composiciones también incluyen la protección de la salud humana y animal mediante el control y el combate de plagas de invertebrados que son parásitos o transmiten enfermedades infecciosas. El control y el combate de los parásitos de animales incluyen el control y el combate de 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). Algunas plagas parasitarias externas o transmisoras de enfermedades incluyen, por ejemplo, niguas, garrapatas, piojos, mosquitos, moscas, ácaros y pulgas. Algunos parásitos internos incluyen gusanos del corazón, anquilostomas y helmintos. Los compuestos y las composiciones de la presente divulgación son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de la infestación o infección por parásitos en animales. Los compuestos y las composiciones de la presente divulgación son particularmente adecuados para combatir plagas externas parasitarias o transmisoras de enfermedades. Los compuestos y las composiciones de la presente divulgación son adecuados para combatir parásitos que infestan a animales de explotaciones agrícolas, 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.

Los 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, orugas de vaina, 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), el barrenador del tallo de la caña de azúcar (*Chilo infuscatellus* Snellen), el pequeño barrenador del tomate (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), enrollador verde de la hoja (*Cnaphalocrocis medinalis*), lepidóptero de la uva (*Desmia funeralis* Hübner), barrenador (*Diaphania nitidalis* Stoll), gusano del centro de la col (*Helluala hydralis* Guenée), barrenador amarillo del tallo (*Scirpophaga incertulas* Walker), barrenador blanco del tallo (*Scirpophaga innotata* Walker), barrenador superior de los brotes (*Scirpophaga nivella* Fabricius), barrenador oscuro del arroz (*Chilo polychrysus* Meyrick), barrenador rayado del arroz (*Chilo suppressalis* Walker), oruga del racimo de la col (*Crociodolomia binotalis* Zeller); enrolladores de hojas, gusanos de las yemas, gusanos de las semillas y gusanos de la fruta de la familia *Tortricidae* (por ejemplo, polilla de las manzanas (*Cydia pomonella* Linnaeus), polilla de la uva (*Paralobesia viteana* Clemens), polilla oriental de la fruta (*Grapholita molesta* Busck), falsa polilla de la manzana y de los cítricos (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), barrenador de los cítricos (*Gymnandrosoma aurantianum* Lima), enrollador de la hoja de banda roja (*Argyrotaenia velutinana* Walker), enrollador de la hoja de banda oblicua (*Choristoneura rosaceana* Harris), polilla marrón clara del manzano (*Epiphyas postvittana* Walker), polilla europea de la uva (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), polilla del brote del manzano (*Pandemis pyrusana* Kearfott), rodillo omnívoro de las hojas (*Platynota stultana* Walsingham), tortrix barrado de los frutales (*Pandemis cerasana* Hübner), tortrix marrón del manzano (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); y muchos otros lepidópteros de importancia económica (por ejemplo, polilla de la espalda de diamante (*Plutella xylostella* Linnaeus), gusano rosado de la cápsula (*Pectinophora gossypiella* Saunders), polilla gitana (*Lymantria dispar* Linnaeus), barrenador del melocotonero (*Carposina niponensis* Walsingham), barrenador de la rama del melocotonero (*Anarsia lineatella* Zeller), gusano de la patata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minador teniforme moteado (*Phyllonorycter blancardella* Fabricius), minador asiático del manzano (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), minador del arroz (*Lerodea eufala* Edwards), minador del

manzano (*Leucoptera scitella* Zeller)); huevos, ninfas y adultos del orden Blattodea, incluyendo las cucarachas de las familias *Blattellidae* y *Blattidae* (por ejemplo, cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blattella asahinai* Mizukubo), cucaracha alemana (*Blattella germanica* Linnaeus), cucaracha de banda marrón (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha marrón (*Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius)), cucaracha marrón ahumada (*Periplaneta fuliginosa* Service), cucaracha australiana (*Periplaneta australasiae* Fabr.), cucaracha de la langosta (*Nauphoeta cinerea* Olivier) y cucaracha lisa (*Symploce pallens* Stephens)); huevos, alimentación foliar, alimentación de frutos, alimentación de raíces, alimentación de semillas y alimentación de tejidos vesiculares de larvas y adultos del orden Coleoptera, incluyendo los gorgojos de las familias *Anthribidae*, *Bruchidae* y *Curculionidae* (por ejemplo, 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)), picudo del césped azul (*Listronotus maculicollis* Dietz), picudo del césped azul (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), escarabajo de la caza (*Sphenophorus venatus vestitus*), escarabajo de Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); escarabajos pulga, escarabajos del pepino, gusanos de la raíz, escarabajos de la hoja, escarabajos de la papa y minadores de la familia *Chrysomelidae* (por ejemplo, escarabajo de la papa de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), gusano de la raíz del maíz occidental (*Diabrotica virgifera* LeConte)); chafardos y otros escarabajos de la familia *Scarabaeidae* (por ejemplo, escarabajo japonés (*Popillia japonica* Newman), escarabajo oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse), el pinzón enmascarado septentrional (*Cyclocephala borealis* Arrow), el pinzón enmascarado meridional (*Cyclocephala immaculata* Olivier o *C. lurida* Bland), escarabajo pelotero y gusano blanco (*Aphodius* spp.), ataenius negro del césped (*Ataenius spretulus* Haldeman), escarabajo verde de junio (*Cotinis nitida* Linnaeus), escarabajo asiático de jardín (*Maladera castanea* Arrow), escarabajos de mayo/junio (*Phyllophaga* spp.) y el chicharro europeo (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); escarabajos de alfombra de la familia *Dermestidae*; gusanos de 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* (por ejemplo, tijereta europea (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijereta negra (*Chelisoches morio* Fabricius)); huevos, individuos inmaduros, adultos y ninfas del orden *Hemiptera* tales como, insectos de plantas de la familia *Miridae*, cigarras de la familia *Cicadidae*, saltahojas (por ejemplo *Empoasca* spp.) de la familia *Cicadellidae*, chinches (por ejemplo, *Cimex lectularius* Linnaeus) de la familia *Cimicidae*, saltaplantass de las familias *Fulgoridae* y *Delphacidae*, membranácidos de la familia *Membracidae*, psíldos 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 (por ejemplo, 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 arañas rojas y ácaros rojos de la familia *Tetranychidae* (por ejemplo, ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi* Koch), araña roja de dos manchas (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro de McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); ácaros planos de la familia *Tenuipalpidae* (por ejemplo, ácaro plano de los cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); ácaros de la roya y del cogollo 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 foliculares de la familia *Demodicidae*, ácaros del grano de la familia *Glycyphagidae*; garrapatas de la familia *Ixodidae*, comúnmente conocidas como garrapatas duras (por ejemplo, garrapata del ciervo (*Ixodes scapularis* Say), garrapata australiana de la parálisis (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata americana del perro (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata de la estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) y garrapatas de la familia *Argasidae*, comúnmente conocidas como garrapatas blandas (por ejemplo, garrapata de la fiebre recurrente (*Ornithodoros turicata* Duges), garrapata común de las aves (*Argas radiatus* Railliet)); ácaros de la sarna y del prurito de las familias *Psoroptidae*, *Pyemotidae* y *Sarcoptidae*; huevos, adultos e inmaduros del orden Orthoptera, incluidos saltamontes, langostas y grillos (por ejemplo, saltamontes migratorios (por ejemplo, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), saltamontes americanos (por ejemplo, *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forsskal), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), langosta de los arbustos (*Zonocerus* spp.), el grillo doméstico (*Acheta domesticus* Linnaeus), el grillo topo (por ejemplo, grillo topo leonado (*Scapteriscus vicinus* Scudder) y grillo topo del sur (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); huevos, adultos e inmaduros del orden Diptera, incluyendo los minadores (por ejemplo, *Liriomyza* spp. tales como el minador de la serpentina de las hortalizas (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquitos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas de la frit (por ejemplo, *Oscinella frit* Linnaeus), gusanos del suelo, moscas domésticas (por ejemplo, *Musca domestica* Linnaeus), moscas domésticas menores (por ejemplo, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de los establos (por ejemplo, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas de la cara, moscas de los cuernos, moscardones (por ejemplo, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) y otras plagas de moscas muscoideas, tábanos (por ejemplo, *Tabanus* spp.), moscas de los bots (por ejemplo, *Gasterophilus* spp., *Oestrus* spp.), larvas del ganado (por ejemplo, *Hypoderma* spp.), moscas de los ciervos (por ejemplo, *Chrysops* spp.), zancudos (por ejemplo, *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otros Brachycera, mosquitos (por ejemplo, *Aedes* spp, *Anopheles* spp., *Culex* spp.), moscas negras (por ejemplo, *Prosimulium* spp, *Simulium* spp.), jejenes picadores, moscas de la arena, esciáridos y otros Nematocera; huevos, adultos e inmaduros del orden Thysanoptera, incluyendo trips de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman), trips de las flores (*Frankliniella* spp.), y otros trips de 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 faraona (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), hormiga de fuego pequeña (*Wasmannia auropunctata* Roger), hormiga de fuego (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga de fuego roja importada (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga de las aceras (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), hormiga de los maizales (*Lasius alienus* Förster) y hormiga doméstica olorosa (*Tapinoma sessile* Say). Otros himenópteros, incluyendo las abejas (incluyendo las abejas carpinteras), avispones, avispas amarillas, avispas y moscas de sierra (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); insectos plaga del orden Isoptera, incluyendo las termitas del orden Termitidae (por ejemplo, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (por ejemplo, *Cryptotermes* sp.), y las familias Rhinotermitidae (por ejemplo, *Reticulitermes* sp, *Coptotermes* sp, *Heterotermes tenuis* Hagen), la termita subterránea oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), la termita subterránea occidental (*Reticulitermes hesperus* Banks), termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), termita de madera seca de las Indias Occidentales (*Incisitermes immigrans* Snyder), termita del polvo (*Cryptotermes brevis* Walker), termita de la madera seca (*Incisitermes snyderi* Light), termitas subterráneas del sudeste (*Reticulitermes virginicus* Banks), termitas de la madera seca del oeste (*Incisitermes minor* Hagen), termitas arborícolas, tales como *Nasutitermes* sp. y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden Thysanura, tales como el pez de plata (*Lepisma saccharina* Linnaeus) y el escarabajo de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos del orden Mallophaga incluyendo el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), el piojo del cuerpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), piojo del pollo (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), piojo mordedor del perro (*Trichodectes canis* De Geer), piojo de la pelusa (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de las ovejas (*Bovicola ovis* Schrank), piojo de nariz corta del ganado (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), el piojo del ganado de nariz larga (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos parásitos chupadores y masticadores que atacan al hombre y a los animales; las plagas de insectos del orden Siphonoptera, incluyendo la pulga oriental de la rata (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), la pulga del gato (*Ctenocephalides felis* Bouché), la pulga del perro (*Ctenocephalides canis* Curtis) pulga de la 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).

Los ejemplos de plagas de invertebrados del grano almacenado incluyen el barrenador mayor del grano (*Prostephanus truncatus* Horn), barrenador menor del grano (*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 del grano (*Cryptolestis ferrugineus* Stephens).

Los compuestos de la presente divulgación pueden tener actividad en miembros de las clases *Nematoda*, *Cestoda*, *Trematoda* y *Acanthocephala*, incluidos miembros económicamente importantes de los órdenes *Strongylida*, *Ascaridida*, *Oxyurida*, *Rhabditida*, *Spirurida* y *Enoplida*, tales como, pero sin limitarse a, 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 invención 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), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (enrollador de hojas del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (gusano de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (gusano del pasto azul), *Cydia pomonella* Linnaeus (palomilla de la manzana), *Earias insulana* Boisduval (gusano espinoso), *Earias vittella* Fabricius (gusano manchado del cogollo), *Helicoverpa armigera* Hübner (oruga americana), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano del maíz), *Heliothis virescens* Fabricius (gusano del cogollo del tabaco), *Herpetogramma licarsalis* 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 guisante), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón del frijol negro), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana), *Aphis spiraeicola* Patch (pulgón de la espora), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (pulgón de la calabaza), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón del trigo ruso), *Dysaphis plantaginea* Passerini (pulgón de la manzana rosada), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón de la lana), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón de la mealia), *Lipaphis pseudobrassicae* Davis (pulgón de la palma), *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón de la rosa), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón del melocotón, pulgón verde del melocotón), *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 cereza y la avena del pájaro), *Schizaphis graminum* Rondani (áfido 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 marrón de los cítricos); *Adelges* spp. (adelgidos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (pecan phylloxera); *Bemisia tabaci* Gennadius (pulgón blanco del tabaco, pulgón blanco del camote), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (pulgón blanco de la plata), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca del invernadero); *Empoasca fabae* Harris (saltamontes de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallén (saltamontes marrones más pequeños), *Macrosteles quadrilineatus* Forbes (saltamontes del aster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltamontes del arroz verde), *Nephotettix nigropictus* Stål (saltamontes del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (saltamontes marrones), *Peregrinus maidis* Ashmead (saltamontes del maíz), *Sogatella furcifera* Horváth (saltamontes del racimo blanco), *Tagosodes orizicolus* Muir (delfacido del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (saltamontes de la manzana blanca), *Erythroneura* spp. (saltamontes de la uva); *Magicidada septendecim* Linnaeus (cicada periódica); *Icerya purchasi* Maskell (cochinilla acanalada algodonosa), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (cochinilla de San José); *Planococcus citri* Risso (cochinilla harinosa de los cítricos); *Pseudococcus* spp. (complejo de otras cochinillas harinosas); *Cacopsylla pyricola* Foerster (psila del peral), *Trioza diospyri* Ashmead (psila del caqui).

Los compuestos de esta divulgación también tienen actividad sobre miembros del orden *Hemiptera* que incluyen: *Acrosternum hilare* Say (chinche hedionda verde), *Anasa tristis* De Geer (chinche de la calabaza), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinche verdadera), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche de las camas) *Corythucha gossypii* Fabricius (chinche de encaje del algodón), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (manchador 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 marmolada), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de semillas de pino con patas en forma 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* (por ejemplo, *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* (por ejemplo, *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 y combatir los trips occidentales de las flores (*Frankliniella occidentalis*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar y combatir el saltahoja de la patata (*Empoasca fabae*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar y combatir el pulgón del melón y del algodón (*Aphis gossypii*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar y combatir el pulgón

verde del melocotonero (*Myzus persicae*). Cabe destacar el uso de compuestos de esta divulgación para controlar y combatir la mosca blanca del boniato (*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 crece 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 se suele aplicar directamente a la planta de cultivo o su semilla, también puede aplicarse al emplazamiento de la planta de cultivo, es decir, el entorno de la planta de cultivo, en particular 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 crece 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 como resultado 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, humedad subóptima o compuestos químicos fitotóxicos.

Los compuestos de la presente divulgación pueden aumentar el vigor de las plantas tratadas en comparación con las plantas sin tratar al destruir o prevenir de otro modo la alimentación de plagas de invertebrados fitófagos en el entorno de las plantas. En ausencia de dicho 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 las plantas 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 comprende uno o más aspectos adversos para que la planta alcance el potencial genético pleno 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 en donde la planta de cultivo se cultiva en un entorno que comprende una cantidad de humedad inferior a la ideal para estimular 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 choclo (maíz). También cabe destacar un método para aumentar el vigor de una planta de cultivo en donde el cultivo es soja.

Los compuestos de esta divulgación también pueden mezclarse con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos diferentes que incluyen insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento tales como inhibidores de la muda de insectos y estimulantes del enraizamiento, quimioesterilizantes, compuestos semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias entomopatógenas, virus u hongos para formar un plaguicida multicomponente que ofrece un espectro incluso más amplio de utilidad agronómica y no agronómica. Por lo 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 del 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 pueden formularse junto con los compuestos de la presente, que incluyen los compuestos de Fórmula 1, para formar una premezcla, o los otros compuestos o agentes biológicamente activos pueden formularse por separado de los compuestos de la presente, que incluyen los compuestos de Fórmula 1 y las dos formulaciones combinadas juntas antes de la aplicación (por ejemplo, en un tanque de pulverización) o, como alternativa, aplicadas sucesivamente.

