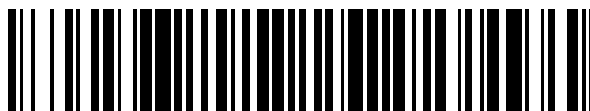


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 448 015**

51 Int. Cl.:

C07D 413/10 (2006.01)

C07D 413/14 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **01.08.2007 E 10197328 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **01.01.2014 EP 2330106**

54 Título: **Isoxazolinas insecticidas**

30 Prioridad:

15.08.2006 JP 2006221370

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

13.03.2014

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim am Rhein , DE**

72 Inventor/es:

**MIHARA, JUN;
MURATA, TETSUYA;
YAMAZAKI, DAIEL;
YONETA, YASUSHI DR.;
SHIBUYA, KATSUHIKO;
SHIMOJO, EIICHI y
GÖRGENS, ULRICH**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 448 015 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

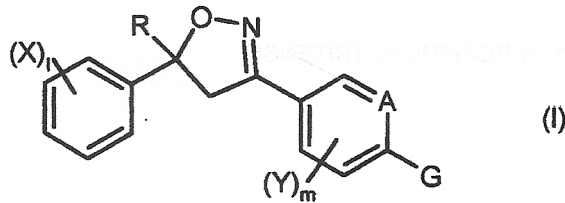
DESCRIPCION

Isoxazolinas insecticidas

La presente invención se refiere a una nueva isoxazolina, así como su uso para el control de parásitos animales.

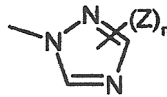
5 El Documento WO 2005/085216 describe que las benzamidas isoxazolino substituidas son útiles como agentes para el control de plagas.

Se ha encontrado, ahora, un nuevo compuesto isoxazolino de la fórmula siguiente (I)



en la que:

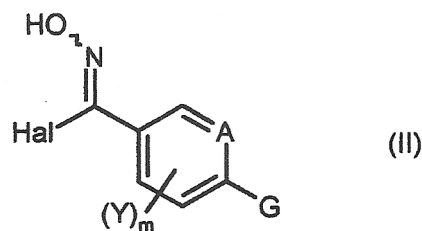
- A representa C;
- 10 R representa CF₃;
- X representa enlace cloro en la posición 3 y 5 del anillo;
- I representa 2;
- Y representa enlace ciano en el átomo de carbono que está marcado con A;
- m 1; y
- 15 G representa G-6, a saber



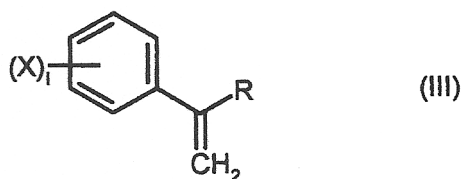
G-6

en la cual

- Z representa halógeno, alquilo, alquiltio, haloalquilo, ciano, nitro o amino; y
- n representa 0.
- 20 Los compuestos de la fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, pueden obtenerse mediante un procedimiento en el cual
- (a) compuestos de la fórmula (II)



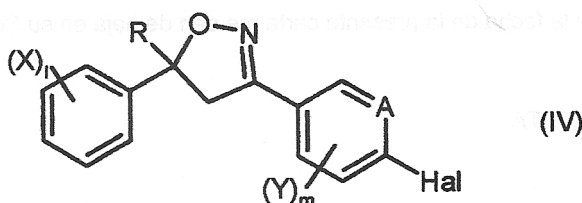
en la que A, Y, m y G tienen el mismo significado anterior y Hal representa halógeno, han reaccionado con compuestos de la fórmula (III)



5 en la que R, X y 1 tienen el mismo significado anterior, en la presencia de disolventes inertes, y en los casos apropiados, en la presencia de una base,

o

(b) compuestos de la fórmula (IV)



10 en la que A, R, X, 1, Y, m y Hal tienen el mismo significado anterior, han reaccionado con compuestos de la fórmula (V)



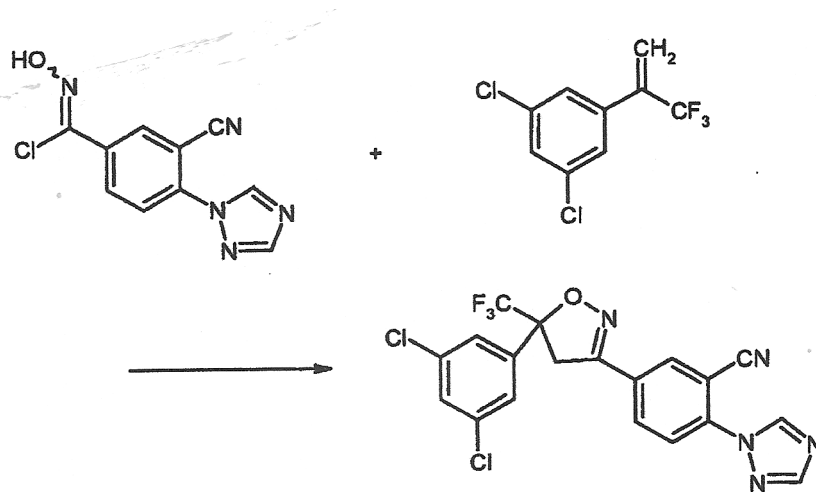
15 en la que G tiene el mismo significado anterior, en la presencia de disolventes inertes, y en los casos apropiados, en la presencia de una base.

20 De acuerdo con la presente invención, el compuesto isoxazolino de la fórmula (I) tiene una fuerte actividad insecticida. Más aún, se ha encontrado que el nuevo compuesto de fórmula (I) tiene propiedades biológicas pronunciadas y es especialmente adecuado para el control de plagas animales, en particular insectos, arácnidos y nematodos que se encuentran en agricultura, en bosques, en la protección de productos almacenados y en la protección de materiales, e igualmente en el sector de la higiene así como en el campo veterinario.

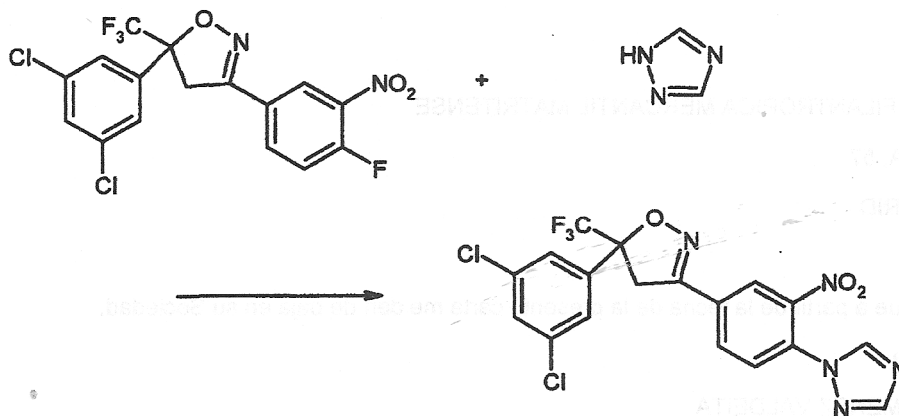
El término "halógeno" indica flúor, cloro, bromo o yodo y preferiblemente flúor, cloro o bromo.

El compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención tiene carbonos asimétricos y, en consecuencia, incluye isómeros ópticos o geométricos o mezclas isómeras correspondientes de composición variable. La invención se refiere tanto a los isómeros puros como a las mezclas de isómeros.

25 El procedimiento de preparación anterior (a) puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente, cuando, por ejemplo, el cloruro de 3-ciano-N-hidroxi-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzenocarboximidoilo y el 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benzeno se usan como materiales de partida.

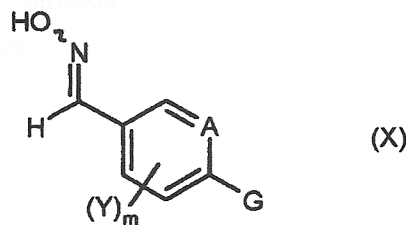


El procedimiento de preparación anterior (b) puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente, cuando, por ejemplo, el 3-(4-fluoro-3-nitrofenil)-5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol y el 1H-1,2,4-triazol se usan como materiales de partida.



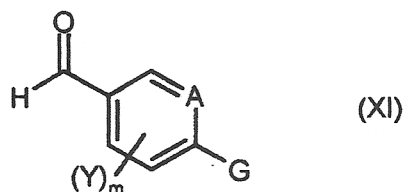
5

El material de partida usado en el procedimiento de preparación (a), a saber los compuestos de partida de la fórmula (II), son compuestos nuevos, y pueden obtenerse mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (X)



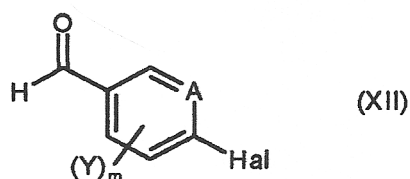
en la que A, Y, m y G tienen el mismo significado anterior, con agentes de halogenación.

10 Los compuestos de la fórmula anterior (X) pueden obtenerse mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (XI)



en la que A, Y, m y G tienen el mismo significado anterior, con hidroxilamina o sales de la misma.

Los compuestos de la fórmula (XI) pueden obtenerse mediante la reacción, por ejemplo, de compuestos de la fórmula (XII)



5

en la que A, Y, m y Hal tienen el mismo significado anterior, con compuestos de fórmula (V).

Los aldehídos anteriormente mencionados pueden sintetizarse, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento descrito en *Journal of Medicinal Chemistry*, vol. 46, págs. 4232-4235, (2003).

10 Los ejemplos preferibles de nuevos compuestos entre los compuestos de la fórmula (XI) incluyen: 5-formil-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzocitrilo.

Los ejemplos típicos de los compuestos de la fórmula (X) incluyen: 5-[(hidroxiimino)metil]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzocitrilo.

Los compuestos de las fórmulas (II), (X) incluyen isómeros ópticos o geométricos o mezclas isómeras correspondientes de composición variable. La invención se refiere tanto a los isómeros puros como a las mezclas de isómeros.

15 Igualmente, el agente de halogenación usable en la preparación en la preparación de los compuestos de la fórmula (II) son generalmente conocidos para la persona experta e incluyen, por ejemplo, cloro, bromo, yodo, N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, N-yodosuccinimida, 1,3-dicloro-3,5-dimetilhidantoína, 1,3-dibromo-3,5-dimetilhidantoína, tetracloroyodato de benciltrimetilamonio e hipoclorito sódico.

20 Los compuestos típicos de la fórmula (II), que es el material de partida en el procedimiento de preparación (a), incluyen por ejemplo: cloruro de 3-ciano-N-hidroxi-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzocitrilo.

Los compuestos de la fórmula (III) que se usan como el otro material de partida en el procedimiento de preparación (a), incluyen compuestos conocidos y los cuales, por ejemplo, se describen en el *Journal of Organic Chemistry*, vol. 56, págs. 7336-7340, (1991); *idem*, vol. 59, págs. 2898-2901, (1994); e *idem*, vol. 95, págs. 167-170, (1999); y Documento WO 2005/05085216A.

25 Igualmente, los compuestos de la fórmula (III) pueden sintetizarse mediante los procedimientos descritos en estas publicaciones.

Los ejemplos típicos de los compuestos de la fórmula (III) incluyen: 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno.

El procedimiento de preparación (a) puede llevarse a cabo de acuerdo con los procedimientos descritos en: Documento WO 2004/018410A, Documento WO 2005/085216A, o *Tetrahedron*, vol. 56, págs. 1057-1064, (2000).

30 La reacción del procedimiento de preparación (a) puede llevarse a cabo en un diluyente o disolvente apropiado. Los ejemplos de los mismos incluyen hidrocarburos alifáticos (hexano, ciclohexano, heptano y otros), hidrocarburos aromáticos (benceno, tolueno, xileno, clorobenceno y otros), alcoholes (metanol, etanol, isopropanol y otros), éteres [dietil éter, dibutil éter, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano, dioxano y otros], amidas de ácido [dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona y otras], nitrilos (acetitrilo, propionitrilo y otros), dimetilsulfóxido (DMO), agua o mezclas de estos disolventes.

35 La reacción del procedimiento de preparación (a) puede llevarse a cabo usando una base, tal como por ejemplo una base de metal alcalino tal como carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato sódico, bicarbonato potásico,

acetato sódico, acetato potásico, metóxido sódico, etóxido sódico o terc-butóxido potásico; una base orgánica tal como trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, 4-terc-butil-N,N-dimetilanilina, piridina, picolina, lutidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclooctano o imidazol.

5 La reacción del procedimiento de preparación (a) puede llevarse a cabo en un amplio intervalo de temperatura. La reacción puede llevarse a cabo a una temperatura dentro del intervalo de usualmente aproximadamente -78°C hasta aproximadamente 200°C y preferiblemente -10 hasta aproximadamente 150°C. Igualmente, esta reacción puede llevarse a cabo bajo presión elevada o bajo presión reducida aunque preferiblemente se lleva a cabo bajo presión normal. El tiempo de reacción es 0,1 hasta 72 horas, preferiblemente 1 a 24 horas.

10 Cuando el procedimiento de preparación (a) se lleva a cabo, por ejemplo, se hace reaccionar una cantidad molar de 1 a 2 de los compuestos de fórmula (III) y una cantidad 1 molar hasta ligeramente en exceso de una base por mol de los compuestos de la fórmula (II) en un diluyente, tal como por ejemplo, DMF, se obtienen los compuestos deseados de la fórmula (I).

Los compuestos de la fórmula (IV) los cuales son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (b) son conocidos y están descritos, por ejemplo, en el Documento WO 2005/085216A.

15 Los ejemplos típicos de los compuestos de la fórmula (IV) incluyen: 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-fluorobenzonitrilo.

Los compuestos de la fórmula (V) los cuales son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (b) son bien conocidos en los campos de la química orgánica y los ejemplos típicos de los mismos incluyen: 1H-1,2,4-triazol.

20 Dichos azoles pueden sintetizarse mediante los procedimientos descritos en el *Journal of Medicinal Chemistry*, vol. 48, págs. 5780-5793, (2005), *Monatshefte für Chemie*, vol. 124, págs. 199-207, (1993) y *Tetrahedron Letters*, vol. 37, págs. 1829-1832, (1996).

La reacción del procedimiento de preparación (b) puede llevarse a cabo en un diluyente o disolvente apropiado. Los ejemplos de los mismos incluyen:

25 hidrocarburos alifáticos (hexano, ciclohexano, heptano y otros), hidrocarburos aromáticos (benceno, tolueno, xileno, clorobenceno y otros), éteres [dietil éter, dibutil éter, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano, dioxano y otros], amidas de ácido [dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona y otras], nitrilos (acetónitrilo, propionitrilo y otros), dimetilsulfóxido (DMO), agua o mezclas de estos disolventes.

30 La reacción en el procedimiento de preparación (b) puede llevarse a cabo usando una base, tal como por ejemplo una base de metal alcalino tal como hidruro de litio, hidruro sódico, hidruro potásico, amida de litio, amida sódica, diisopropilamida de litio, butil litio, terc-butil litio, trimetilsilil litio, hexametildisilazida de litio, carbonato sódico, carbonato potásico, acetato sódico, acetato potásico, metóxido sódico, etóxido sódico o terc-butóxido potásico o una base orgánica tal como trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, 4-terc-butil-N,N-dimetilanilina, piridina, picolina, lutidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclooctano o imidazol.

35 La reacción del procedimiento de preparación (b) puede llevarse a cabo en un amplio intervalo de temperatura. La reacción puede llevarse a cabo a una temperatura dentro del intervalo de usualmente aproximadamente -78°C hasta aproximadamente 200°C y preferiblemente -10 hasta aproximadamente 150°C. Igualmente, esta reacción puede llevarse a cabo bajo presión elevada o bajo presión reducida, aunque preferiblemente se lleva a cabo bajo presión normal. El tiempo de reacción es 0,1 hasta 72 horas y preferiblemente 1 a 24 horas.

40 Cuando el procedimiento de preparación (b) se lleva a cabo, por ejemplo, se hace reaccionar una cantidad molar de 1 a 3 de los compuestos de fórmula (V) por mol de los compuestos de la fórmula (IV) en la presencia de una cantidad de 1 mol a 3 mol de una base en un diluyente, tal como por ejemplo, DMF, se obtienen los compuestos deseados de la fórmula (I).

Los compuestos de las fórmulas (II), los cuales se usan para la preparación de compuestos de la fórmula (I), son compuestos nuevos.

45 El compuesto de la fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, tiene fuerte actividad insecticida. Más aún, los compuestos de acuerdo con la invención muestran fuerte actividad contra plagas de animales y, en consecuencia, pueden usarse en para el control de plagas de animales.

De acuerdo con ello, el compuesto representado por la fórmula (I), de acuerdo con la presente invención, puede usarse como insecticidas, o para la fabricación de una composición para el control de plagas animales.

En la presente invención, todos los compuestos, composiciones y materiales que tienen una acción insecticida sobre plagas se denominan en la presente invención insecticidas.

Además, el compuesto activo representado por la fórmula (I) de acuerdo con la presente invención, muestra un efecto de control de insectos perjudiciales sin impartir específicamente ninguna fitotoxicidad a las plantas de cultivo.