Ejemplos de tales compuestos o agentes biológicamente activos con los que se pueden formular los compuestos de esta divulgación son los insecticidas. Tales como abamectina, acefato, acequinocil, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropen (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, carbaril, 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), ciclotrina, 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), ciflumetofén, 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, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, óxido de fenbutatina, fenitrotión, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronil, flometoquin (carbonato de 2-etil-3,7-dimetil-6-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-4-quinolinil metilo), flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurón, flufenoxistrobina ((α E)-2-[[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]metil]- α -(metoximetilen)bencenoacetato de metilo), fluensulfona (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)sulfonil]-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, hidrametilnon, 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, metiodiocarb, metomil, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, metoxifenoizida, 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, oxamil, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofós, proflutrina, propargita, protrifenbuto, 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, piridabén, piridalil, pirifluquinazón, piriminostrobina ((α E)-2-[[[2-[(2,4-diclorofenil)amino]-6-(trifluorometil)-4-pirimidinil]oxi]metil]- α -(metoximetilen)bencenoacetato de metilo), piriprol, piriproxifén, rotenona, rianodina, silafluofén, espinetoram, espinosad, espirodiclofén, espiromesifén, 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, tiametoxam, tiodiocarb, tiosultap-sodio, tioxazafén (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, 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, fipronil, flometoquina, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurón, flufenoxiestrobina, flufensulfona, flupiprol,

flupiradifurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptaflutrina, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, lufenurón, meperflutrina, metaflumizona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxifeno, metoflutrina, monofluorotrina, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamilo, piflubumida, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriminoestrobina, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, 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 esta divulgación incluye bacterias entomopatógenas tales como *Bacillus thuringiensis* y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* tales como los bioinsecticidas MVP® y MVPII® preparados mediante el proceso CellCap® (CellCap®, MVP® y MVPII® son marcas comerciales de Mycogen Corporation, Indianápolis, Indiana, EE. UU.); hongos entomopatógenos, tales como el hongo de la muscardina verde; y virus entomopatógenos (tanto naturales como modificados genéticamente), que incluyen baculovirus, nucleopoliedrovirus (NPV) tales como el nucleopoliedrovirus de *Helicoverpa zea* (HzNPV), el nucleopoliedrovirus de *Anagrapha falcifera* (AfNPV); y virus de la granulosis (GV) tal como el virus de la granulosis de *Cydia pomonella* (CpGV).

Una realización de agentes biológicos para mezclar con compuestos de esta divulgación incluye una o una combinación de (i) una bacteria del género *Actinomycetes*, *Agrobacterium*, *Arthrobacter*, *Alcaligenes*, *Aureobacterium*, *Azobacter*, *Bacillus*, *Beijerinckia*, *Bradyrhizobium*, *Brevibacillus*, *Burkholderia*, *Chromobacterium*, *Clostridium*, *Clavibacter*, *Comamonas*, *Corynebacterium*, *Curtobacterium*, *Enterobacter*, *Flavobacterium*, *Gluconobacter*, *Hydrogenophaga*, *Klebsiella*, *Methylobacterium*, *Paenibacillus*, *Pasteuria*, *Photobacterium*, *Phyllobacterium*, *Pseudomonas*, *Rhizobium*, *Serratia*, *Sphingobacterium*, *Stenotrophomonas*, *Streptomyces*, *Variovorax*, o *Xenorhabdus*, por ejemplo, una bacteria de *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 moscardino verde; (iii) un virus incluyendo baculovirus, nucleopoliedrovirus tal como nucleopoliedrovirus por *Helicoverpa zea*, nucleopoliedrovirus por *Anagrapha falcifera* virus de la granulosis tal como virus de la granulosis por *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 determinados 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 ventajoso para la gestión 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 para el control de plagas de invertebrados adicional con 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, pero sin limitación, los inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), tal como los carbamatos metomilo, oxamilo, tiodicarb, triazamato y los organofosforados clorpirifos; los antagonistas de los canales de cloruro activados por GABA, tal como los ciclodienos dieldrina y endosulfán, y los fenilpirazoles etiprol y fipronil; moduladores de los canales de sodio, tal como los piretroides bifentrina, ciflutrina, *beta*-ciflutrina, cihalotrina, *lambda*-cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, metoflutrina y proflutrina; agonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR), tal como los neonicotinoides acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid y tiametoxam, la sulfoximida sulfoxaflor, la butenolida flupiradifurona y el mesoiónico triflumezopirim; activadores alostéricos de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR), tal como las espinosinas espinetoram y espinosad; activadores de los canales de cloruro, tal como las avermectinas abamectina y emamectina; imitadores de las hormonas juveniles, tal como diofenolan, metopreno, fenoxicarb y piriproxifeno; moduladores de los órganos cordotonales, tal como pimetrozina, pirifluquinazón y flonicamid; inhibidores del crecimiento de los ácaros, tal como etoxazol; inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial, tal como propargita; desacopladores de la fosforilación oxidativa a través de la alteración del gradiente de protones, tal como clorfenapir; bloqueadores de los canales del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), tal como los análogos de la nereistoxina cartap; inhibidores de la biosíntesis de la quitina, tal como las benzoilureas flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón y triflumurón, y buprofezín; perturbadores de la muda de los dípteros, tal como la ciromazina; agonistas del receptor de la ecdisona, tal como las diacilhidrazinas metoxifenoazida y tebufenoazida; agonistas del receptor de la octopamina, tal como el amitraz; inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial, tales como el hidrametilnón y bifenazato; inhibidores del transporte de electrones del complejo I mitocondrial, tal como el piridabeno; bloqueadores de los canales de sodio dependientes de voltaje, tal como el indoxacarb; inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, tal como los ácidos tetrónico y tetrámico espiroclorfenol, espiromesifeno y espirotetramat; inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, tal como los β -cetonitrilos cienopirifeno y ciflumetofeno; moduladores del receptor de la rianodina, tal como las diamidas antranílicas clorantraniliprol y ciantraniliprol, diamidas como la flubendiamida, y ligandos del receptor de la rianodina, tal como la rianodina; compuestos en los que el sitio objetivo responsable de la actividad biológica es desconocido o no está caracterizado, tal como la azadiractina y el piridililo; disruptores microbianos de las membranas del intestino medio de los insectos, tal como el *Bacillus thuringiensis* y las delta-endotoxinas que produce y el *Bacillus sphaericus*; y agentes biológicos, incluyendo la poliedrosis nuclear (NPV) y otros virus insecticidas naturales o modificados genéticamente.

Otros ejemplos de compuestos o agentes biológicamente activos con los que pueden formularse los compuestos de la presente divulgación son: fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, aldimorfo, ametoctradina, aminopirifeno, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo (incluido benalaxilo-M), benodanil, benomilo, bentiavalicarb (incluido bentiavalicarb-isopropilo), benzovindiflupir, betoxazina, binapacril, bifenilo, bitertanol, bixafeno, blasticidina-S, boscalida, bromuconazol, bupirimato,

buthiobato, carboxina, carpropamida, captafol, captan, carbendazim, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, cumoxistrobina, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclobentiazox, diclofluanida, diclocimet, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorfo, dimoxistrobina, diniconazol (incluido

5 diniconazol-M), dinocap, dipymetitrone, ditianona, ditiolanos, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, edifenfos, enoxastrobina (también conocida como enestrobirina), epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenaminstrobina, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fencpiclonil, fencpicoxamida, fenpropidina, fenpropimorf, fencpirazamina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, flometoquina, florilpicoxamida, fluopimomida, fluazinam,

10 fludioxonil, flufenoxistrobina, fluindapir, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoxapiprolina, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, ftalida (también conocida como ftalida), fuberidazol, furalaxilo, furametpir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, albesilato de iminocadina, triacetato de iminocadina, inpirfluxam, iodicarb, ipconazol, ipfentrifluconazol, ipflufenquina, isofetamid, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarbo, isoflucipram,

15 isoprotiolano, isopirazam, isotianilo, kasugamicina, cresoxim-metilo, lancotriona, mancozeb, mandipropamid, mandestrobina, maneb, mapanipirina, mefentrifluconazol, mepronil, meptildinocap, metalaxilo (incluido metalaxilo-M/mefenoxam), metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina, metiltetraprol, metrafenona, miclobutanilo, naftitina, neo-asozina (metanearsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, oxatiapiprolina, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina,

20 oxtetraciclina, penconazol, pencicurón, penflufeno, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosforoso (incluidas sus sales, por ejemplo, fosetil-aluminio), picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protiocarb, protioconazol, pidiflumetofeno (Adepidyn®), piraclostrobina, pirametostrobina, pirapropoína, piroxistrobina, piraziflúmido, pirazofos, piribencarb, piributacarb, piridaclometilo, pirifenox, piriofenona, perisoxazol, pirimetanilo, pirifenox,

25 pirrolnitrina, piroquilón, quinconazol, quinmetionato, quinoxifeno, quintoceno, siltiofam, sedaxano, simeconazol, espiroxamina, estreptomina, azufre, tebuconazol, tebufloquina, tecloftalam, tecloftalam, tecnaceno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tipluzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinil, tolclorós-metilo, tolprocarb, tolifluanida, triadimefón, triadimenol, triarimol, triazóxido, sulfato de cobre tribásico, triclopircarbo, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, trimopramida triciclazol, trifloxistrobina,

30 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-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona; nematocidas tales como fluopiram, espirotetramat, tiodicarb, fostiazato, abamectina, iprodiona, fluensulfona, disulfuro de dimetilo, tioazafeno, 1,3-dicloropropeno (1,3-D), metam (sodio y potasio), dazomet, cloropicrina, fenamifos, etoprofos, cadusafos, terbufos, imiciafos,

35 oxamilo, carbofurano, tioazafeno, *Bacillus firmus* y *Pasteuria nishizawae*; bactericidas tales como estreptomina; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, 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, incluido el emplazamiento agronómico y/o no agronómico de la infestación, a la superficie que se ha de proteger o directamente sobre las plagas que se han de controlar.

Por lo tanto, la presente divulgación comprende un método para controlar y combatir 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 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 granulares en donde el compuesto activo adicional está presente en el mismo gránulo que el compuesto de la divulgación o en gránulos distintos de los del compuesto de la divulgación.

Para conseguir el contacto con un compuesto o una composición de la divulgación para proteger un cultivo de campo frente a plagas de invertebrados, el compuesto o la composición normalmente se aplica a la semilla del cultivo antes de plantar, al follaje (por ejemplo, hojas, tallos, flores, frutos) de las plantas de cultivo, o 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, puede aplicarse una composición granular que comprenda un compuesto de la divulgación al follaje de la planta o al suelo. Los compuestos de esta divulgación también pueden administrarse eficazmente a través de la absorción por parte de la planta al poner en contacto la planta con una composición que comprenda un compuesto de esta divulgación que se aplica 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 y combatir 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, crotales, bolos, nebulizadores, fumigadores, aerosoles, polvos finos y muchos otros. Una realización de un método de contacto es un gránulo, barra o comprimido de fertilizante dimensionalmente estable que comprende un compuesto o una composición de la divulgación. Los compuestos de esta

divulgación también pueden impregnarse en materiales para fabricar dispositivos de control de invertebrados (por ejemplo, redes para insectos).

Los compuestos de la divulgación son útiles para tratar todas las plantas, partes de plantas y semillas. Pueden obtenerse 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.

Los cultivares de semillas y plantas modificadas genéticamente que pueden tratarse de acuerdo con la divulgación incluyen los 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 contienen otras características deseables. Las plantas y semillas pueden modificarse 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 puede obtenerse información adicional sobre las modificaciones genéticas enumeradas en la Tabla Z:

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

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 GMO en la EU - Registro de GMO [base de datos en línea]. Obtenido del Centro Común de Investigación de la Comisión Europea usando Internet <<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>>

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 o rasgos	Gen o genes
Alfalfa	J101	MON-00101-8	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Alfalfa	J163	MON-ØØ163-7	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Colza*	23-18-17 (Evento 18)	CGN-89465-2	Aceite con alto contenido de ácido láurico	te

5	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
	Colza*	73496	DP-Ø73496-4	Tol. a glifosato	gat4621
	Colza*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Colza*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
10	Colza*	HCN10 (Topas 19/2)	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	Tol. a glufosinato	pat (syn)
	Colza*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	Tol. a glufosinato	bar
15	Colza*	MON88302	MON-883Ø2-9	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Colza*	MPS961	ND	Degradación de fitato	phyA
20	Colza*	MPS962	ND	Degradación de fitato	phyA
	Colza*	MPS963	ND	Degradación de fitato	phyA
	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
25	Colza*	MS8	ACS-BNØØ5-8	Tol. a glufosinato	bar
	Colza*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	Tol. a oxinilo	bxn
	Colza*	PHY14	ND	Tol. a glufosinato	bar
30	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
	Colza*	RF2 (B94-2)	ACS-BNØØ2-5	Tol. a glufosinato	bar
35	Colza*	RF3	ACS-BNØØ3-6	Tol. a glufosinato	bar
	Judía	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	Res. a enfermedades	ac1 (sentido y antisentido)

5	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)
	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)
10	Clavel	123.2.2 (40619)	FLO-40619-7	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	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)
15	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)
20	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)
25	Clavel	4	FLO-00004-9	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
	Clavel	66	FLO-00066-8	Tol. a SU; retraso de la senescencia	surB; acc
30	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)
35	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
	Achicoria	RM3-4	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Achicoria	RM3-6	ND	Tol. a glufosinato	bar

5	Algodón	19-51a	DD-Ø1951A-7	Tol. a herbicidas ALS	S4-HrA
	Algodón	281-24-236	DAS-24236-5	Tol. a glufosinato; res. a insectos	pat (syn); cry1F
	Algodón	3006-210-23	DAS-21Ø23-5	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
10	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
15	Algodón	BNLA-601	ND	Res. a insectos	cry1Ac
	Algodón	BXN10211	BXN10211-9	Tol. a oxinilo	bxn; cry1Ac
	Algodón	BXN10215	BXN10215-4	Tol. a oxinilo	bxn; cry1Ac
20	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)
	Algodón	COT67B	SYN-IR67B-1	Res. a insectos	cry1Ab
	Algodón	COT202		Res. a insectos	vip3A
25	Algodón	Evento 1	ND	Res. a insectos	cry1Ac
	Algodón	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	Res. a insectos	cry1Ab-Ac
	Algodón	GHB119	BCS-GH005-8	Res. a insectos	cry2Ae
30	Algodón	GHB614	BCS-GH002-5	Tol. a glifosato	2mepsps
	Algodón	GK12	ND	Res. a insectos	cry1Ab-Ac
	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
35	Algodón	MON1445	MON-01445-2	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Algodón	MON15985	MON-15985-7	Res. a insectos	cry1Ac; cry2Ab2
	Algodón	MON1698	MON-89383-1	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Algodón	MON531	MON-00531-6	Res. a insectos	cry1Ac
	Algodón				

5	Algodón	MON757	MON-00757-7	Res. a insectos	cry1Ac
	Algodón	MON88913	MON-88913-8	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Algodón	Nqwe Chi 6 Bt	ND	Res. a insectos	¿ND?
	Algodón	SKG321	ND	Res. a insectos	cry1A; CpTI
	Algodón	T303-3	BCS-GH003-6	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ab; bar
10	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
	Algodón	CE44-69D		Res. a insectos	cry1Ab
	Algodón	1143-14A		Res. a insectos	cry1Ab
15	Algodón	1143-51B		Res. a insectos	cry1Ab
	Algodón	T342-142		Res. a insectos	cry1Ab
	Algodón	PV-GHGT07 (1445)		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Algodón	EE-GH3		Tol. a glifosato	mepsps
	Algodón	EE-GH5		Res. a insectos	cry1Ab
20	Algodón	MON88701	MON-88701-3	Tol. a dicamba y glufosinato	dmo modificado; bar
	Algodón	OsCr11		Antialérgico	Cry j modificado
	Agrostis trepador	ASR ³ 68	SMG-368ØØ- 2	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Eucalipto	20-C		Tol. a la sal	codA
	Eucalipto	12-5C		Tol. a la sal	codA
25	Eucalipto	12-5B		Tol. a la sal	codA
	Eucalipto	107-1		Tol. a la sal	codA
	Eucalipto	1/9/2001		Tol. a la sal	codA
	Eucalipto	2/1/2001		Tol. a la sal	codA
	Eucalipto			Tol. al frío	des9
30	Lino	FP967	CDC-FL001-2	Tol. a herbicidas ALS	als
	Lenteja	RH44		Tol. a imidazolinona	als
	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