De acuerdo con ello, los compuestos de la presente invención pueden usarse para controlar una amplia diversidad de diversas plagas animales. En particular, para el control de insectos chupadores, insectos masticadores y otras plagas parasíticas de plantas, plagas de productos almacenados y plagas en el sector de la higiene. Más aún, los compuestos de la presente invención pueden aplicarse para combatir, tal como, por ejemplo, exterminar y destruir, estas plagas.

Los ejemplos de dichas plagas incluyen:

10 de Insectos, plagas de Coleópteros, por ejemplo, *Callosobruchus Chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomla rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp, *Monochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lyctus bruneus* y *Aulacophora femoralis*;

15 plagas de Lepidópteros, por ejemplo, *Lymantria dispar*, *Malacosoma neustria*, *Pieris rapae*, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Chilo suppressalis*, *Pyrausa nubilalis*, *Ephestia cautella*, *Adoxophyes orana*, *Carpocapsa pomonella*, *Agrostisfucosa*, *Galleria mellonella*, *Plutella maculipennis*, *Heliothis virescens* y *Phyllonistis citella*;

plagas de Hemípteros, por ejemplo, *Nephotix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Pseudococcus comstocki*, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicas*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Phopalosiphum pseudobrassicis*, *Stephanitis nashi*, *Nazara* spp., *Trialeurodes vaporariorum* y *Phylla* spp.;

20 plagas de Tisanópteros, por ejemplo, *Thrips palmi* y *Franklinella occidentalis*;

plagas de Ortópteros, por ejemplo, *Blatella germanica*, *Periplaneta americana*, *Grylotalpa africana* y *Locusta migratoria migratoria*;

plagas de Isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes speratus* y *Coptotermes formosanus*; y

25 plagas de Dípteros, por ejemplo, *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipiens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus* y *Liriomyza trifolii*;

y de Acaros, por ejemplo, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Aculops pelekassi* y *Tarsonemus* spp.

Otros ejemplos de plagas incluyen:

30 de Nematodos, por ejemplo, *Meloidogyne incognita*, *Bursaphelenchus lignocolus* Mamiya et Kiyohara, *Aphelenchoides besseyi*, *Heterodera glycines* y *Pratylenchus* spp.

Adicionalmente, se ha encontrado que los nuevos compuestos de la presente invención son activos contra parásitos animales y, en consecuencia, pueden usarse de manera eficaz para combatir diversos parásitos animales perjudiciales (endo- y ectoparásitos), tal como, por ejemplo, en el campo veterinario, insectos y helmintos.

Los ejemplos de dichos parásitos de animales pueden incluir las plagas siguientes:

35 de insectos, por ejemplo, *Gastrophilus* spp., *Stomoxys* spp., *Trichodectes* spp., *Rhodnius* spp., *Ctenocephalidescanis*, *Cimex lecturarius*, *Ctenocephalides felis* y *Lucile cuprina*.

de Acaros, por ejemplo, *Omithodoros* spp., *Ixodes* spp. y *Boophilus* spp.

40 Tal como ya se ha mencionado anteriormente, en los campos veterinarios, por ejemplo, en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos activos de acuerdo con la presente invención son activos contra parásitos animales (ecto- y endoparásitos) tales como garrapatas de cuerpo duro, garrapatas de cuerpo blando, ácaros de la sarna, ácaros de la cosecha, moscas (picadoras y lamedoras), larvas de mosca parasíticas, piojo, piojo del pelo, ácaros de los pájaros, piojo del pájaro y pulgas.

Estos parásitos incluyen:

45 del orden de los Anopluros, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Lignonathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.; los ejemplos particulares son: *Lignonathus setosus*, *Lignonathus vituli*, *Lignonathus ovillus*, *Lignonathus oviformis*, *Lignonathus pedalis*, *Lignonathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus eurystemus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus vastratrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*;

50 del orden de los Malófagos y los subórdenes Ambliceros e Isnóceros, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Monopon* spp., *Trinopon* spp, *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Tri-*

chodectes spp., Felicola spp.; los ejemplos particulares son: Bovicola bovis, Bovicola ovis, Bovicola limbata, Damalina bovis, Trichodectes canis, Felicola subrostratus, Bovicola caprae, Lepikentron ovis, Werneckiella equi;

5 porcedentes del orden de los Dípteros y los subórdenes Nematóceros y Braquíceros, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Colu-
 10 coides spp., Chrysops spp., Odagmia spp., Wilhemia spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., aematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematopobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrosomyia spp., Wohlfahrtia-
 15 Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Me-
 20 lophagus spp., Rhinoestrus spp., Tipula spp.; los ejemplos particulares son: Aedes aegypti, Aedes albopic-
 tus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles gambiae, Anopheles maculipennis, Calliphora erythrocephala, Chry-
 sozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex tarsalis, Fannia canicularis, Sarcophaga car-
 naria, Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Simulium reptans, Phleboto-
 mus papatasi, Phlebotomus longipalpis, Odagmia ornata, Wilhelmsia equina, Bootphora erythrocephala, Ta-
 banus bromius, Tabanus spodopterus, Tabanus atratus, Tabanus sudeticus, Hybomitra ciurea, Chrysops
 caeculiensis, Chrysops relictus, Haematopota pluvialis, Haematopota itálica, Musca autumnalis, Muscado-
 mestica, Haematobia irritans, Haematobia irritans exigua, Haematobia stimulans, Hydrotaea irritans, Hydro-
 taea albigutta, Chrosomyia chloropyga, Chrosoma bezziana, Oestrus ovis, Hypoderma bovis, Hypoderma
 lineatum, Przhivalskiana silenus, Dermatobia hominis, Melophagus ovinus, Lipoptena capreoli, Lipoptena
 cervi, Hippobosca variegata, Hippobosca equina, gasterophilus intestinalis, gasterophilus haemorrhoidalis,
 Gasterophilus inermis, Gasterophilus nasalis, Gasterophilus nigricornis, gasterophilus pecorum, Braula
 coeca;

25 del orden de los Sifonápteros, por ejemplo Pulex spp., Clenocephalides spp., Tunga spp., Xenopsylla spp.,
 Ceratophyllus spp.; los ejemplos particulares son: Clenocephalides canis, Clenocephalides felis, Pulex irri-
 tans, Tunga penetrans, Xenophylla cheopis;

del orden de los Heterópteros, por ejemplo Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.;

del orden de los Blatoideos, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supe-
 30 lla spp., (por ejemplo, Supella longipalpa);

de la subclase de los Acari (Acaros) y los órdenes de las Meta- y Mesostigmata, por ejemplo Argas spp.,
 30 Omithodorus spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Rhipicephalus (Boophilus) spp., Dermacen-
 tor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Dermanyssus spp., Rhipicephalus spp. (el género original de
 garrapatas multihuésped), Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp.,
 Sternostoma spp., Varroa spp., Acarapis spp.; los ejemplos particulares son: Argas persicus, Argas reflexus,
 35 Ornithodorus moubata, Otobius megnini, Rhipicephalus (Boophilus) microplus, Rhipicephalus (Boophilus)
 decoloratus, Rhipicephalus (Boophilus) annulatus, Rhipicephalus (Boophilus) calceolatus, Hyalomma anat-
 olicum, Hyalomma aegypticum, Hyalomma marginatum, Hyalomma transiens, Rhipicephalus evertsi, Ixodes
 ricinus, Ixodes hexagonus, Ixodes canisuga, Ixodes pilosus, Ixodes tubicundus, Ixodes scapularis, Ixodes
 holocyclus, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis punctata, Haemaphysalis cinnabarina, Haemaphysalis
 otophila, Haemaphysalis leachi, Haemaphysalis longicornis, Dermacentor marginatum, Dermacentor reticulat-
 40 us, Dermacentor pictus, Dermacentor albipictus, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma
 mauritanicum, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus bursa, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicepha-
 lus capensis, Rhipicephalus turanicus, Rhipicephalus zambeziensis, Amblyomma americanum, Amblyomma
 variegatum, Amblyomma maculatum, Amblyomma hebraeum, Amblyomma cajennense, Demayssus galli-
 nae, Ornithonyssus bursa, Ornithonyssus sylviarum, Varroa jacobsoni;

45 del orden de los Actinédidos (Prostigmata) y Acarídidos (Astigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletie-
 lla spp., Omithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus
 spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp.,
 Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., La-
 50 minosioptes spp.; los ejemplos particulares son: Cheyletiella yasguri, Cheyletiella blakei, Demodex canis,
 Demodex bovis, Demodex ovis, Demodex caprae, Demox equi, Demodex caballi, Demodex suis, Neotrom-
 bicula autumnalis, Neotrombicula desaleri, Neoschöngastia xeromyrmecia, Trombicula akamushi, Otodec-
 tes cynotis, Notoedres cati, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae (=S, ca-
 prae), Sarcoptes equi, Sarcoptes suis, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, Chorioptes bovis,
 Psoroptes ovis, Pneumonyssoides Mange, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

55 Los compuestos activos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención son igualmente adecuados para el control de
 artrópodos que atacan al ganado agrícola tal como, por ejemplo, ganado vacuno, ganado ovino, cabras, caballos,
 cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos tales
 como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros enjaulados, peces de acuario y los que se conocen como animales expe-
 rimentales tales como, por ejemplo, hamsters, cobayas, ratas y ratones.

Mediante el control de estos artrópodos, se intenta reducir las muertes y mejorar el rendimiento (en el caso de la carne, leche, lana, cueros, huevos, miel, y similares), de manera que sea posible una cría más económica y sencilla del animal mediante el uso de las combinaciones de compuesto activo de acuerdo con la invención.

5 En el campo veterinario y en la cría de animales, se han aplicado de la manera conocida mediante administración entérica en la forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, purgantes, gránulos, pastas, bolas, el procedimiento de mezclado con el alimento, supositorios; mediante administración parenteral, tal como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantes, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dérmica en la forma de, por ejemplo, baño o inmersión, pulverización, derramado, pintado, lavado, espolvoreado, y con la ayuda de un compuesto activo que comprende artículos conformados tales como
10 collares, aretes para las orejas, aretes para la cola, bandas para las patas, ronzales, dispositivos para marcar y similares. Los compuestos activos pueden formularse como champús o como formulaciones adecuadas usables en aerosoles, pulverizadores no presurizados, por ejemplo, espray de bomba y espray atomizador.

15 Cuando se usan para ganado, aves de corral, animales domésticos y similares, los compuestos activos de la fórmula (I) pueden aplicarse como formulaciones (por ejemplo polvos, polvos humectables ["WP"], emulsiones, concentrados emulsificables ["EC"], polvos fluidos, soluciones homogéneas y concentrados en suspensión ["SC"], los cuales comprenden los compuestos activos en una cantidad de desde 1 hasta 80% en peso, bien directamente o bien después de dilución (por ejemplo, dilución de 100 hasta 10.000 veces), o bien como un baño químico.

Además, se ha encontrado que los compuestos activos de acuerdo con la invención tienen una potente actividad insecticida contra insectos que destruyen materiales industriales.

20 Los insectos siguientes pueden mencionarse a modo de ejemplo y como referencia, pero no como limitación:

Escarabajos tales como:

25 *Helyotrupes bajalus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Emobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxilon aequale*, *Minthes rugocollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxilon spec.*, *Dinoderus minutus*.

Heminópteros tales como:

Sirexjuvencus, *Urocerus gigans*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Termitas tales como.

30 *Kaloterme flavocollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indocola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*.

Lepismas tal como *Lepisma saccharina*.

35 Materiales industriales conocidos denominados en el presente contexto, como materiales no vivos, tales como, preferiblemente, polímeros, adhesivos, colas, papel y cartón, cuero, madera, productos derivados de la madera y pinturas.

40 En los casos apropiados, una composición lista para usar para la protección de materiales industriales y que contenga al menos un compuesto de acuerdo con la presente invención, puede comprender adicionalmente otros ingredientes activos, tales como al menos un insecticida y/o al menos un fungicida. Los insecticidas y/o fungicidas adecuados son preferiblemente los mencionados en la presente invención.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse igualmente para la protección de crecimientos sobre objetos, en particular cascos de buques, tamices, redes, edificios, amarres y sistemas de señales que entran en contacto con agua salada o aguas salobres.

45 Además, los compuestos de acuerdo con la invención, solos o en combinación con otros ingredientes activos, pueden usarse como agentes anti-ensuciamiento.

50 En el sector de la higiene, los compuestos activos de acuerdo con la invención se han encontrado igualmente que son adecuados para el control de plagas animales, especialmente en la protección de locales domésticos, en el campo de la higiene y de productos almacenados. Se ha encontrado que son particularmente activos contra insectos, arácnidos y ácaros que se encuentran en espacios cerrados tales como, por ejemplo, viviendas, salas de fábricas, oficinas, cabinas de conductores y similares. Para controlar estas plagas, pueden usarse en productos insecticidas para locales domésticos, bien solos o bien en combinación con otros ingredientes activos y productos auxiliares. Son activos contra especies sensibles y resistentes y contra todas las fases de desarrollo.

Dichas plagas de animales incluyen:

- del orden de Escorpiónidos, por ejemplo *Buthus occitanus*;
- del orden de los Acaros, por ejemplo *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubata*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissinus*, *Dermatophagoides forinae*;
- procedente del orden de los Araneidos, por ejemplo *Aviculariidae*, *Araneidae*;
- procedente del orden de Opiliónidos, por ejemplo *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*;
- del orden de los Isópodos, por ejemplo *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- del orden de los Diplópodos, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.;
- del orden de los Quilópodos, por ejemplo *Geophilus* spp.;
- del orden de los Zygentoma, por ejemplo *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharinum*, *Lepidosmes inquilinus*;
- del orden de los Blatoideos, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*;
- del orden de las Saltatoria, por ejemplo *Acheta domesticus*;
- del orden de las Dermápteros, por ejemplo *Forficula auricularia*;
- del orden de las Isópteros, por ejemplo *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp.;
- del orden de las Psocópteros, por ejemplo *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.;
- del orden de los Coleópteros, por ejemplo *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*;
- del orden de los Dípteros, por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;
- del orden de los Lepidópteros, por ejemplo *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*;
- del orden de los Himenópteros, por ejemplo *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Manomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*;
- del orden de los Anopluros, por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastratix*, *Phtirus pubis*;
- del orden de los Heterópteros, por ejemplo *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

35 En el sector de la higiene, la aplicación de la invención puede llevarse a cabo solo o en combinación con otros ingredientes activos adecuados, tal como, por ejemplo, insecticidas o fungicidas, preferiblemente los mencionados en la presente invención, e ingredientes activos seleccionados a partir de ésteres fosfóricos, carbamatos, piretroides, neo-nicotinoides, reguladores del crecimiento.

40 En general, la aplicación de la invención puede llevarse a cabo ajustada a la forma de aplicación. Las formas de aplicación adecuadas incluyen aerosoles, esprays no presurizados, por ejemplo esprays de bomba y esprays atomizadores, dispositivos de creación de niebla automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos para vaporizar con plaquetas vaporizadoras hechas de celulosa o polímero, vaporizadores líquidos, vaporizadores de membrana y gel, vaporizadores impulsados por propulsores, sistemas de vaporización que no consumen energía (sistemas de vaporización pasivos), papeles de alcanfor, saquitos de alcanfor y geles de alcanfor en la forma de gránulos o polvos, en cebos para dispersión o lugares fijos para cebos.

45 En particular, los compuestos activos de la presente invención pueden formularse en formas de preparación usuales. Para las diversas aplicaciones, en particular en el campo de la agricultura y en el sector de la higiene, los ejemplos de las formas de preparación, especialmente cuando se usan como insecticida, incluyen soluciones, emulsiones,

polvos humectables, polvos fluidos secos, suspensiones, polvos, espumas, pastas, comprimidos, gránulos, aerosoles, productos naturales y sintéticos infiltrados en el compuesto activo, microcápsulas, agentes de recubrimiento de siembras, preparaciones con un elemento de combustión (por ejemplo, cartuchos, latas y serpentines de fumigación y de humo), ULV (nieblas frías y nieblas calientes).

5 Cada una de estas preparaciones puede prepararse de una manera conocida *per se*. Por ejemplo, al menos un compuesto activo se mezcla con reveladores, específicamente, diluyentes o vehículos líquidos; diluyentes o vehículos gas-líquido; o diluyentes o vehículos sólidos, y opcionalmente, con tensioactivos (tal como, por ejemplo, tensioactivos aniónicos, catiónicos y no iónicos), específicamente, emulsificadores y/o dispersantes y/o formadores de espuma, mediante los cuales se preparan las formulaciones.

10 Cuando se usa agua como el revelador, por ejemplo, puede usarse igualmente un disolvente orgánico como un disolvente auxiliar.

15 Los ejemplos de los diluyentes o vehículos líquidos pueden incluir hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno, tolueno y alquilnaftaleno), hidrocarburos aromáticos o alifáticos clorados (por ejemplo, clorobenceno, cloruros de etileno y cloruros de metileno), hidrocarburos alifáticos [por ejemplo, ciclohexano, parafinas (por ejemplo, fracciones de aceites minerales)], alcoholes (por ejemplo, alcohol bencílico, isopropanol, etanol, butanol, glicol y éteres y ésteres de los mismos), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona y ciclohexanona), disolventes polares fuertes (por ejemplo, dimetilformamida y dimetilsulfóxido), carbonatos cíclicos (por ejemplo, carbonato de etileno, carbonato de propileno), pirrolidonas (por ejemplo, N-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona), éteres (por ejemplo, dietileno glicol monometiléter y dietileno glicol monopropiléter), lactonas (por ejemplo, butirólactona) y agua.