5	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
	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
10	Maíz	Bt10	ND	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ab; pat
	Maíz	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	Res. a insectos; tol. a glufosinato	cry1Ab; bar
15	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
20	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
	Maíz	GJ11		Tol. a glifosato	mepsps
	Maíz	FI117		Tol. a glifosato	mepsps
25	Maíz	GAT-ZM1		Tol. a glufosinato	pat
	Maíz	LY038	REN-00038-3	Aumento de lisina	cordapA
	Maíz	MIR162	SYN-IR162-4	Res. a insectos	vip3Aa20
	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
30	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
35	Maíz	MON832	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Maíz	MON863	MON-00863-5	Res. a insectos	cry3Bb1

5	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)
	Maíz	MON89034	MON-89034-3	Res. a insectos	cry2Ab2; cry1A.105
	Maíz	MS3	ACS-ZM001-9	Tol. a glufosinato; control de polinización	bar; barnasa
10	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)
15	Maíz	T25	ACS-ZM003-2	Tol. a glufosinato	pat (syn)
	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
20	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
25	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
	Maíz				
30	Melón	Melón A	ND	Maduración/senescencia retrasada	sam-k
	Melón	Melón B	ND	Maduración/senescencia retrasada	sam-k
35	Papaya	55-1	CUH-CP551-8	Res. a enfermedades	prsv cp
	Papaya	63-1	CUH-CP631-7	Res. a enfermedades	prsv cp
	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

5	Ciruela	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
	Colza**	ZSR503	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	Álamo	Álamo Bt	ND	Res. a insectos	cry1Ac; API
10	Álamo	Clon híbrido de álamo 741	ND	Res. a insectos	cry1Ac; API
	Álamo	trg300-1		Celulosa elevada	AaXEG2
	Álamo	trg300-2		Celulosa elevada	AaXEG2
	Patata	1210 amk	ND	Res. a insectos	cry3A
15	Patata	2904/1 kgs	ND	Res. a insectos	cry3A
	Colza**	ZSR500	ND	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
	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
	Patata	ATBT04-6	NMK-89761-6	Res. a insectos	cry3A
	Patata	BT06	NMK-89812-3	Res. a insectos	cry3A
25	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
	Patata	BT17	NMK-89593-9	Res. a insectos	cry3A
	Patata	BT18	NMK-89906-7	Res. a insectos	cry3A
30	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 y enfermedades	cry3A; pvv cp
35	Patata	HLMT15-3	ND	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; pvv cp
	Patata	HLMT15-46	ND	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; pvv cp

5	Patata	RBMT15-101	NMK-89653-6	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; pvy cp
	Patata	RBMT21-129	NMK-89684-1	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
	Patata	RBMT21-152	ND	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
	Patata	RBMT21-350	NMK-89185-6	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
10	Patata	RBMT22-082	NMK-89896-6	Res. a insectos y enfermedades; tol. a glifosato	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Patata	RBMT22-186	ND	Res. a insectos y enfermedades; tol. a glifosato	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
15	Patata	RBMT22-238	ND	Res. a insectos y enfermedades; tol. a glifosato	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
	Patata	RBMT22-262	ND	Res. a insectos y enfermedades; tol. a glifosato	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
20	Patata	SEMT15-02	NMK-89935-9	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; pvy cp
	Patata	SEMT15-07	ND	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; pvy cp
25	Patata	SEMT15-15	NMK-89930-4	Res. a insectos y enfermedades	cry3A; pvy cp
	Patata	SPBT02-5	NMK-89576-1	Res. a insectos	cry3A
30	Patata	SPBT02-7	NMK-89724-5	Res. a insectos	cry3A
	Arroz	7Crp#242-95-7		Antialérgico	7crp
	Arroz	7Crp#10	ND	Antialérgico	7crp
	Arroz	GM Shanyou 63	ND	Res. a insectos	cry1Ab; cry1Ac
35	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
	Arroz	Tarom molaii + cry1Ab	ND	Res. a insectos	cry1Ab (truncado)
	Arroz	GAT-OS2		Tol. a glufosinato	bar

5	Arroz	GAT-OS3	ND	Tol. a glufosinato	bar
	Arroz	PE-7		Res. a insectos	Cry1Ac
	Arroz	7Crp#10		Antialérgico	7crp
	Arroz	KPD627-8		Triptófano elevado	OASA1D
	Arroz	KPD722-4		Triptófano elevado	OASA1D
10	Arroz	KA317		Triptófano elevado	OASA1D
	Arroz	HW5		Triptófano elevado	OASA1D
	Arroz	HW1		Triptófano elevado	OASA1D
	Arroz	B-4-1-18		Hojas erectas semienanas	Δ OsBRI1
	Arroz	G-3-3-22		Semienana	OSGA2ox1
15	Arroz	AD77		Res. a enfermedades	DEF
	Arroz	AD51		Res. a enfermedades	DEF
	Arroz	AD48		Res. a enfermedades	DEF
	Arroz	AD41		Res. a enfermedades	DEF
	Arroz	13pNasNaatAprt1		Baja tol. al hierro	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
20	Arroz	13pAprt1	IFD-52401-4 IFD-52901-9 ND	Baja tol. al hierro	APRT
	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
25	Arroz	NIA-OS006-4		Res. a enfermedades	WRKY45
	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
30	Arroz	NIA-OS001-8		Res. a enfermedades	WRKY45
	Arroz	OsCr11		Antialérgico	Cry j modificado
	Arroz	17053		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Arroz	17314		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Arroz	17314		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
35	Rosa	WKS82 / 130-4-1		Color de la flor modificado	5AT; bp40 (f3'5'h)
	Rosa	WKS92 / 130-9-1		Color de la flor modificado	5AT; bp40 (f3'5'h)
	Soja	260-05 (G94-1, G94-19, G168)		Aceite/ácido graso modificado	gm-fad2-1 (locus de silenciamiento)

5	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
	Soja	CV127	BPS-CV127-9	Tol. a imidazolinona	csr1-2
	Soja	DAS68416-4	DAS68416-4	Tol. a glufosinato	pat
	Soja	DP305423	DP-305423-1	Aceite/ácido graso modificado; tol. a herbicidas ALS	gm-fad2-1 (locus de silenciamiento); gm-hra
10	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
15	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
	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)
20					
25	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)
	Soja	MON89788	MON-89788-1	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
30	Soja	W62	ACS-GM002-9	Tol. a glufosinato	bar
	Soja	W98	ACS-GM001-8	Tol. a glufosinato	bar
	Soja	MON87754	MON-87754-1	Aceite elevado	dgat2A
	Soja	DAS21606	DAS-21606	Tol. a ariloxialcanoato y glufosinato	aad-12 modificado; pat
35	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

5	Soja	9582.814.19.1		Res. a insectos y tol. a glufosinato	cry1Ac, cry1F, PAT
	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
	Remolacha azucarera	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
10	Remolacha azucarera	H7-1	KM-000H71-4	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
	Remolacha azucarera	T120-7	ACS-BV001-3	Tol. a glufosinato	pat
	Remolacha azucarera	T227-1		Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
15	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
20	Tabaco	C/F/93/08-02	ND	Tol. a oxinilo	bxn
	Tabaco	Vector 21-41	ND	Nicotina reducida	NtQPT1 (antisentido)
	Tomate	1345-4	ND	Maduración/senescencia retrasada	acc (truncado)
25	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
30	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
35	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)
	Tomate	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	Maduración/senescencia retrasada	pg (sentido o antisentido)

5	Tomate	Huafan N.º 1	ND	Maduración/senescencia retrasada	anti-efe
	Tomate	PK-TM8805R (8805R)	ND	Res. a enfermedades	cmv cp
	Trigo	MON71800	MON-718ØØ- 3	Tol. a glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)

* Argentina, ** Polaca, # Berenjena

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

15 Los compuestos de esta divulgación también son útiles en el tratamiento de semillas para proteger las semillas frente a 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 pueden aplicarse a todo tipo de semillas, incluyendo aquellas a partir de las cuales germinarán plantas transformadas genéticamente para expresar rasgos especiales. 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.

30 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 película. Por lo tanto, normalmente una composición de recubrimiento de semillas de la presente divulgación comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o sal del mismo, y un agente adhesivo o formador de película. La semilla puede recubrirse pulverizando un concentrado en suspensión fluido directamente en un lecho de volteo de semillas y, después, secando las semillas. Como alternativa, pueden pulverizarse 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 pelliculares 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*, Monografía de BCPC N.º 57 de 1994, y las referencias enumeradas en dicho documento.

Los compuestos de Fórmula 1 y sus composiciones, tanto solos como en combinación con otros insecticidas y fungicidas, son particularmente útiles en el tratamiento de semillas para cultivos que incluyen, pero sin limitarse a, maíz, soja, algodón, cereales (por ejemplo, trigo, avena, cebada, centeno y arroz), patatas, hortalizas y colza oleaginosa.

Otros insecticidas con los que pueden formularse los compuestos de Fórmula 1 para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas incluyen abamectina, acetamiprid, 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, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurón, fluvalinato, formetanato, fostiazato, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, lufenurón, metaflumizona, metiocarb, metomilo, metopreno, metoxifenoza, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozida, tetrametrina, tiacloprid, 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 pueden formularse los compuestos de Fórmula 1 para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas incluyen amisulbrom, azoxiestrobina, boscalid, carbendazim, carboxina, cimoxanil, ciproconazol, difenoconazol, dimetomorf, fluazinam, fludioxonil, fluquinconazol, fluopicolida, fluoxaestrobina, flutriafol, fluxapiraxad, ipconazol, iprodiona, metalaxilo, mephenoxam, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penflufeno, picoxiestrobina, protioconazol, piraclostrobina, sedaxano, siltiofam, tebuconazol, tiabendazol, tiofanato-metilo, tiram, trifloxiestrobina y triticonazol.

Las composiciones que comprenden compuestos de Fórmula 1 útiles para el tratamiento de semillas pueden comprender además bacterias tales como *Bacillus pumilus* (por ejemplo, cepa GB34) y *Bacillus firmus* (por ejemplo, aislado 1582), inoculantes/extensores de rizobios, isoflavonoides y lipooligosacáridos.

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 el 0.5 a aproximadamente el 70 % del principio activo, de aproximadamente el 0.5 a aproximadamente el 30 % de un adhesivo que forma películas, de aproximadamente el 0.5 a aproximadamente el 20 % de un agente dispersante, del 0 a aproximadamente

el 5 % de un espesante, del 0 a aproximadamente el 5 % de un pigmento y/o colorante, del 0 a aproximadamente el 2 % de un agente antiespumante, del 0 a aproximadamente el 1 % de un conservante y del 0 a aproximadamente el 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 atrayente 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 atrayente; y, opcionalmente, aproximadamente el 0.05-10 % de humectantes, que son eficaces para controlar y combatir las plagas de invertebrados del suelo en dosis 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 actuar como fuente de alimento y como atrayente. Los materiales alimentarios incluyen carbohidratos, proteínas y lípidos. Son ejemplos de materiales alimentarios la harina vegetal, el azúcar, almidones, la grasa animal, el aceite vegetal, extractos de levadura y sólidos lácteos. Son ejemplos de atrayentes 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, la glicerina y el sorbitol. Cabe destacar una composición de cebo (y un método que utiliza dicha composición de cebo) utilizada para controlar y combatir al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas. Un dispositivo para controlar y combatir una plaga de invertebrados puede comprender la presente composición de cebo 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 pueden aplicarse sin otros adyuvantes, pero la aplicación más frecuente será la de una formulación que comprenda uno o más principios activos con portadores, diluyentes y tensioactivos adecuados y, posiblemente, en combinación con un alimento dependiendo del uso final contemplado. Un método de aplicación implica pulverizar una dispersión acuosa o una solución en aceite refinado de un compuesto de la presente divulgación. Las combinaciones con aceites de 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, dichas pulverizaciones pueden aplicarse desde recipientes de pulverización tales como una lata, un bote u otro recipiente, ya sea por medio de una bomba o liberándolas desde un recipiente presurizado, por ejemplo, una pulverización en lata de aerosol presurizado. Dichas composiciones de pulverización pueden

adoptar diversas formas, por ejemplo, pulverizaciones, nebulizaciones, espumas, humos o neblinas. Por lo tanto, dichas composiciones de pulverización pueden comprender además propulsores, agentes espumantes, etc., según sea el caso. Cabe destacar una composición de pulverización que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente divulgación y un portador. 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, pero sin limitarse a, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarburos, clorofluorocarburos, dimetil éter 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 y combatir al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en mosquitos, moscas negras, moscas de los establos, moscas de los ciervos, tábanos, avispas, avispas de chaqueta amarilla, avispones, garrapatas, arañas, hormigas, mosquitos y similares, incluso individualmente o en combinaciones.

Una realización de la presente divulgación se refiere a un método para controlar y combatir 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 un plaguicida diferente) con agua, y opcionalmente añadir un adyuvante 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 composición plaguicida de la presente puede proporcionar suficiente eficacia para controlar y combatir plagas de invertebrados, también pueden añadirse productos adyuvantes formulados por separado a las 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 para cultivos a base de petróleo, aceites de semillas derivados de cultivos, 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 a la incompatibilidad, la formación de espuma, 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 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 puede mejorarse 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 dosis 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 la combinación de tensioactivos al 17 % en aceite mineral a base de parafina al 83 % Assist® (BASF).

Las aplicaciones no agronómicas incluyen proteger a un animal, particularmente un vertebrado, más particularmente un vertebrado homeotérmico (por ejemplo, un mamífero o ave) y con la mayor particularidad un mamífero, frente a una plaga de parásitos invertebrados mediante la administración de una cantidad eficaz como parasitocida (es decir, biológicamente eficaz) de un compuesto de la divulgación, normalmente en forma de una composición formulada para su uso veterinario, al animal que se ha de proteger. Por lo tanto, cabe destacar un método para proteger a un animal que comprende administrar al animal una cantidad eficaz como parasitocida de un compuesto de divulgación. Como se hace referencia a los mismos en la presente divulgación y en las reivindicaciones, el término "parasitocida" y la expresión "como parasitocida" se refieren a efectos observables sobre una plaga de parásitos 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 de parásitos invertebrados diana. Tales efectos sobre

la plaga incluyen necrosis, muerte, crecimiento retardado, disminución de la movilidad o menor capacidad de permanecer sobre o en el interior del animal hospedador, reducción de la alimentación e inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre plagas de parásitos invertebrados permiten controlar y combatir (incluso prevenir, reducir o eliminar) la infestación parasitaria o la infección del animal. Los ejemplos de plagas de parásitos invertebrados controladas mediante la administración de una cantidad eficaz como parasiticida de un compuesto de la divulgación a un animal que se ha de proteger incluyen ectoparásitos (artrópodos, ácaros, etc.) y endoparásitos (helmintos, por ejemplo, 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 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 instestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* y *Gastrophilus naslis*; piojos tales como *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* y *Trichodectes canis*; melófagos 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 tales como por administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, preparados de empapado, granulados, pastas, bolos, procedimientos da través de piensos o supositorios; o por administración parenteral, tal como por inyección (que incluye 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 parasiticida 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 portadores farmacéutica o veterinariamente aceptables que comprenden excipientes y auxiliares seleccionados con respecto a la vía de administración prevista (por ejemplo, administración oral, tópica o parenteral, tal como por inyección) y de acuerdo con la práctica habitual. Además, un portador 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 frente a una plaga de parásitos invertebrados que

comprende una cantidad eficaz como parasitocida de un compuesto de la divulgación y al menos un portador.