20 Los ejemplos de los diluyentes o vehículos gas-líquido pueden incluir los que son gas a temperatura y presión normal tales como propulsores de aerosoles tales como a partir de propano, gas nitrógeno, dióxido de carbono, e hidrocarburos halogenados.

25 Los ejemplos de los diluyentes sólidos pueden incluir minerales naturales molidos (por ejemplo, caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas) y minerales sintéticos molidos (por ejemplo, ácido silícico altamente dispersado, alúmina y silicato).

Los ejemplos de los vehículos sólidos para gránulos pueden incluir rocas trituradas y fraccionadas (por ejemplo, calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita), gránulos sintéticos de polvos inorgánicos u orgánicos, materiales orgánicos (por ejemplo, polvo de serrín, cáscaras de coco, mazorca de maíz y tallos de tabaco).

30 Los ejemplos de emulsificadores y/o formadores de espuma pueden incluir emulsificadores no iónicos y aniónicos [por ejemplo, ésteres de ácidos polioxietileno grasos, éteres de alcoholes de ácidos polioxietileno grasos (por ejemplo, alquilaril poliglicol éter), alquil sulfonatos, alquil sulfatos y aril sulfonatos] e hidrolizados de albúmina.

Los dispersantes incluyen licor residual de sulfito de lignina y metilcelulosa.

35 Los aglomerantes pueden igualmente usarse en las preparaciones (polvos, gránulos y concentrados emulsificables). Los ejemplos del aglomerante pueden incluir carboximetilcelulosa, polímeros naturales o sintéticos (por ejemplo, goma arábica, alcohol polivinílico y acetato de polivinilo).

Igualmente, puede usarse colorante en la presente invención. Los ejemplos de colorante pueden incluir pigmentos inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia), colorantes orgánicos tales como colorantes de Alizarina, colorantes azo o colorantes de ftalocinina de metal, y además, nutrientes traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc.

40 La preparación puede contener el componente activo anterior en una cantidad que generalmente varía desde 0,1 hasta 95% en peso de la preparación total y, preferiblemente, 0,5 hasta 90% en peso.

45 Los compuestos activos de la fórmula (I) de la presente invención pueden existir como una mezcla con otros compuestos activos, por ejemplo, insecticidas, cebos venenosos, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del desarrollo o herbicidas en las formas de preparaciones comercialmente útiles y en las formas de trabajo preparadas a partir de estas preparaciones. En la presente invención, los ejemplos de los insecticidas anteriores pueden incluir agentes fosforosos orgánicos, agentes carbonato, productos químicos de tipo carboxilato, productos químicos de tipo hidrocarburo clorado y materiales insecticidas producidos a partir de microorganismos.

50 Los compuestos activos de la fórmula (I) de la presente invención pueden existir como una mezcla con sinergistas, y los ejemplos de las formas de preparación y las formas de trabajo de los mismos pueden incluir formas comercialmente útiles. Los propios sinergistas no precisan ser activos y son compuestos que potencian la acción de los compuestos activos.

Dichos ingredientes activos o sinergistas son, por ejemplo, los siguientes:

Compuestos que actúan como fungicidas:

- Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, tales como Benalaxyl, benalaxyl-M, bupirimate, chiralaxyl, clozylacon, dimethirimol, ethirimol, furalaxyl, hymexazol, metalazyl, metalazyl-M, ofurace, oxadixyl y ácido oxolínico.
- 5 Inhibidores de mitosis y división celular, tal como benomyl, carbendazin, diethofencarb, fuberidazol, pencycuron, thiabendazol, thiophanate-methyl y zoxamis.
- Inhibidores del complejo respiratorio I, tal como diflumetorim.
- Inhibidores del complejo respiratorio II, tal como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furamepyr, mepronil, oxycarboxin, penthiopyrad y thifluzamida.
- 10 Inhibidores del complejo respiratorio III, tal como azoxystrobin, cyazofamide, dimostrobin, enostrobin, famoxadone, fenamidone, fluoxastrobin, kresoximmethyl, metominostrobin, oryastrobin, pyraclostrobin y picoxystrobin.
- Desacopladores, tal como dinocap y fluazinam.
- Inhibidores de la producción de ATP, tal como acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina y silthiofam.
- 15 Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, tal como andoprim, blasticidin-S, cyprodinil, kasugamicina, hidrocloreto de kasugamicina hidratado, mepanipyrim, y pyrimethanil.
- Inhibidores de transducción de la señal, tal como fenciclonil, fludioxonil, y quinoxilen.
- Inhibidores de la síntesis de membrana y grasa, tal como chlozolinato, iprodiona, procymidone, vinclozolin, ampropylfos, ampropylfos potasio, edifenphos, iprobenfos (IBP), isoprothuilane, pyraphos, tolclofos-methyl, bifenilo, iodocarb, propamocarb, e hidrocloreto de propamocarb.
- 20 Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, tal como fenhexamida, azaconazol, bitertanol, bromconazol, cyproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriazol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, prothioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, imazil sulfato, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pyrifeno, triforin, perfurozoato, prochloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorph, dodemorph, dodemorph acetato, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, spiroxamina, naftifin, pyributicarb y terbinafin.
- 25 Inhibidores de la síntesis de la pared celular, tal como benthiavalicarb, bialaphos, dimethomorph, flumorph, iprovalicarb, polyoxins, polyoxanm, y validamicina A.
- Inhibidores de la biosíntesis de melanina, tal como capropamida, diclocymet, fenoxanil, ftalida, pyroquilon, y tricyclazole.
- Compuestos de inducción a la resistencia, tal como acibenzolar-S-methyl, probenazole, y tiadinil.
- 35 Compuestos multisitio, tal como captafol, captan, chlorothalonil, sales de cobre, hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, mezcla de Burdeos y cobre-oxina, dichlofluanil, dithianon, dodin, base libre de dodin, ferbam, fluorfolpet, guazatin, acetato de guazatin, iminoctadin, albesilato de iminoctadine, triacetato de iminoctadine, mancopper, mancozel, menb, metiram, metiram zinc, propineb, azufre y preparaciones azufre conteniendo polisulfuro de calcio, thiram, tolyfluanid, zineb, y ziram.
- 40 Compuestos de mecanismo desconocido, tal como amibromdol, benthiazol, bethoxazin, capsymicin, carvone, metionato de quinoleína, cloropicrina, cufraneb, cyflufenamide, cymoxanil, dazomet, debacarb, diclomezine, dichlorophen, dicloran, difenzoquat, metil sulfato de difenzoquat, difenilamina, ethaboxam, ferimzone, flumetover, flusulfamida, fluopicolide, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinoleína, irumamicina, methasulphocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrothal-isopropilo, octnilinona, oxamocarb, oxyfenthiin, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, piperalin, propanosin-sodio, proquinoxid, pirrolnitrina, quitozen, tecloftalam, tecnazen, triazoxido, triclámida, zaniamida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazol carboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridino carboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]etiliden]-amino]oxi]metil]fenil-3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridina dicarbonitriol, 2-[[[ciclopropil](4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetilen)benzacetato de metilo, 4-cloro-alfa-propiniloxi-
- 50

5 N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonyl)amino]-butamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, N-[(2Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-benzacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxibenzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)oxi]feniletilideno]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfa-benzacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropano carboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carboxílico, 2-(2-[[6-(3-clor-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida.

15 Compuestos que actúan como bactericidas, tales como diclorofeno, nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, othilidon, ácido furano carboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomycin, teolofalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Compuestos que actúan como Insecticidas y/o Acaricidas y/o Nematicidas:

20 Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), del tipo carbamatos, tales como, por ejemplo alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, allylcarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, cloethocarb, dimetilan, etoxifenacarb, fenobucarb, fenothiocarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, metam-sodium, methiocarb, methomyl, metoicarb, oxamyl, pirimicarb, promecarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, trimethacarb, XMC, xylcarb, y triazamate; y

25 del tipo organofosfatos, tales como, por ejemplo acephate, azamethiphos, azinphos (-methyl, -ethyl), aromophosethyl, aromfenvinphos (-methyl), autathiofos, cadusafos, carbophenothion, chlorothoxyfos, chlorfenvinphos, chlomephos, chlorpyrifos, (-methyl/-ethyl), coumaphos, cyanofenphos, cyanophos, chlorfenvinphos, demeton-S-methyl, demeton-S-methylsulphone, dialfos, diazinone, dichlofenthion, dichlorovos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, dioxabenzofos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, etrimphos, famphur, fenamiphos, fenitrotion, fensulfothion, fenthion, flupyrzofos, fonofos, formotion, fosmethilan, fosthiazate, heptenophos, iodofenphos, iprobenfos, isazofos, isophenfos, O-salicilato de isopropilo, isoxathion, malathion, mecarbarn, methacrifos, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-methyl, parathion(-methyl/-ethyl), phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phosphocarb, Phoxim, pirimiphos (methyl/-ethyl), profenofos, propaphos, propetamphos, prothiofos, prothioate, pyraclofos, pyridaphenthion, pyridathion, quinaiphos, sebufos, sulprofos, tebutimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, triclorfon, vamidotion.

40 Modulares del canal de sodio/bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje del tipo piretroides, tales como, por ejemplo acrinathrin, allethrin (d-cis-trans, d-trans), beta-cyfluthrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, bioethanomethrin, biopermethrin, bioresmethrin, chlovaporthrin, cis-cypermethrin, cis-resmethrin, cis-permethrin, clocytrin, cycloprothrin, cyfluthrin, cyhalthrin, cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta), cyfenothrin, deltamethrin, empenthrin, (IR-isomer), esfenvelarate, etofenprox, fenfluthrin, fenopropathrin, fenpyrithrin, fenvalerate, flubrocyrinate, flucythrinate, flufenprox, fluvalinate, fubfenprox, gamma-cyhalothrin, imiprothrin, kadethrin, lambda.cyhalothrin, metofluthrin, permethrin (cis-, trans-), phenothrin (IR-trans isomer), prallethrin, profluthrin, protrifenbute, pyresmethrin, resmethrin, RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinate, tefluthrin, terallethrin, tetramethrin (-1R-isomer), talomethrin, transfluthrin, ZXI 8901, piretrinas (piretrum).

DDT; oxadiazinas, tal como, por ejemplo indoxacarb.

50 Agonistas/antagonistas del receptor acetilcolina, del tipo clononitinos, tales como, por ejemplo acetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazine, thiocloprid, thiamethoxam, nicotina, bensultap, cartap.

Moduladores del receptor acetilcolina, del tipo Spinosynes, tal como, por ejemplo spinosad.

55 Antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA, del tipo Organoclorinados, tales como, por ejemplo camphechlor, clordano, endosulfan, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro; Fripoles, tales como, por ejemplo acetoprole, ethiprole, fipronil, pyrafluprole, pyriprole, y vanilprole.

Activadores del canal de cloruro, del tipo Mectinas, tal como, por ejemplo avermectin, emamectin, benzoato de emamectin, ivermectin, milbemycin, latidectin, lepimectin, selamectin, doramectin, eprinomectin, y moxidectin.

Miméticos de hormonas juveniles, del tipo, por ejemplo diafenolan, epofenorane, fenycarb, hydro-
prene, kinoprene, methoprene, pyriproxifen, y tripene.

Agonistas del receptor latrofilina, del tipo depsiéptidos, preferiblemente depsiéptidos cíclicos, en
particular depsiéptidos cíclicos de 24 átomos, por ejemplo emodepside.

5 Agonistas/disruptores de ecdisona, tal como diacilhidrazinas, tales como, por ejemplo chromafeno-
zide, halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide.

Inhibidores de la biosíntesis de quitina, del tipo Benzoilureas, tales como, por ejemplo bistrifluron,
chlofluzuron, diflubenzuron, fluazuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, nova-
luron, novi-flumuron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron, buprofezin, cyromazine.

10 Inhibidores de fosforilación oxidativa, disruptores de ATP tal como diafenthurion; compuestos or-
ganoestaño, tales como, por ejemplo azocyclotin, cyheatin, fenbutatin-oxide.

Desacopladores de fosforilación oxidativa mediante interrupción de gradientes de protón-H, del tipo
pirrol, tal como, por ejemplo chlorfenapyr; dinitrofenoles, tales como, por ejemplo binapacyrl, di-
nobuton, dinocap, DNOC.

15 Inhibidores de transporte del electrón sitio I, del tipo METI's, tales como, por ejemplo fenazaquim,
fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, hydramethylnon, dicofol.

Inhibidores de transporte del electrón sitio II, del tipo rotenones.

Inhibidores de transporte del electrón sitio III, del tipo acequinocyl, fluacrypyrim.

20 Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos, tales como cepas de *Bacillus thu-
ringiensis*.

Inhibidores de la síntesis de grasa, del tipo ácidos tetrónicos, tales como, por ejemplo spirodiclofen,
spiromesifen; ácidos tetrámicos, tales como, por ejemplo spirotetramat (CAS-Reg.-No.: 203313-25-
1) y carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-il etilo (alias: éster
3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-il etilo del ácido carbónico, CAS-REG.-
No: 382608-10-8); carboxamidas, tal como, por ejemplo flonicamid.

25

Agonistas octopaminérgicos, tal como, por ejemplo amitraz.

Inhibidor de ATP-asa estimulada por magnesio, del tipo dicarboxamidas del ácido propargito ben-
zoico, tales como, por ejemplo flubendiamide; análogos de Nereistoxina, tales como, por ejemplo
oxalato ácido de thiocyclam, thiosultap-sodium.

30 Productos biológicos, hormonas o feromonas del tipo azadirachtin, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*,
codlemone, *Metarhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, thuringiensin, *Verticillum spec.*

Compuestos activos con modo de acción desconocido o no específico, del tipo fumigantes, tales
como, por ejemplo fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo; inhibidores de la
alimentación, tales como, por ejemplo criolita, flonicamid, pymetrozine; inhibidores del desarrollo de
ácaros, tales como, por ejemplo clofentezine, etoxazole, hexythiazox, amidoflumet, benclonthiaz,
benzoximate, bifenazate, bromopropylate, buprofezin, quinometholate, chlordimeform, chloroben-
zilate, cloropicrina, clothiazoben, ciclopreno, cyflumetofen, dicyclanil, fenoxacrim, fentrifanil, fluben-
zimina, flufenerim, flutenzin, gossyplure, hydramethylnone, japonilure, metoxadiazona, petróleo,
butóxido de piperonilo, oleato potásico, piridililo, sulfluramid, tetradifon, tetrasul, triarathee, y ver-
butin.

35

40 El contenido o concentración de los compuestos activos de fórmula (I) de la presente invención en formas comer-
cialmente útiles puede variar ampliamente.

45 En particular, la concentración de los compuestos activos de fórmula (I) de la presente invención puede variar desde
0,0000001 hasta 100% en peso, preferiblemente desde 0,00001 hasta 1% en peso y preferiblemente además desde
0,0001 hasta 0,5% en peso.

De acuerdo con la invención, los compuestos de fórmula (I) pueden usarse en un procedimiento convencional ajust-
tado a las formas de trabajo.

La aplicación es de acuerdo con una manera apropiada para las formas de uso.

50 En el campo de la agricultura, es decir, en el campo de la protección de plantas, todas las plantas y partes de las
plantas pueden tratarse de acuerdo con la invención. Dentro del contexto de la presente invención, se entiende por

plantas todas las plantas y poblaciones de plantas tales como las plantas salvajes deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo las plantas de cultivo que se producen de manera natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante selección de plantas convencionales y procedimientos de optimización o mediante procedimientos de ingeniería genética y biotecnológicos o mediante combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo los cultivares de plantas protegibles o no protegibles mediante derechos de los seleccionadores de plantas. Por partes de plantas ha de entenderse todas las partes y órganos de plantas por encima y por debajo de la tierra, tales como vástago, hoja, flor y raíz, de los cuales pueden mencionarse ejemplos tales como hojas, agujas, tallos, flores, cuerpos de frutos, frutos, semillas, raíces y rizomas. Igualmente, las partes de las plantas incluyen el material recolectado, y el material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, siegas, tubérculos, rizomas, sarmientos y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de las plantas con el compuesto de acuerdo con la invención se lleva a cabo directamente o dejando el compuesto o actuando sobre el entorno, hábitat o espacio de almacenamiento, mediante los procedimientos de tratamiento acostumbrados, por ejemplo aguado (empapado), irrigación por goteo, pulverización, vaporización, atomización, siembra a voleo, espolvoreo, espumación, esparcido en seco, y como un polvo para tratamiento de semillas en seco, una solución para tratamiento de semillas, un polvo soluble en agua para tratamiento de semillas, un polvo soluble en agua para tratamiento de suspensiones, o mediante por incrustación, y en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, además mediante tratamientos en seco, tratamientos en suspensiones, tratamientos líquidos, mediante un recubrimiento mono- o multicapa. Igualmente, es posible aplicar los compuestos activos mediante el procedimiento de ultra-bajo volumen, o inyectando la preparación del compuesto activo o del propio compuesto activo dentro del suelo.