Para la administración parenteral, incluyendo 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 adyuvantes tales como agentes de suspensión, estabilizantes y/o dispersantes. Las composiciones farmacéuticas para inyección incluyen soluciones acuosas de formas hidrosolubles de principios activos (por ejemplo, una sal de un compuesto activo), preferentemente en tampones fisiológicamente compatibles que contienen otros excipientes o auxiliares que son muy 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 (por ejemplo, lactosa, sacarosa, manitol, sorbitol), almidón (por ejemplo, almidón de maíz, almidón de trigo, almidón de arroz, almidón de patata), celulosa y derivados (por ejemplo, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, etilhidroxicelulosa), derivados de proteínas (por ejemplo, zeína, gelatina) y polímeros sintéticos (por ejemplo, alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona). Si se desea, pueden añadirse lubricantes (por ejemplo, estearato de magnesio), agentes disgregantes (por ejemplo, polivinilpirrolidinona reticulada, agar, ácido algínico) y tintes o pigmentos. Las pastas y geles suelen contener también adhesivos (por ejemplo, goma arábica, 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 parasiticidas están en forma de concentrados de piensos, el portador se selecciona normalmente entre piensos de alto rendimiento, cereales para piensos o concentrados de proteínas. Dichas composiciones que contienen concentrados de piensos pueden comprender, además de los principios activos parasiticidas, aditivos que potencian la salud o el crecimiento de los animales, mejoran la calidad de la carne de los animales para la matanza o son útiles de otro modo para la cría de animales. Estos aditivos pueden incluir, por ejemplo, vitaminas, antibióticos, agentes quimioterápicos, bacteriostáticos, fungistáticos, coccidiostáticos 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 oral e ingestión. Por lo tanto, después de la ingestión por parte del animal que se ha de proteger, las concentraciones eficaces como parasitocida de los compuestos de la divulgación en el torrente circulatorio protegen al animal tratado frente a plagas de chupadores de sangre tales como pulgas, garrapatas y piojos. Por lo tanto, cabe destacar una composición para proteger a un animal frente a una plaga de parásitos invertebrados en una forma para la administración oral (es decir, que comprende, además de una cantidad eficaz como parasitocida de un compuesto de la divulgación, uno o más portadores

seleccionados de aglutinantes y cargas adecuados para la administración oral y portadores de concentrados de 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 parasiticidas adecuadas para la administración tópica normalmente comprenden un compuesto de la presente divulgación y uno o más portadores tópicamente adecuados. En aplicaciones de una composición parasiticida 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 frente a plagas de invertebrados que se alimentan de la epidermis del animal tal como garrapatas, pulgas y piojos. Por lo tanto, las formulaciones para administración tópica localizada con frecuencia 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 portadores en dichas formulaciones incluyen propilenglicol, parafinas, agentes aromáticos, ésteres tales como miristato de isopropilo, glicol éteres 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 y combatir plagas en ecosistemas agronómicos, pero puede bastar con tan solo 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 a 50 mg/metro cuadrado, pero puede bastar con tan solo 0.1 mg/metro cuadrado o pueden ser necesarios hasta 150 mg/metro cuadrado. Un experto en la materia puede determinar fácilmente la cantidad biológicamente eficaz necesaria para el nivel deseado de control de plagas de invertebrados.

En general, para el uso veterinario, se administra un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo en una cantidad eficaz como parasiticida a un animal que se ha de proteger frente a plagas de parásitos invertebrados. Una cantidad eficaz como parasiticida es la cantidad de principio activo necesaria para conseguir un efecto observable de disminución de la aparición o actividad de la plaga de parásitos invertebrados diana. Un experto en la materia apreciará que la dosis eficaz como parasiticida 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 ha de 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 dosificación 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 (por ejemplo, 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 a las exposiciones xenobióticas, junto con las bases moleculares para estos eventos. Aunque los modelos computacionales actuales no pueden usarse únicamente para reemplazar todos los enfoques experimentales *in vivo* o *in vitro*, sin embargo, proporcionan herramientas valiosas para generar hipótesis, señalar compuestos de interés y ayudar a priorizar y alinear los productos químicos con los estudios *in vitro* o *in vivo* apropiados.

La toxicología computacional/predictiva es una disciplina en rápido desarrollo que integra información y datos de diversas fuentes para desarrollar modelos matemáticos e informáticos que permitan entender y predecir mejor las interacciones de los agentes químicos y los organismos biológicos a muchas escalas (por ejemplo, poblacional, individual, celular y molecular) y se puede considerar que abarca dos áreas octuplete:

(1) El desarrollo y la aplicación de modelos en 2 dimensiones (2D) mediante los primeros principios (por ejemplo, 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). Adicionalmente, para predecir la dosimetría de un resultado biológico de interés, pueden realizarse técnicas cuantitativas de relación estructura-actividad (QSAR, por sus siglas en inglés), tales como el análisis de tendencias, si se dispone de datos experimentales de moléculas análogas (por ejemplo, predicción del 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).

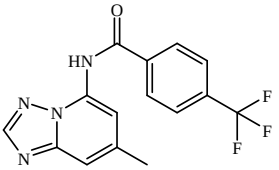
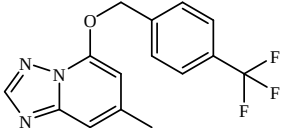
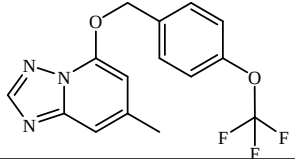
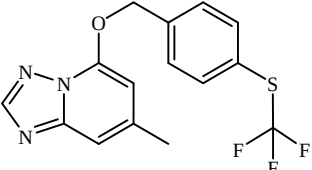
(2) Uso de enfoques de "big data" que seleccionan toda la información disponible sobre un resultado/modo de acción particular (por ejemplo, modelos predictivos para identificar inhibidores mitocondriales (Wijeyesakere, S.J. *et al. Hybrid Machine-Learning/SMARTS Profiling Model for Mitochondrial Inhibition. Appl. Vit. 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*

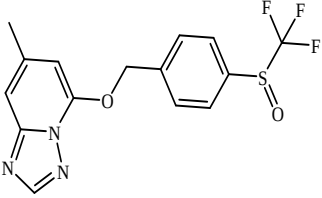
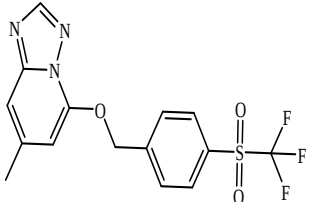
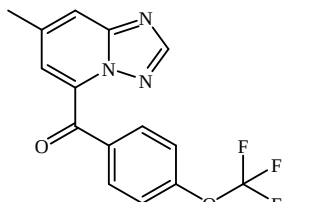
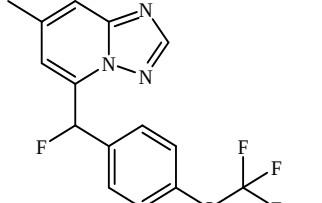
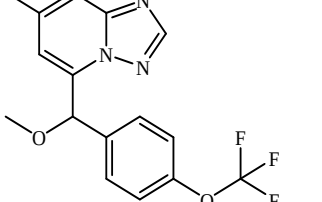
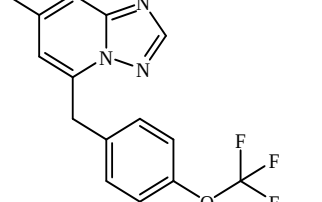
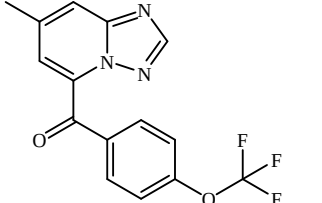
cell-selective neurotoxicity in chemically-induced energy deprivation syndromes in brain. Toxicol. Sci., **125**, 509–521, 2012; González, T.L. *et al. Metabolites of n-Butylparaben and iso-Butylparaben Exhibit Estrogenic Properties in MCF-7 and T47D Human Breast Cancer Cell Lines. Toxicol. Sci.*, **164**, 50–59018, 2018).

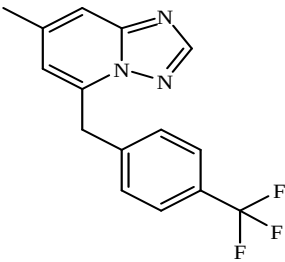
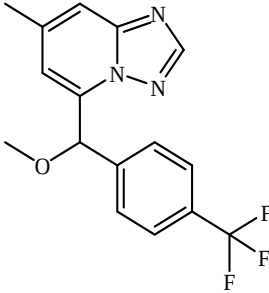
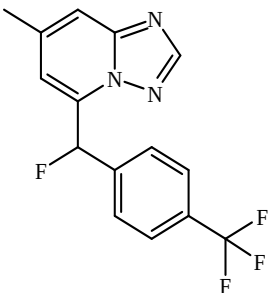
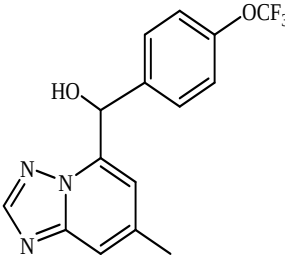
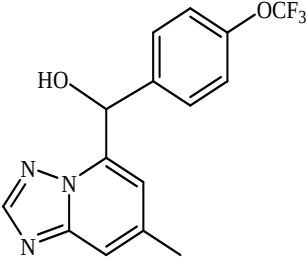
Los compuestos específicos de Fórmula 1 preparados mediante los métodos y variaciones que se han descrito en los Esquemas 1 a 10 y los Ejemplos de Síntesis 1-2 anteriores se muestran a continuación en la Tabla de índices A. Para los datos de los espectros de masas (MS), el valor numérico reportado es 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 (MP) se notifican como un intervalo de temperatura. Los picos de iones moleculares alternos (por ejemplo, M+2 o M+4) que se producen en los compuestos que contienen múltiples halógenos no se publican.

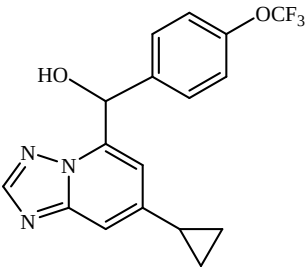
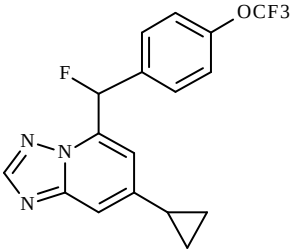
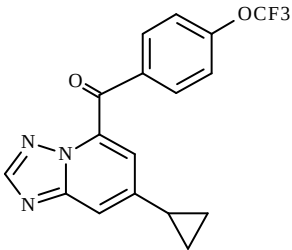
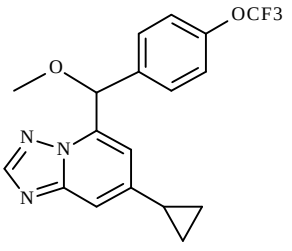
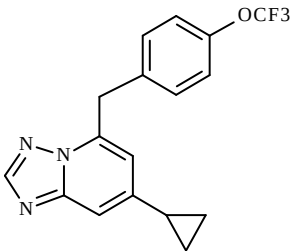
En la Tabla de Índices a continuación se usan las siguientes abreviaturas: Comp. significa Compuesto, *t* es terciario, *c* es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, *i*-Pr es isopropilo, Bu es butilo, *c*-Pr es ciclopropilo, *c*-Pn es ciclopentilo, *c*-Hx es ciclohexilo, *t*-Bu es butilo terciario, Ph es fenilo, OMe es metoxi, SMe es metiltio y SO₂Me significa metilsulfonilo. Una línea ondulada en un fragmento de estructura indica el punto de unión del fragmento al 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.

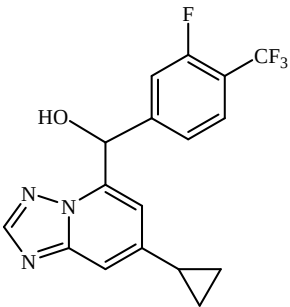
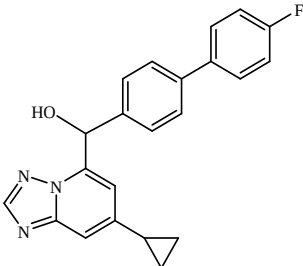
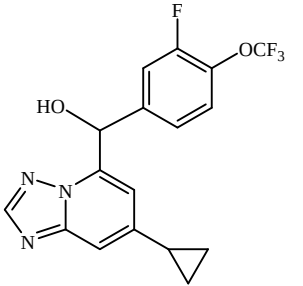
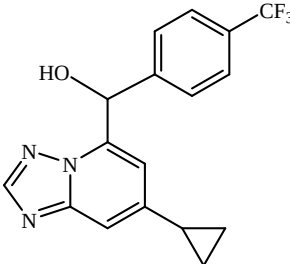
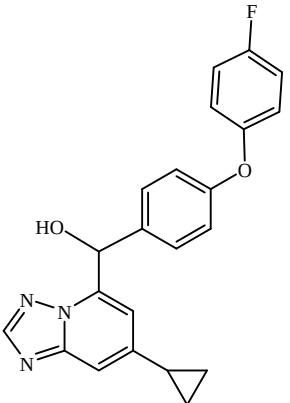
TABLA DE ÍNDICES A

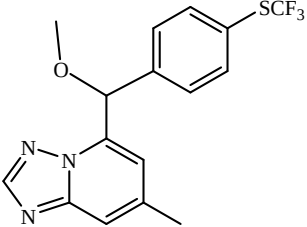
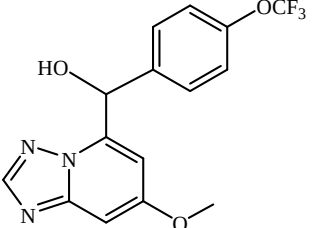
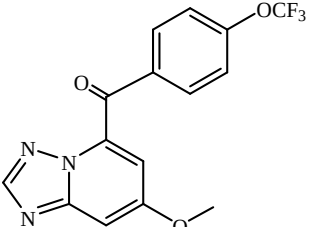
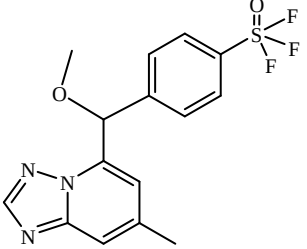
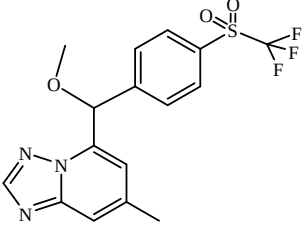
Comp. N.º	Estructura del compuesto	M+1	m.p. (°C)
1		321.0	
2		308.1	
3		324.1	
4		340.0	

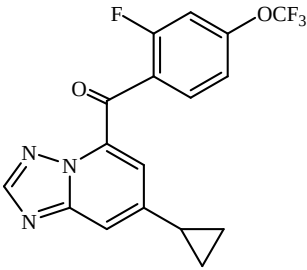
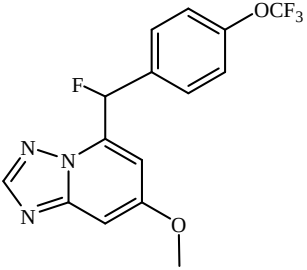
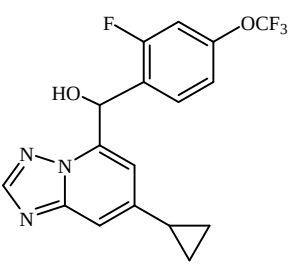
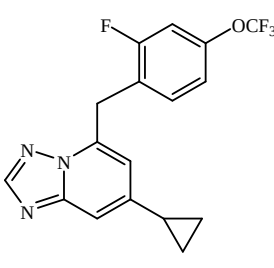
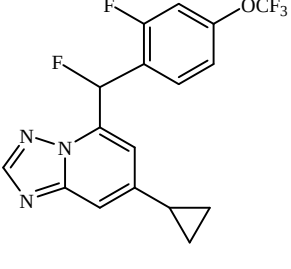
5		356.14	
6		372	
7		322.26	
8		326.23	
9		338.1	
10		308.1	
11		321.2	

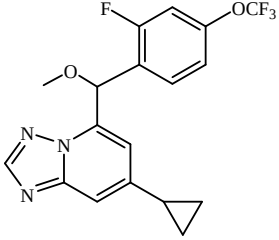
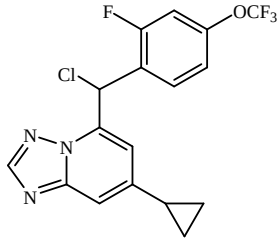
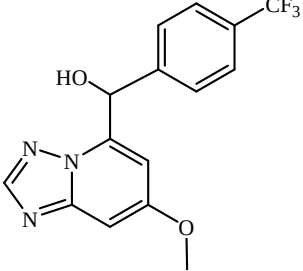
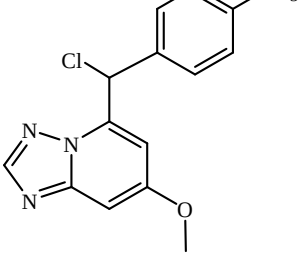
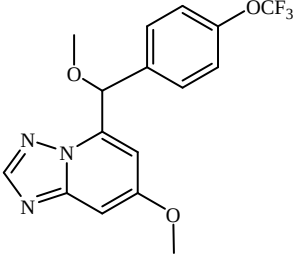
5	12		292.2	
10	13		322.1	
15	14		310.2	
25	15		324.3	
30	16		324.3	
35				