Los compuestos de acuerdo con la invención son particularmente adecuados para el tratamiento de semillas. De acuerdo con ello, una gran parte del daño de las plantas de cultivo que está causado por las plagas ocurre tan pronto como la semilla es atacada durante el almacenamiento y después de que la semilla se ha introducido dentro del suelo, durante e inmediatamente después de la germinación de las plantas. Esta fase es particularmente crítica dado que las raíces y vástagos de la planta en crecimiento son particularmente sensibles e incluso el menor daño puede conducir a la muerte de la planta entera. La protección de la semilla y de la planta en germinación mediante el uso de composiciones adecuadas que comprenden el compuesto de acuerdo con la invención es, en consecuencia, particularmente de gran interés.

El control de plagas mediante el tratamiento de las semillas es conocido desde hace mucho tiempo y es la materia sujeto de mejoras continuas. Sin embargo, el tratamiento de semillas frecuentemente comporta una serie de problemas los cuales no pueden siempre resolverse de una manera satisfactoria. Por ello, es deseable desarrollar procedimientos para la protección de la semilla y de la planta en germinación, lo que pasa por la aplicación adicional de agentes de protección de cultivos después de la siembra o después de la emergencia de las plantas o al menos cuando se han reducido aplicaciones adicionales. Es además deseable optimizar la cantidad de compuesto activo usado con el fin de proporcionar la máxima protección para la semilla y de la planta en germinación del ataque por plagas, pero sin dañar a la propia planta por los compuestos activos usados. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas debería igualmente tener en cuenta las propiedades insecticidas intrínsecas de las plantas transgénicas con el fin de lograr la protección óptima de la semilla y de la planta en germinación usándose un mínimo de agentes de protección de las cosechas.

En el campo de la agricultura, la dosis/proporción de aplicación de compuesto activo usualmente aplicada el procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención es, para tratamientos foliares: desde 0,1 hasta 10.000 g/ha, preferiblemente desde 10 hasta 1.000 g/ha, más preferiblemente desde 50 hasta 300 g/ha; en el caso de aplicación por empapado o goteo, la dosis puede reducirse; para el tratamiento de semillas: desde 2 hasta 200 g por 100 kilogramos de semillas, preferiblemente desde 3 hasta 150 g por 100 kilogramos de semillas; y para el tratamiento de suelos: desde 0,1 hasta 10.000 g/ha, preferiblemente desde 1 hasta 5.000 g/ha.

Tal como se ha mencionado ya anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una realización preferida, se tratan las especies de plantas salvajes y los cultivares de plantas, o las obtenidas mediante procedimientos de selección biológica convencional, tales como cruce o fusión de protoplastos, y partes de las mismas. En una realización preferida adicional, son tratadas las plantas transgénicas y los cultivares de plantas obtenidos mediante procedimientos de ingeniería genética, si es apropiado, en combinación con procedimientos convencionales (Organismos genéticamente modificados), y partes de las mismas. Los términos "partes", "partes de plantas" y "partes de planta" han sido explicados anteriormente.

Preferiblemente de manera particular, las plantas de los cultivares de plantas que se encuentran en cada caso comercialmente disponibles o en uso, son tratadas de acuerdo con la invención. Por cultivares de plantas se entiende que se refiere a plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") que han sido obtenidos mediante selección convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Estos pueden ser cultivares, bio- o genotipos.

Las plantas transgénicas o cultivares de plantas (obtenidos mediante ingeniería genética) las cuales son preferiblemente para ser tratadas de acuerdo con la invención, incluyen todas las plantas que, mediante modificación genética, han recibido material genético que imparte rasgos útiles, particularmente ventajosos a estas plantas. Los ejem-

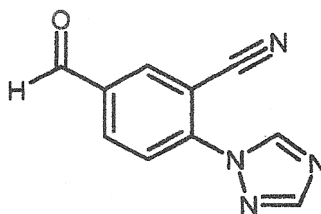
5 plos de estos rasgos son mejor desarrollo de la planta, tolerancia incrementada a altas o bajas temperaturas, tolerancia incrementada a la sequía o al agua o al contenido salino del suelo, rendimiento de floración incrementado, más fácil recolección, maduración acelerada, rendimientos de recolección superiores, calidad superior y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mejor estabilidad de almacenamiento y/o capacidad de transformación
 10 de los productos recolectados. Además y ejemplos particularmente enfatizados de dichos rasgos son una mejor defensa de las plantas contra plagas animales y microbios, tales como contra insectos, ácaros, hongos, bacterias y virus fitopatógenos, e igualmente tolerancia incrementada de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos. Los ejemplos de plantas transgénicas que pueden mencionarse son las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades vegetales, algodón, tabaco, aceite de colza e igualmente plantas frutales (con los frutos de manzanos, peras, frutos cítricos y uvas), y haciendo especial énfasis en el maíz, sojs, patatas, algodón, tabaco y aceite de colza. Los rasgos que se han enfatizado son en particular la defensa incrementada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles debido a las toxinas formadas en las plantas, en particular a las formadas en las plantas mediante el material genético procedente del *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryA(a), CryI(b), CryI(c), CrIIA, CrIII, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryI(F) e igualmente combinaciones de los mismos) (referidos en la presente invención más adelante como "plantas Bt"). Los rasgos que son igualmente de manera particular enfatizados, son la defensa incrementada de las plantas contra hongos, bacterias y virus mediante la resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, genes inductores y de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Los rasgos que son además particularmente enfatizados son la tolerancia incrementada de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que imparten los rasgos deseados en cuestión, pueden igualmente estar presentes en combinación con otro en las plantas transgénicas. Los ejemplos de "plantas Bt" que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patatas que se comercializan bajo los nombres comerciales YIELD GUARD® (por ejemplo, maíz, algodón, sojas), KnockOut® (por ejemplo maíz), StartLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (por ejemplo algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Los ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden bajo los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia al glifosfato, por ejemplo, maíz, algodón, soja). Liberty Link® (tolerancia a la fosfotricina, por ejemplo aceite de colza), IMI® (tolerancia a las imidazolinonas) y STS® (tolerancia las sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas seleccionadas de una manera convencional para resistencia a herbicidas) que pueden mencionarse incluyen variedades vendidas bajo el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz). Por supuesto, estas manifestaciones se aplican igualmente a cultivares de plantas que tienen estos rasgos genéticos o rasgos genéticos aún por desarrollar, cuyos cultivares de plantas se desarrollarán, y/o comercializarán en el futuro.

35 Las plantas listadas pueden tratarse de una manera particularmente ventajosa con el compuesto activo de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos establecidos anteriormente para el compuesto activo son igualmente de aplicación para el tratamiento de estas plantas.

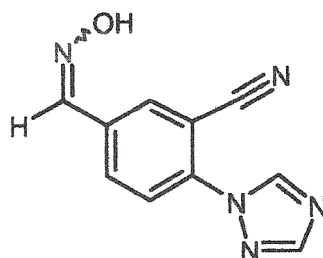
Cuando los compuestos activos de la presente invención se usan en el sector de la higiene, particularmente se usan contra plagas de la higiene o plagas en sustancias almacenadas, tienen estabilidad contra álcalis existentes sobre materiales calizos y producen excelentes efectos residuales sobre maderas y suelos.

40 A continuación, la presente invención se explicará más detalladamente a modo de ejemplos, pero la presente invención no pretende limitarse a estos ejemplos.

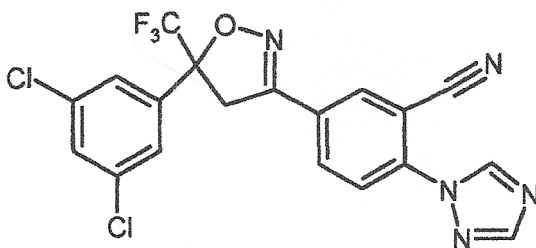
Ejemplo de Síntesis 1 (Síntesis de material de partida)



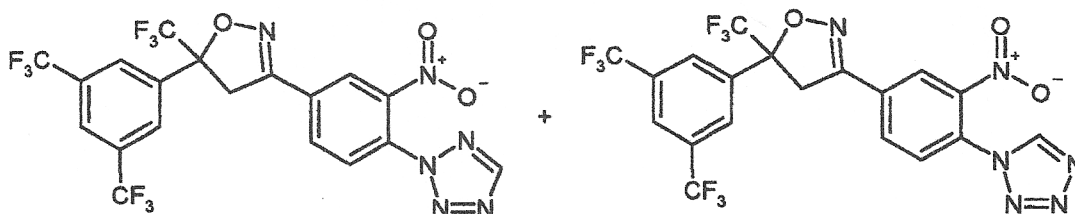
45 Se disolvieron 2-fluoro-5-formilbenzonitrilo (1,0 g, 6,71 mmol) y 1H-1,2,4-triazol (0,56 g, 8,05 mmol) en DMF. A la solución se agregó carbonato potásico (1,1 g, 8,05 mmol), la cual se agitó a 120°C durante 6 horas. La temperatura de esta solución de reacción se volvió a la temperatura ambiente, y se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante
 50 cromatografía de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,60 g de 5-formil-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (p.fus.: 134-141°C, rendimiento: 43%).