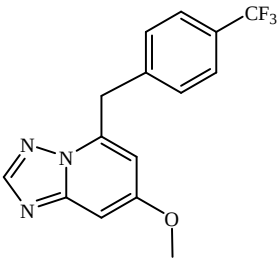
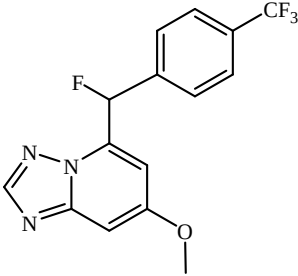
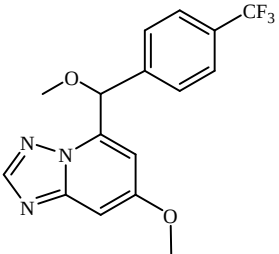
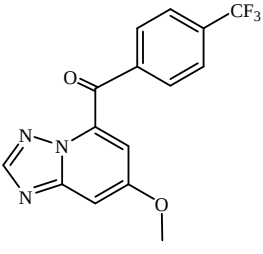
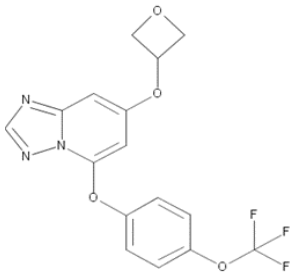
17		350.4	
18		352.4	
19		348.3	
20		364.4	
21		334.4	

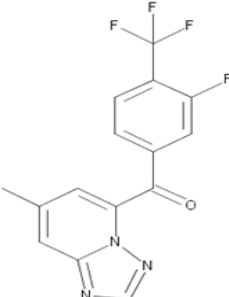
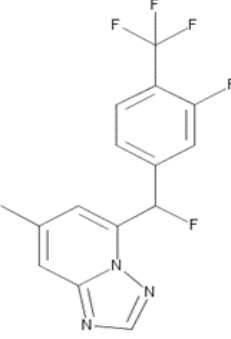
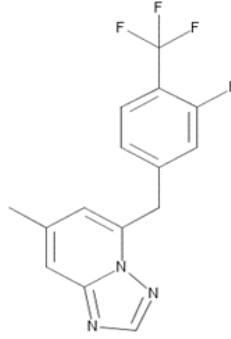
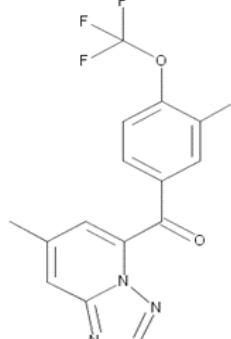
22		352.4	
23		360.4	
24		368.4	
25		334.4	
26		376.4	

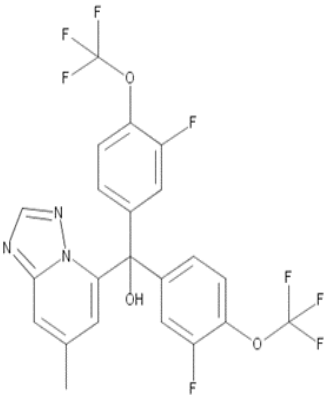
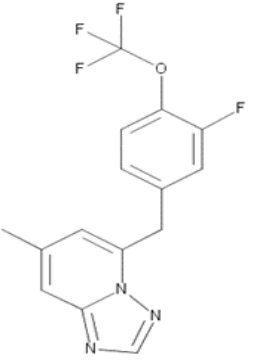
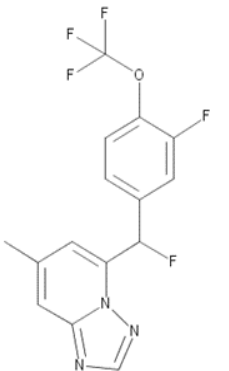
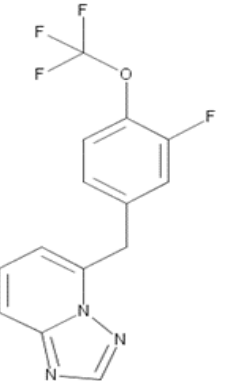
27	 <chem>COc1cc2ncnc2n1COC(c3ccc(SC(F)(F)F)cc3)</chem>		79-81
28	 <chem>COc1cc2ncnc2n1COC(c3ccc(OC(F)(F)F)cc3)O</chem>		197-200
29	 <chem>COc1cc2ncnc2n1C(=O)c3ccc(OC(F)(F)F)cc3</chem>		135-137
30	 <chem>COc1cc2ncnc2n1COC(c3ccc(S(=O)(=O)F(F)F)cc3)</chem>	370.2	
31	 <chem>COc1cc2ncnc2n1COC(c3ccc(S(=O)(=O)C(F)(F)F)cc3)</chem>	386.4	

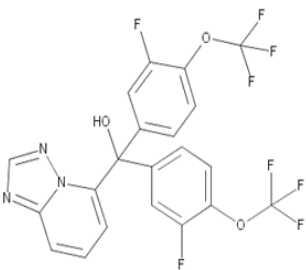
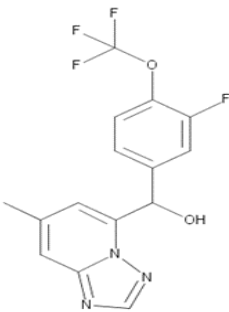
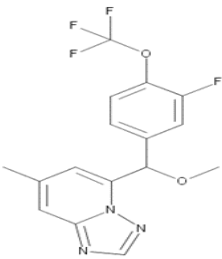
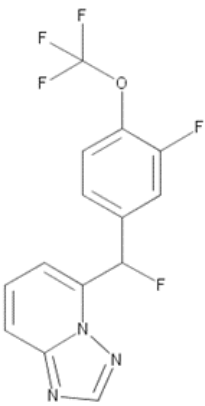
32			170-173
33			136-139
34			115-118
35			72-75
36			93-96°

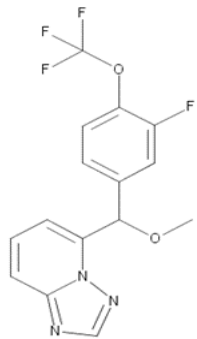
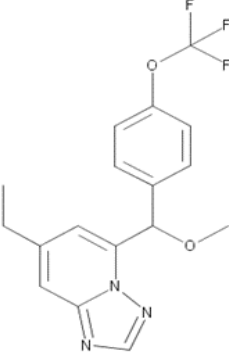
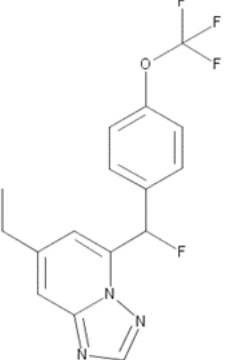
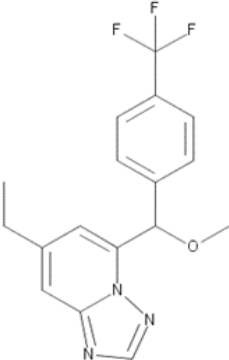
37			112-115
38			107-110°
39			203-206
40			110-113
41			85-88

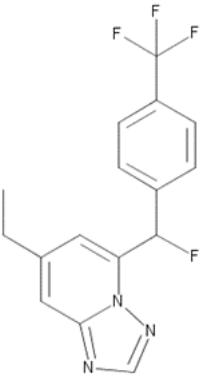
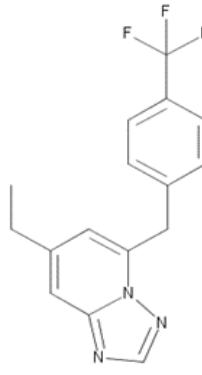
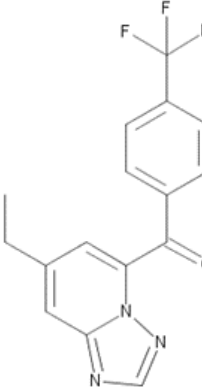
42	 <chem>COc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>		115-118
43	 <chem>COc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>		127-130
44	 <chem>COc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>		86-89
45	 <chem>COc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>		177-180
46	 <chem>COc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>		90-92

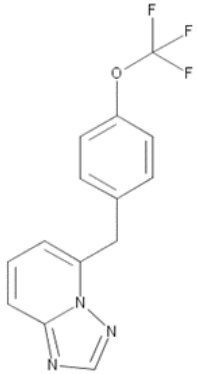
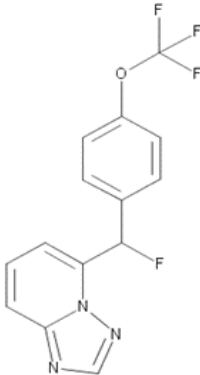
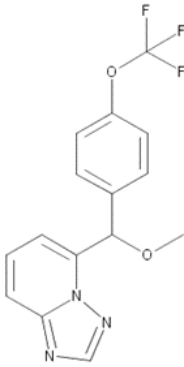
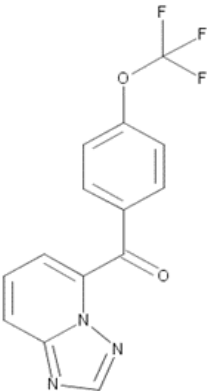
47			140-142
48			112-114°C
49			108-110°C
50			100-102°C

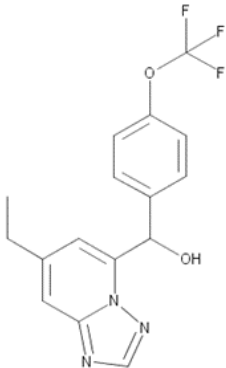
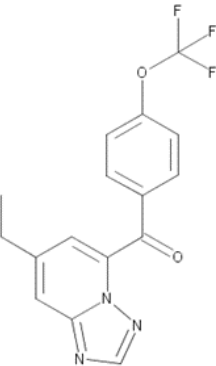
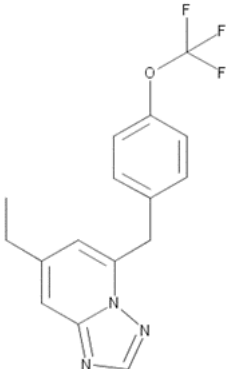
51			110-112°C
52			78-80°C
53		344.1	
54		312.1	

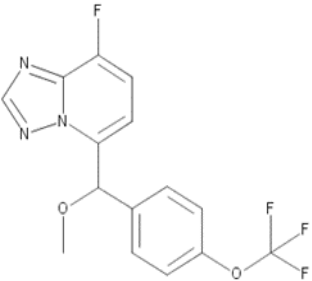
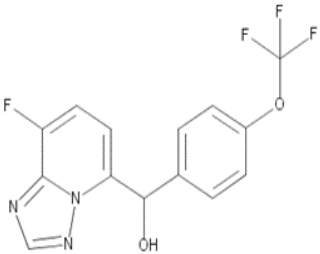
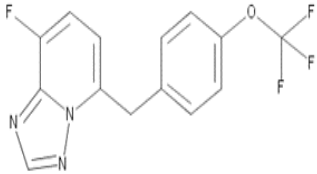
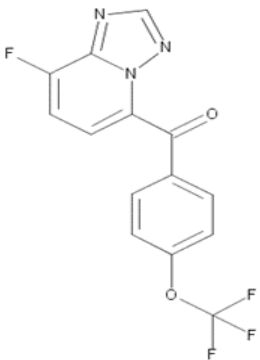
55			93-95
56			156-158
57		355.1	
58			72-74

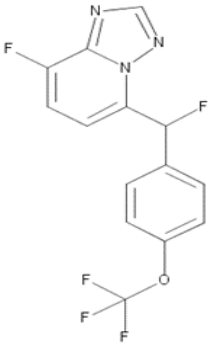
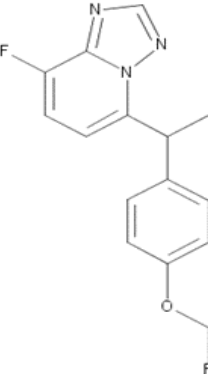
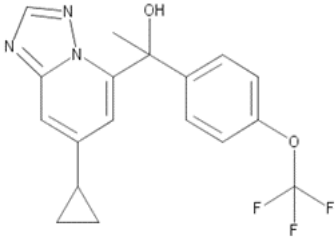
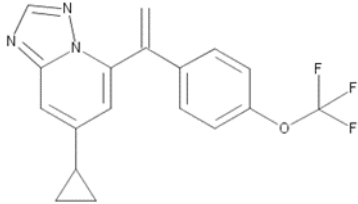
59		342.1	
60		352.2	
61		340.2	
62		336.2	

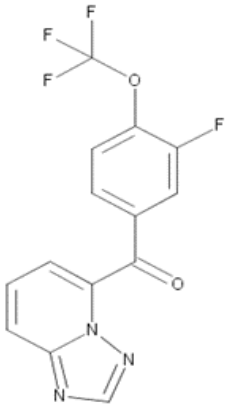
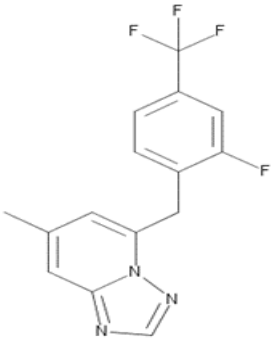
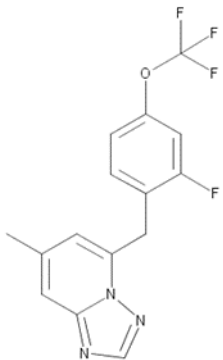
63	 <chem>CC1=CC=C2C(=C1)N3C=CC(=C2)N3C(=O)Fc4ccc(cc4)C(F)(F)F</chem>		78-80
64	 <chem>CC1=CC=C2C(=C1)N3C=CC(=C2)N3C#Cc4ccc(cc4)C(F)(F)F</chem>		92-94
65	 <chem>CC1=CC=C2C(=C1)N3C=CC(=C2)N3C#Cc4ccc(cc4)C(F)(F)F</chem>		98-100

66	 <chem>COc1ccc(OC(F)(F)F)cc1Cc2cnc3ccccc23</chem>		68-70
67	 <chem>Fc1c(Cc2cnc3ccccc23)ccc(OC(F)(F)F)cc1</chem>	312.2	
68	 <chem>COCc1c(Cc2cnc3ccccc23)ccc(OC(F)(F)F)cc1</chem>	324.1	
69	 <chem>OC(=O)c1c(Cc2cnc3ccccc23)ccc(OC(F)(F)F)cc1</chem>		116-118

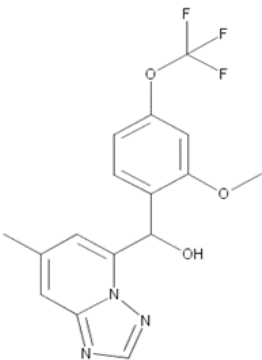
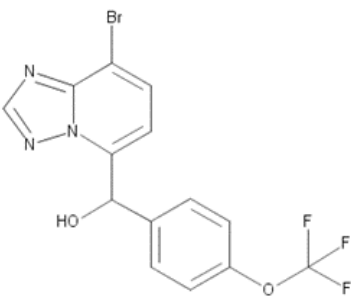
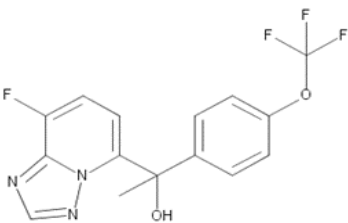
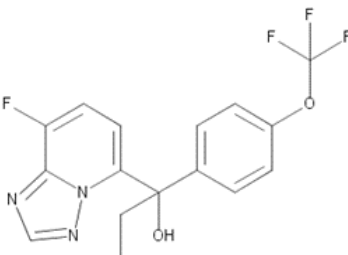
5			
10	70		130-132
15	71		84-86
20	72		77-79
25			
30			
35			

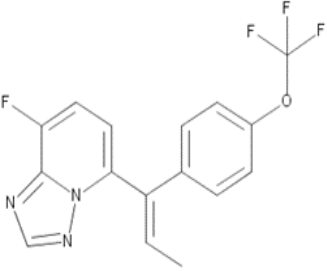
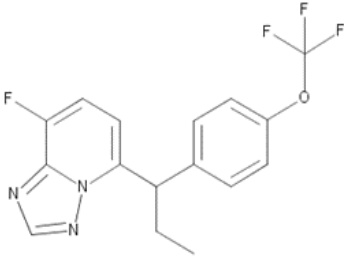
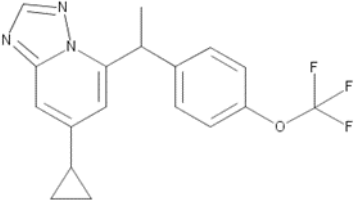
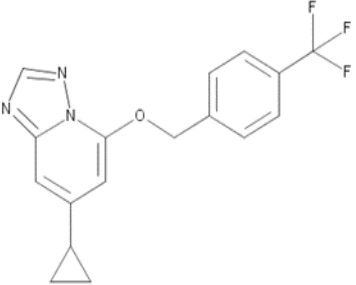
73			76-79
74			127-130
75			77-80
76			137-140

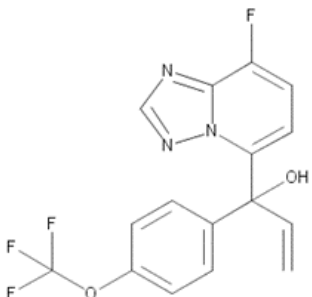
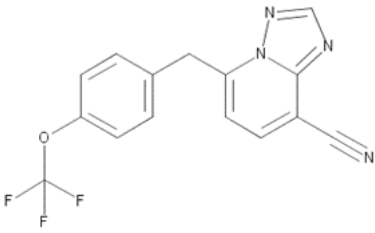
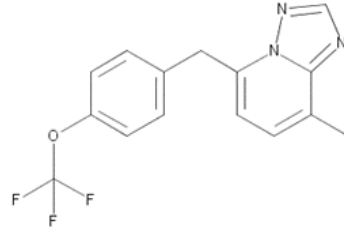
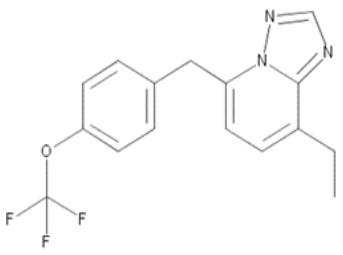
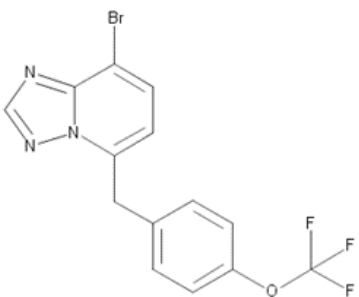
77			67-70
78		326.2	
79		364.3	
80		346.2	

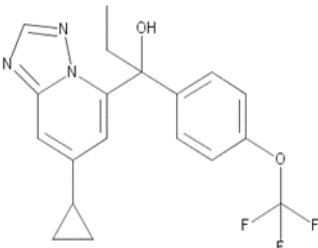
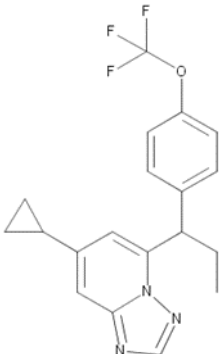
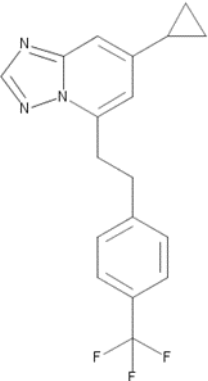
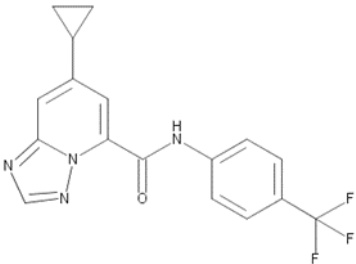
81	 <chem>CCOC(=O)c1ccc(OC(F)(F)F)c(F)c1-c2nc3ccccc3n2</chem>	326.2	
82	 <chem>CCc1cc(COC(F)(F)F)cc(C)n1-c2cc(F)c(C(F)(F)F)cc2</chem>	310.2	
83	 <chem>CCc1cc(COC(F)(F)F)cc(C)n1-c2cc(F)c(OC(F)(F)F)cc2</chem>	326.2	

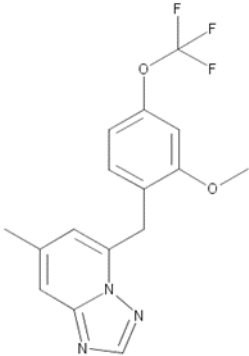
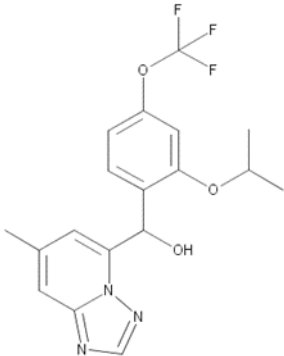
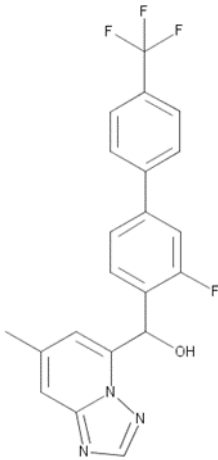
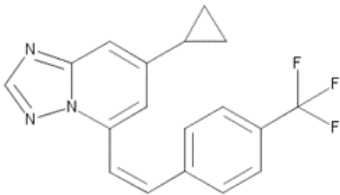
5	84		356.3	
10	85		342.2	
15	86		344.2	
20	87		338.3	
25				
30				
35				

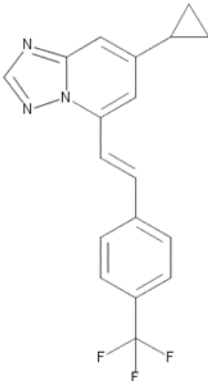
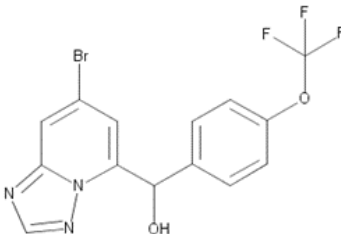
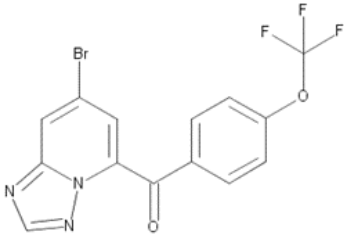
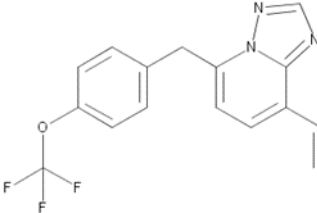
88		354.2	
89		142-145	
90		91-94	
91		356.2	

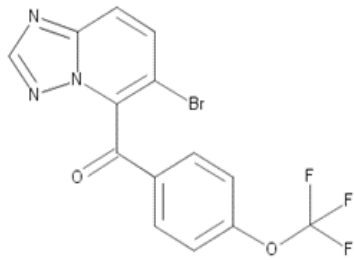
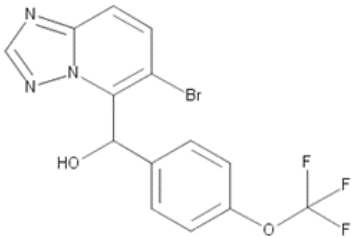
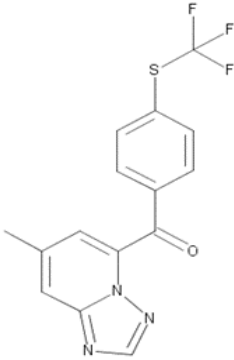
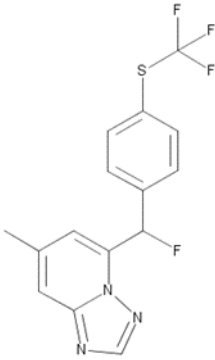
5	92		338.2	
10	93		340.2	
15	94		64-66	
20	95		81-83	

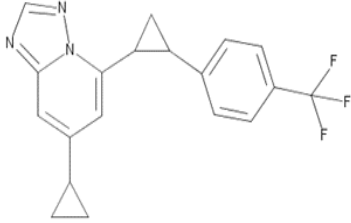
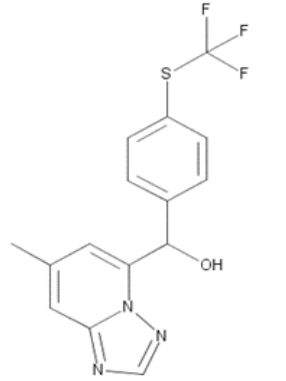
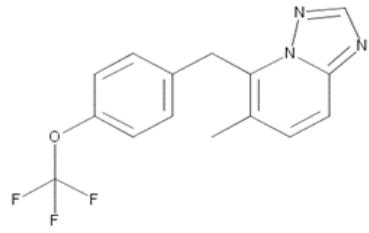
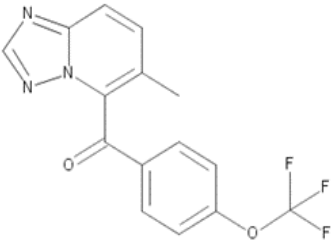
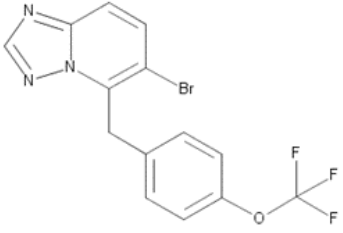
96			91-94
97			117-120
98		308.2	
99		322.3	
100		373.1	

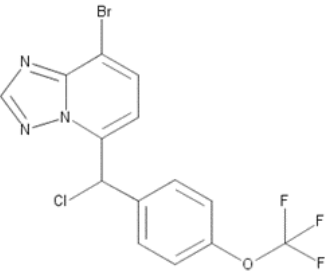
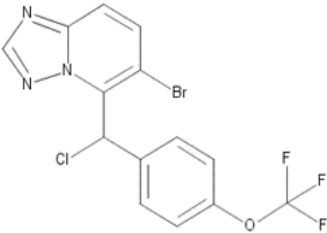
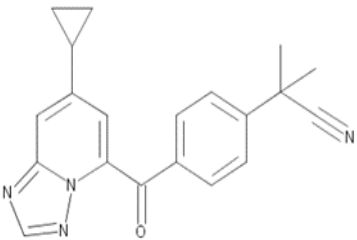
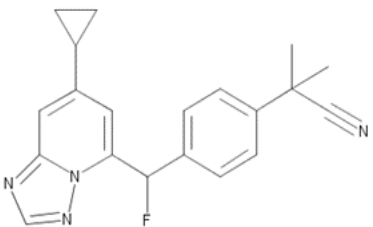
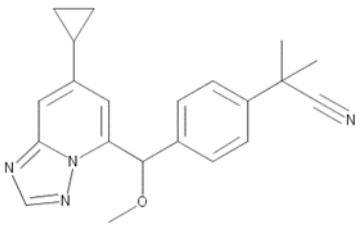
5	101		378.3	
10	102			100-102
20	103			90-92
30	104			184-186

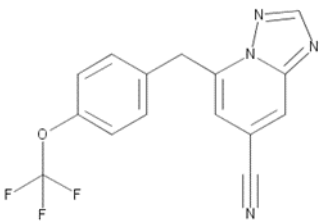
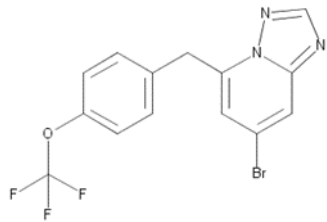
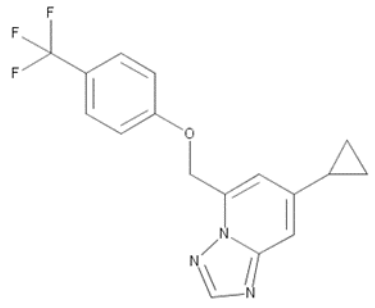
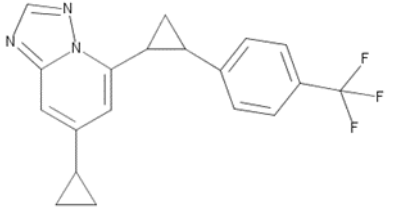
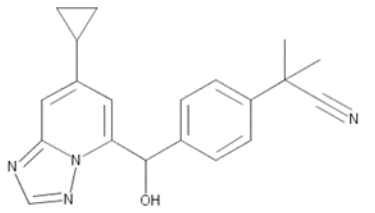
5	105		338.3	
10	106		382.3	
20	107		402.3	
30	108		330.2	
35				

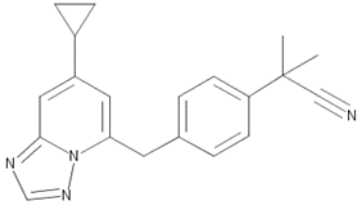
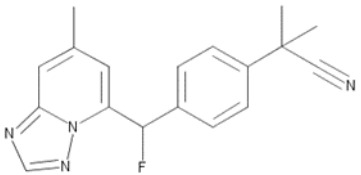
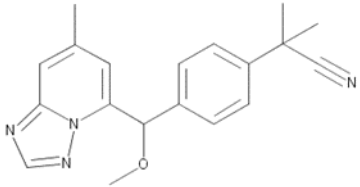
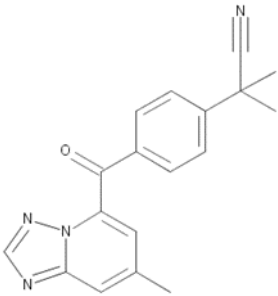
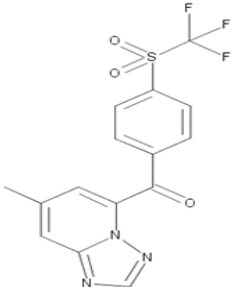
109		330.2	
110			150-153
111			139-142
112		320.2	

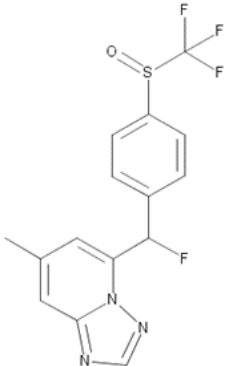
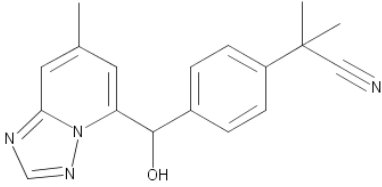
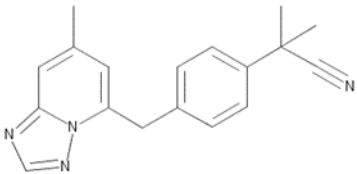
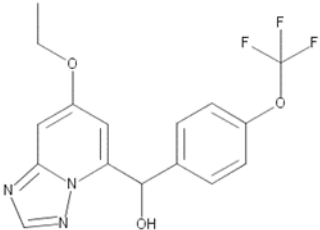
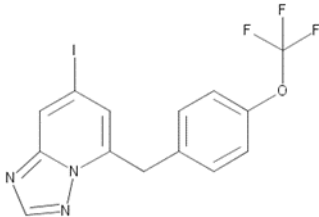
113			147-150°C
114			72-75°C
115			123-124°C
116			112-115°C

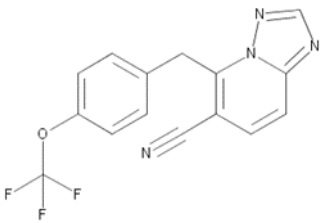
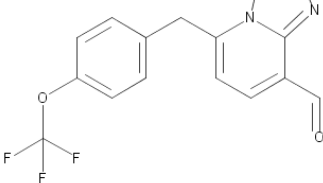
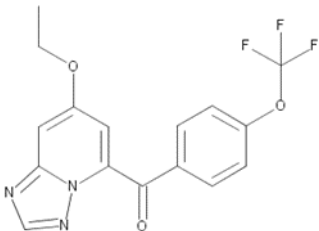
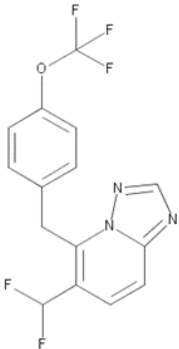
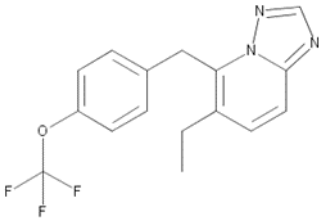
5	117		76-78°C
10	118		134-136°C
20	119		85-87°C
25	120		160-163°C
35	121		85-87°C

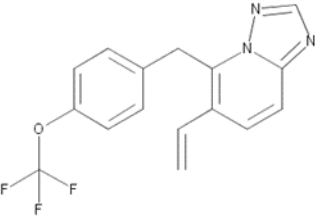
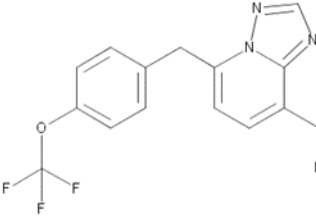
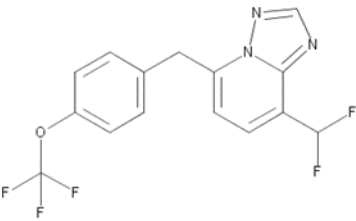
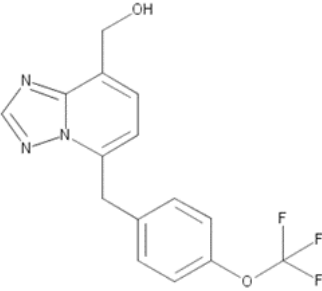
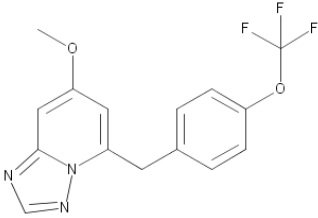
5	122			110-113°C
10	123		407.6	
15	124			147-149
25	125		335.4	
35	126			145-147°C

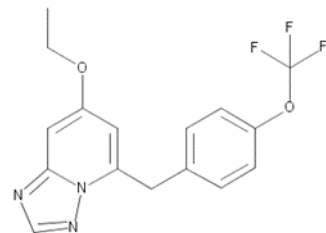
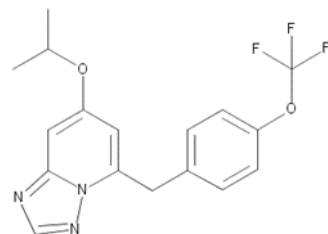
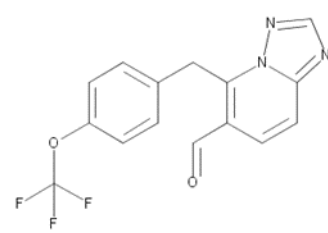
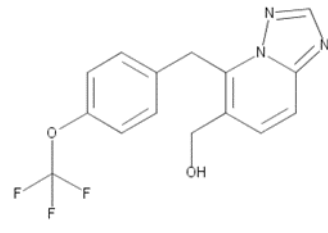
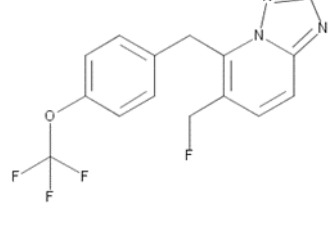
127			95-98°C
128			84-87°C
129		334.3	
130		343.35	
131			146-148

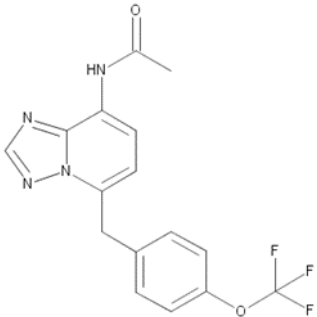
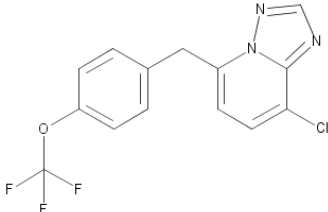
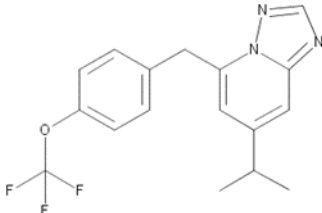
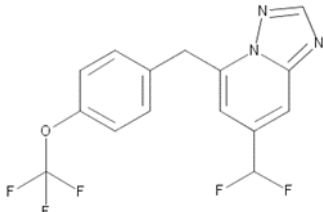
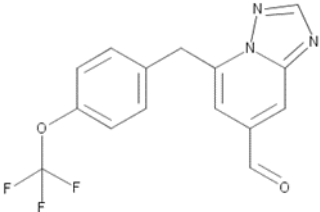
5	132		317.4	
10	133			116-118
15	134			111-113
20	135			113-115
30	136			158-160
35				

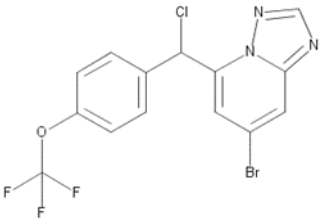
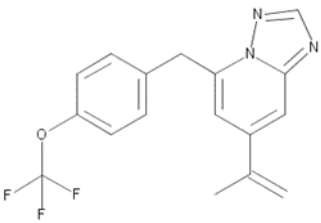
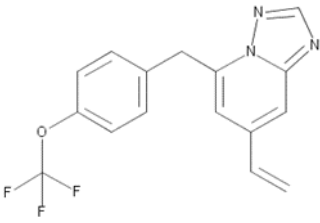
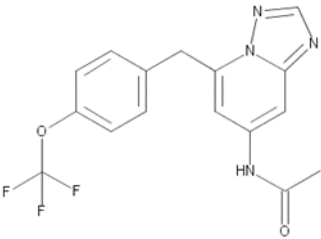
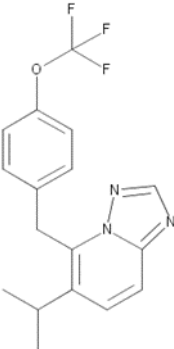
5	137		358.2	
10	138		184-186	
15	139		92-94	
20	140		190-192	
25	141		102-105	

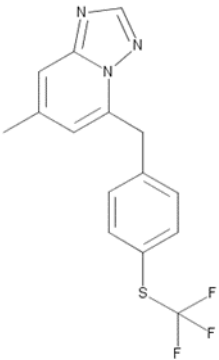
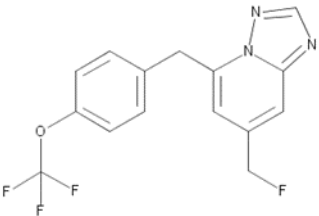
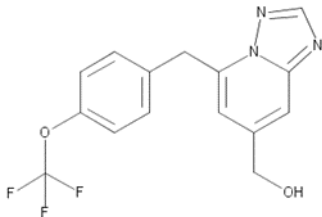
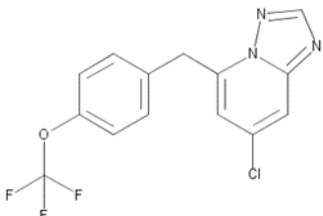
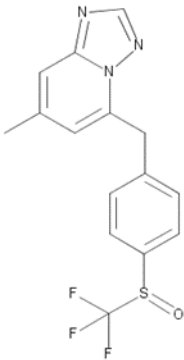
5	142	 <chem>Cc1ccc2nc3ccccc3nn2c1OC(F)(F)F</chem>	103-106
10	143	 <chem>Cc1ccc2nc3ccccc3nn2c1OC(F)(F)F</chem>	322.2
15	144	 <chem>CCOc1ccc2nc3ccccc3nn2c1OC(F)(F)F</chem>	129-131
25	145	 <chem>CC(F)Fc1ccc2nc3ccccc3nn2c1OC(F)(F)F</chem>	344.2
35	146	 <chem>CCc1ccc2nc3ccccc3nn2c1OC(F)(F)F</chem>	322.3

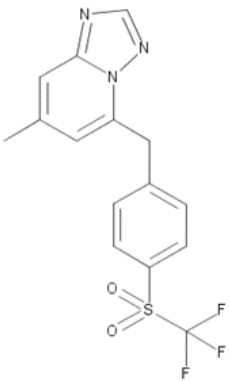
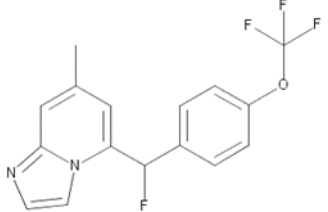
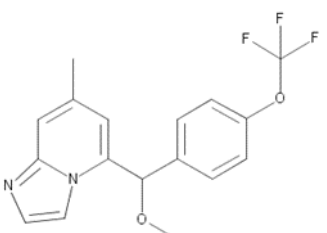
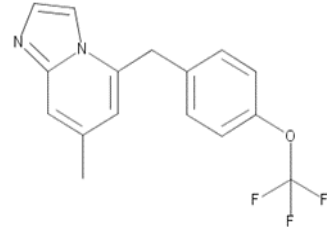
147			80-83
148		326.1	
149		344.2	
150			95-97
151			87-90

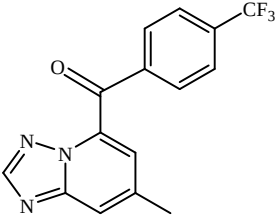
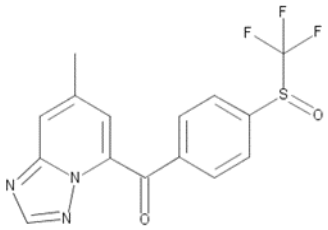
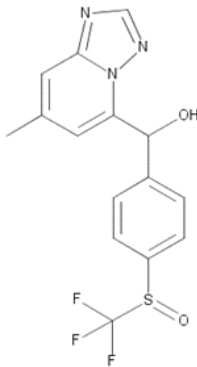
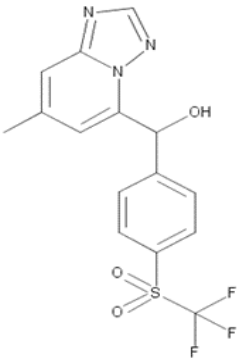
152			100-102
153			107-110
154			114-117
155			143-146
156			83-86

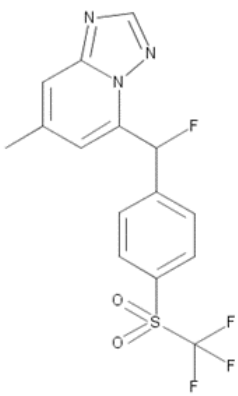
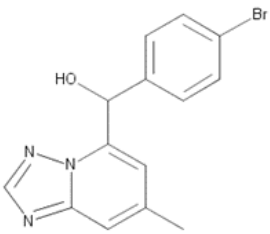
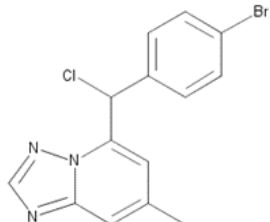
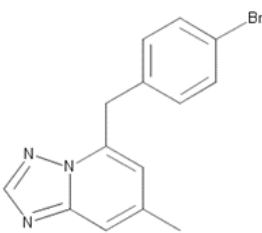
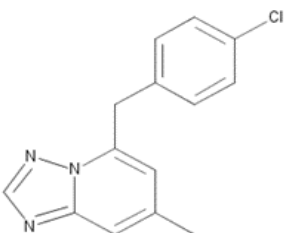
5	157		93-96
10	158		328.6
15	159		336.3
20	160		97-100
25	161		130-132
30			
35			

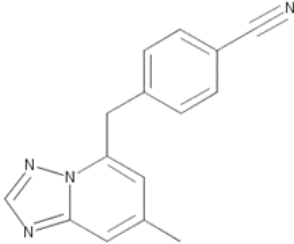
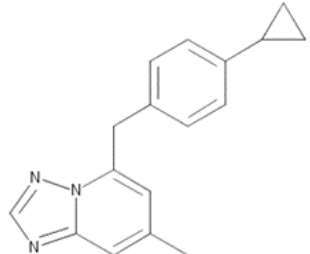
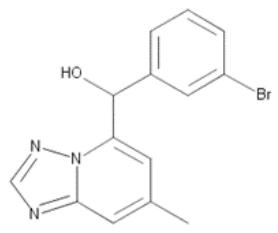
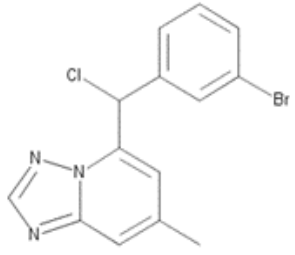
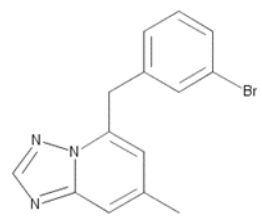
5	162		96-99
10	163		72-75
15	164		85-87
20	165		121-124
30	166		336.3

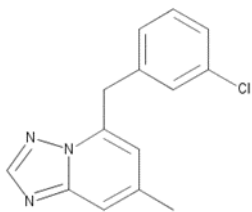
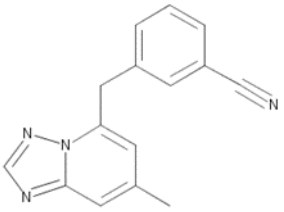
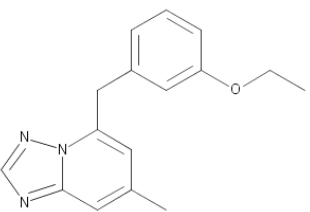
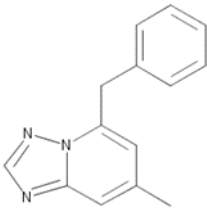
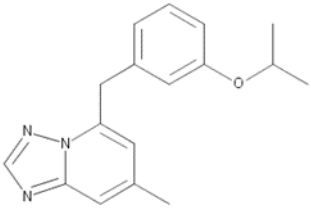
167			115-118
168			95-97
169			130-133
170			82-85
171			95-98

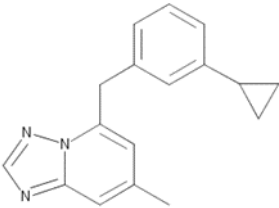
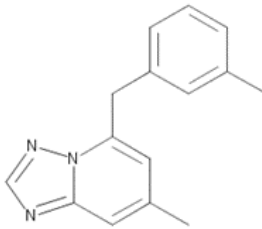
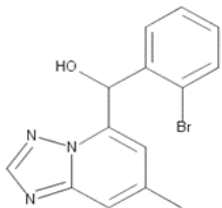
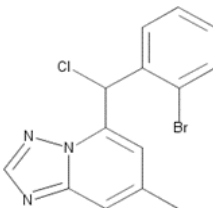
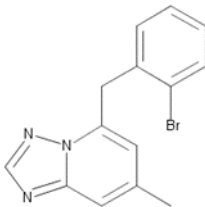
5				
10	172		356.2	
15	173		325.1	
20	174		337.2	
25	175			94-97°C

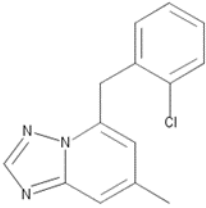
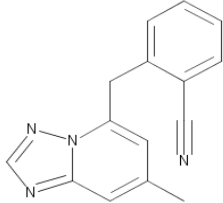
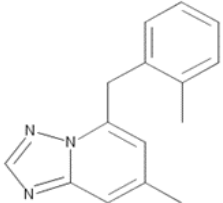
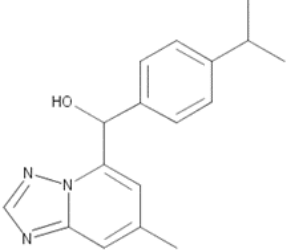
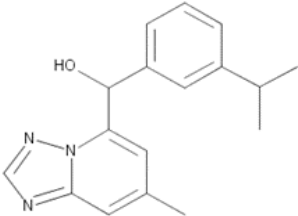
176		306.1	
177			172-175
178			163-166
179			175-178

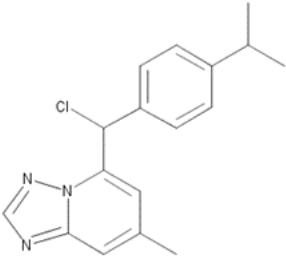
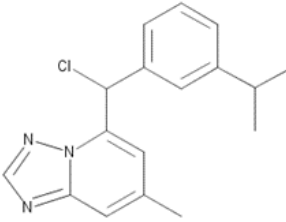
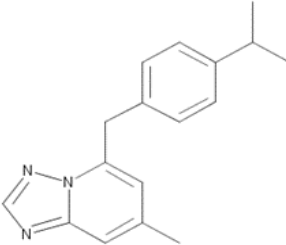
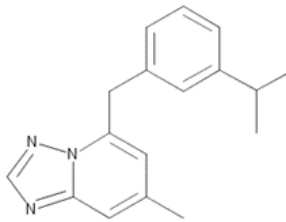
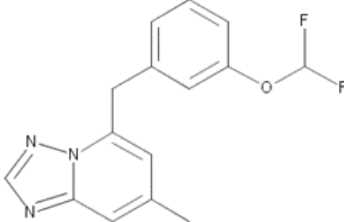
5	180		100-102
10	181		319.9
15	182		338
20	183		300
25	184		258.1
30			
35			

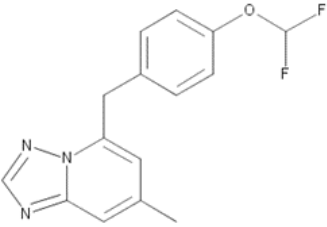
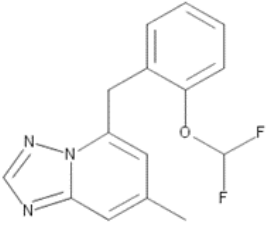
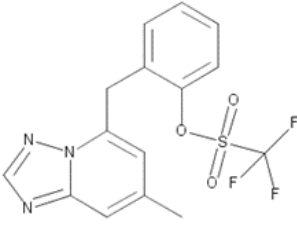
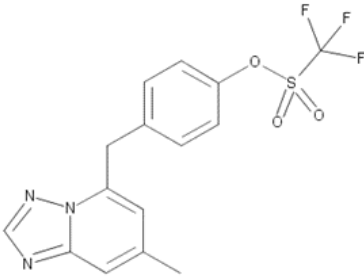
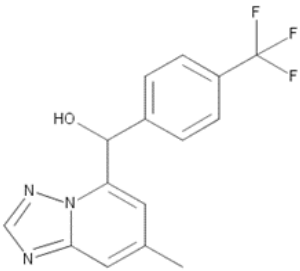
5	185	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C#N)cc3</chem>	247.1	
10	186	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C4CC4)cc3</chem>	262.1	
15	187	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(cc3C(=O)O)Br</chem>	319.9	
20	188	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(cc3C(=O)Cl)Br</chem>	338	
25	189	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(Br)cc3</chem>	300.1	
30				
35				

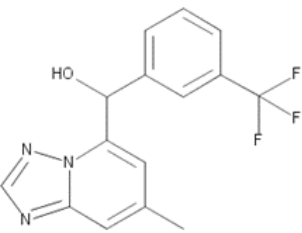
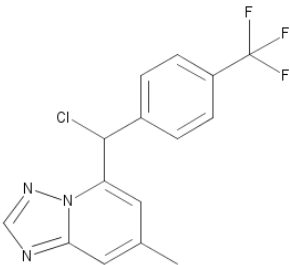
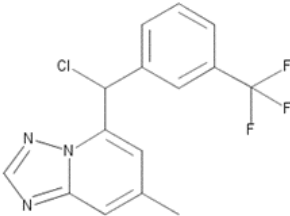
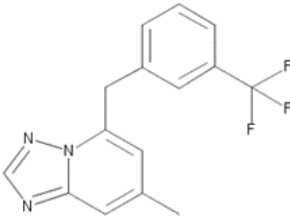
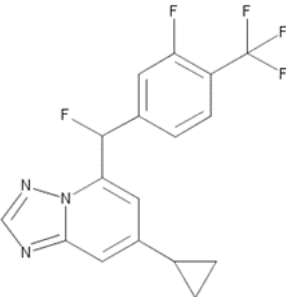
190		256.1	
191		247.2	
192		266.2	
193		224.2	
194		282.3	

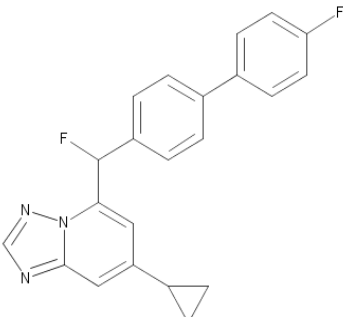
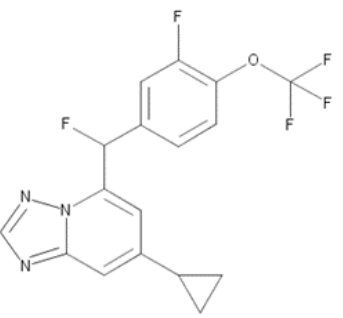
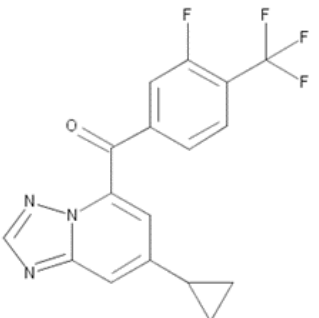
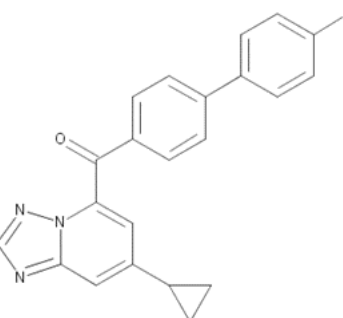
195		262.2	
196		236.2	
197		318	
198		338	
199		300	

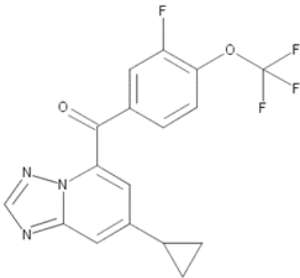
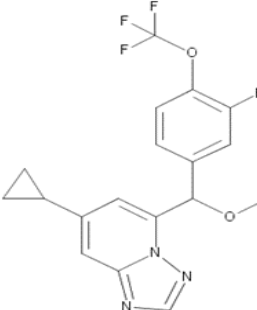
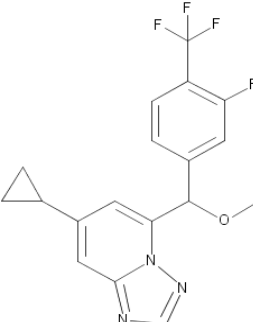
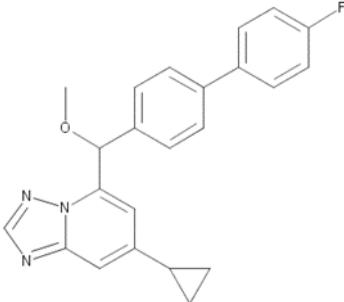
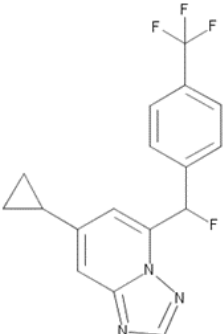
200	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(Cl)cc3</chem>	256.1	
201	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C#N)cc3</chem>	247.1	
202	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3ccc(C)cc3</chem>	282.2	
203	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1Cc3cc(C(C)C)c(O)cc3</chem>	280.2	
204	 <chem>Cc1cc2ncnc2n1C3=CC=C(C(C)C)C(O)=C3</chem>	300.3	

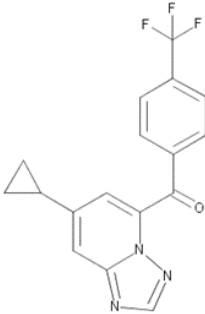
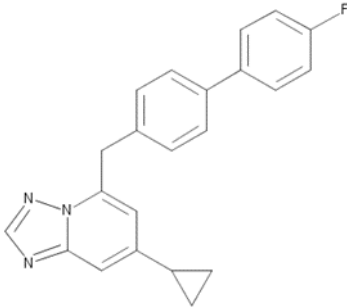
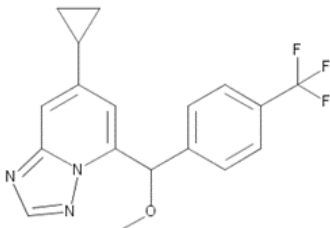
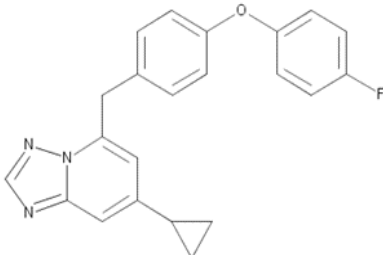
205		300.2	
206		282.2	
207		264.2	
208		264.3	
209		290.3	

210		288.2	
211		288.2	
212		370.2	
213		370.1	
214		306.2	

215		306.2	
216		326.3	
217		326.3	
218		290.2	
219		354.4	

220		362.5	
221		370.4	
222		350.5	
223		358.3	

224		366.5	
225		382.6	
226		366.5	
227		374.4	
228		336.2	

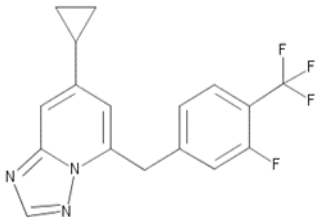
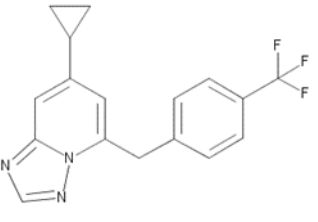
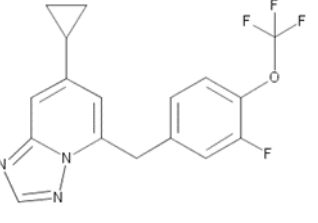
5				
10	229		332.5	
15	230		344.4	
20	231		348.3	
25	232		360.4	
30				
35				

5

10

15

20

233		336.3	
234		318.3	
235		352.3	

Las siguientes pruebas demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta divulgación en plagas específicas. "Eficacia de control" representa la inhibición del desarrollo (incluida la mortalidad) de plagas de invertebrados que provoca una reducción significativa de la alimentación. Sin embargo, la protección mediante el control de plagas proporcionada por los compuestos no se limita a estas especies. Véase la Tabla de Índices A para consultar las descripciones de los compuestos.

EJEMPLOS BIOLÓGICOS

Las siguientes pruebas demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta divulgación en plagas específicas. "Eficacia de control" representa la inhibición del desarrollo (incluida la mortalidad) de plagas de invertebrados que provoca una reducción significativa de la alimentación. Sin embargo, la protección mediante el control de plagas proporcionada por los compuestos no se limita a estas especies. Véase la Tabla de Índices A para consultar las descripciones de los compuestos.

Formulación y metodología de pulverización para los Ensayos A-E

Se formularon los compuestos de prueba usando 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 atomizada 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.

Ensayo A

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

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron a 250, 50, 10 y 2 ppm con tres repeticiones como se ha descrito anteriormente. Después de la pulverización del compuesto de prueba formulado, las unidades de prueba se dejaron secar durante 1 h antes de ser post-infestadas 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 a 24 °C y una humedad relativa del 50–70 %. Después, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 250 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 14, 18, 19, 20, 21, 29, 32, 33, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 58, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 71, 72, 79, 80, 82, 83, 84, 86, 94, 95, 111, 116, 117, 128, 129, 130, 141, 151, 152, 159, 160, 162, 163, 164, 183, 186, 207, 208, 213, 219, 221, 225, 226, 228, 229, 231, 233, 234, 235.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 2, 7, 8, 9, 10, 12, 14, 18, 19, 20, 21, 29, 32, 33, 48, 49, 52, 53, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 71, 72, 79, 80, 82, 83, 84, 86, 94, 95, 111, 116, 117, 128, 129, 130, 141, 151, 152, 159, 160, 162, 163, 164, 183, 186, 207, 208, 213, 219, 221, 225, 226, 228, 229, 231, 233, 234, 235.

Ensayo C

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

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron a 250, 50 y 10 ppm con tres réplicas, como se ha descrito anteriormente. 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 a 21 °C y una humedad relativa del 50–70 %. Después, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 250 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 8, 10, 18, 21, 32, 33, 52, 53, 63, 67, 72, 79, 80,

82, 83, 84, 86, 94, 95, 103, 116, 117, 128, 129, 130, 141, 151, 159, 160, 164, 219, 221, 226, 228, 231, 233, 234, 235.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 18, 21, 83, 94, 117, 128, 129, 130, 141, 219, 228, 234.

Ensayo D

Para evaluar el control del pulgón del melón y del algodonero (*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. Ésta 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.

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron a 250, 50 y 10 ppm con tres réplicas, como se ha descrito anteriormente. Después de la pulverización, las unidades de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento durante 6 días a 19 °C y una humedad relativa del 70 %. Después, cada unidad de prueba se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 250 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 2, 3, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 16, 18, 19, 20, 21, 27, 32, 33, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 71, 72, 79, 80, 82, 83, 84, 86, 94, 95, 103, 116, 117, 128, 130, 132, 137, 141, 151, 159, 162, 219, 221, 222, 224, 226, 228, 229, 231, 233, 234, 235.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos el 80 %: 7, 8, 9, 10, 12, 14, 18, 21, 27, 32, 33, 48, 52, 53, 57, 60, 61, 62, 63, 64, 72, 79, 80, 82, 83, 84, 86, 94, 95, 103, 116, 117, 128, 130, 132, 137, 141, 151, 159, 219, 221, 222, 228, 229, 231, 233, 234, 235.

Ensayo F

Para evaluar el control de la mosca blanca del boniato (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) a través del contacto y/o medios sistémicos, la unidad de ensayo consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de soja de 8 a 9 días de edad en su interior. Antes de aplicar la pulverización, se retiraron ambos cotiledones y un unifoliado de la planta, dejando una hoja verdadera para la prueba. Se dejó que las moscas blancas adultas pusieran huevos sobre la planta y después se retiraron de la unidad de prueba. Las plantas de soja infestadas con al menos 15 huevos se sometieron a la prueba de pulverización.

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

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 250 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos un 70 %: 2, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 14, 18, 19, 21, 27, 32,

33, 48, 49, 53, 60, 61, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 72, 80, 82, 83, 84, 86, 94, 95, 101, 102, 103, 116, 128, 129, 132, 141, 151, 159, 219, 221, 224, 225, 226, 228, 229, 231, 232, 233, 234, 235.

De los compuestos de Fórmula 1 evaluados en una concentración de 50 ppm, los siguientes dieron como resultado una mortalidad de al menos un 70%: 2, 8, 9, 10, 11, 18, 21, 27, 32, 33, 53, 60, 64, 66, 72, 80, 83, 84, 94, 101, 102, 103, 116, 128, 129, 132, 141, 151, 159, 219, 221, 226, 228, 231, 233, 234, 235.

Ensayo G

Para evaluar el control de la polilla dorso de diamante (*Plutella xylostella* L.) a través del contacto y/o medios sistémicos, cada unidad de prueba consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de mostaza de 10 a 12 días de vida en su interior.

Los compuestos de prueba se formularon y pulverizaron a 250 ppm con tres réplicas, como se ha descrito anteriormente. Después de la pulverización, las unidades de prueba se dejaron secar durante 1 hora antes de infestarlas con 30-50 larvas recién nacidas. Se colocó una tapa negra con malla sobre cada recipiente. Las unidades de prueba se mantuvieron durante seis días en una cámara de crecimiento a 24-25 °C y una humedad relativa del 70 %. 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 250 ppm, los siguientes proporcionaron unos niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (20 % o menos de daño por alimentación): 3, 46, 58, 67, 75, 77, 78, 82, 83, 93, 97, 98, 99, 100, 112, 121, 142, 145, 148, 158, 160.