Ejemplo de Síntesis 2 (Síntesis de material de partida)

Se disolvieron 5-formil-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzotrile (1,58 g, 7,97 mmol) e hidrocloreto de hidroxilamina (0,67 g, 9,57 mmol) en un disolvente mezclado de THF-agua (4:1). A la solución se agregó acetato sódico (0,92 g, 11,2 mmol), la cual se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. Una vez completada la reacción, se agregaron agua y acetato de etilo a la solución de reacción para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida, obteniéndose 1,56 g de 5-[(hidroxiimino)metil]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzotrile (p.fus.: 198-200°C, rendimiento: 87%).

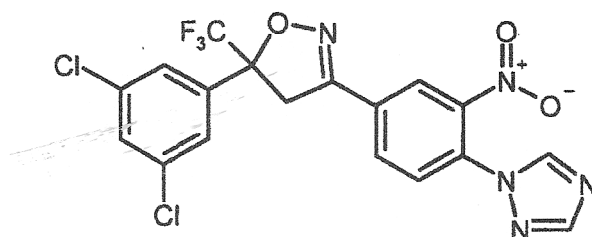
Ejemplo de Síntesis 3

Se agregó N-clorosuccinimida (0,41 g, 3,04 mmol) a una mezcla obtenida disolviendo 5-[(hidroxiimino)metil]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzotrile (0,59 g, 2,77 mmol) en DMF y la mezcla se agitó durante 2 horas. Se agregó además a la mezcla 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benzene (0,82 g, 3,04 mmol). A la mezcla anterior se agregó gota a gota trietilamina (0,31 g, 3,29 mmol) disuelta en DMF bajo enfriamiento con hielo. Una vez completada la adición, la mezcla resultante se agitó durante 2 horas a la misma temperatura y, a continuación, se agitó 4 horas más después de que la temperatura de la mezcla se volviera a la temperatura ambiente. Una vez completada la reacción, se agregaron agua y acetato de etilo a la solución de reacción para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,51 g de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzotrile (p.fus.: 118-125°C, rendimiento: 39%).

Ejemplo de Síntesis 4 (Para ilustración únicamente)

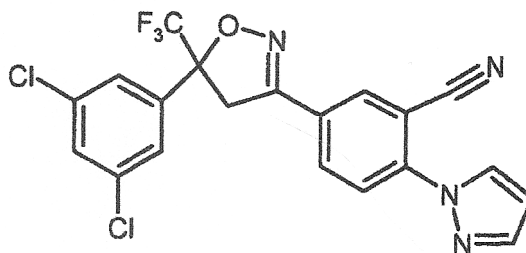
Se disolvieron 5-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(4-fluoro-3-nitrofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol (0,40 g, 0,82 mmol) y 1H-tetrazol (0,09 g, 1,22 mmol) en DMF. A la solución se agregó carbonato potásico (0,17 g, 1,25 mmol), la cual se agitó a 60°C durante 6 horas. La temperatura de esta solución de reacción se volvió a la temperatura ambiente, y se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,06 g de 1-(4-{5-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il}-2-nitrofenil)-2H-tetrazol (p.fus.: 147-149°C, rendimiento:13%) y 0,28 g de 1-(4-{5-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il}-2-nitrofenil)-1H-tetrazol (p.fus.: 173-175°C, rendimiento: 60%).

Ejemplo de Síntesis 5 (Para ilustración únicamente)

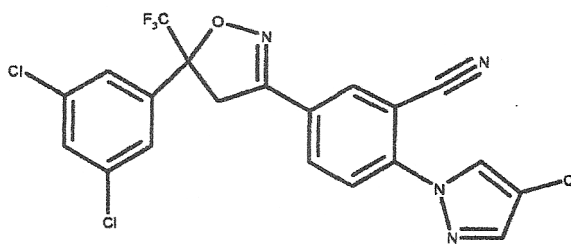


Se disolvieron 3-(4-fluoro-3-nitrofenil)-5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol (0,6 g, 1,42 mmol) y 1H-tetrazol (0,12 g, 1,70 mmol) en DMF. A la solución se agregó carbonato potásico (0,24 g, 1,70 mmol), la cual se agitó a 60°C durante 6 horas. La temperatura de esta solución de reacción se volvió a la temperatura ambiente, y se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,66 g de 1-{4-[5-[3,5-diclorofenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-nitrofenil}-1H-triazol (p.fus.: 64-72°C, rendimiento: 94%).

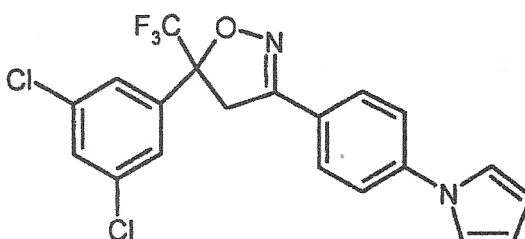
Ejemplo de Síntesis 6 (Para ilustración únicamente)



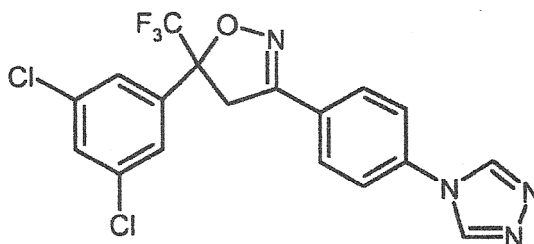
Se disolvió 1H-pirazol (0,06 g, 0,89 mmol) en DMF. A la solución se agregó hidruro sódico (60%, 0,06 g, 0,89 mmol) bajo enfriamiento con hielo y, a continuación, la solución se volvió a la temperatura ambiente. La solución se agitó durante 0,5 horas y se volvió a enfriar con hielo nuevamente. A la mezcla se agregó gota a gota 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-fluorobenzonitrilo (0,30 g, 0,74 mmol) disuelto en DMF. Una vez completada la adición, la temperatura de esta solución de reacción se volvió a la temperatura ambiente, y la solución se agitó durante 3 horas. Una vez completada la adición, se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,2 g de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-(1H-pirazol-1-il)benzonitrilo (p.fus.: 169-176°C, rendimiento: 57%).

Ejemplo de Síntesis 7 (Para ilustración únicamente)

5 Se disolvió 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-(1H-pirazol-1-il)benzocitrilo (0,43 g, 0,95 mmol) en DMF. A esta solución se agregó N-clorosuccinimida (0,14 g, 1,05 mmol), la cual, a continuación, se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y a 80°C durante 2 horas. Una vez completada la adición, se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,2 g de 2-(4-cloro-1H-pirazol-1-il)-5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]benzocitrilo (p.fus.: 190-191°C, rendimiento: 41%).

Ejemplo de Síntesis 8 (Para ilustración únicamente)

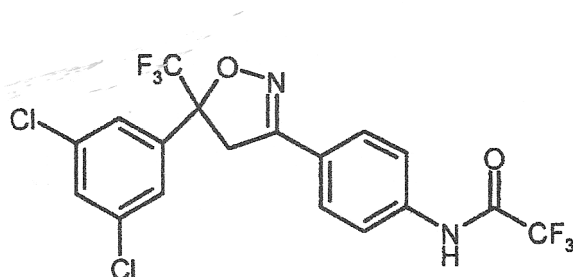
15 Se disolvieron 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]anilina (0,30 g, 0,80 mmol) y 2,5-dimetoxitetrahidrofurano (0,26 g, 2,00 mmol) en ácido acético. La solución se mantuvo a reflujo bajo calentamiento durante 0,5 horas. La temperatura de la reacción se volvió a la temperatura ambiente y a la solución se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,22 g de 5-(3,5-diclorofenil)-3-[4-(1H-pirrol-1-il)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol (p.fus.: 206-208°C, rendimiento: 61%).

Ejemplo de Síntesis 9 (Para ilustración únicamente)

25 Se suspendieron 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]anilina (0,30 g, 0,80 mmol) y 1,2-diformilhidrazina (0,18 g, 2,00 mmol) en piridina. Al líquido de suspensión bajo enfriamiento con hielo se agregaron secuencialmente trietilamina (0,57 g, 5,6 mmol) y trimetilclorosilano (1,30 g, 12,0 mmol). A continuación, el líquido se mantuvo a reflujo bajo calentamiento durante 4 horas. La temperatura de la reacción se volvió a la temperatura ambiente y, a continuación, se agregó agua a la solución de reacción para obtener un precipitado. El precipitado se lavó

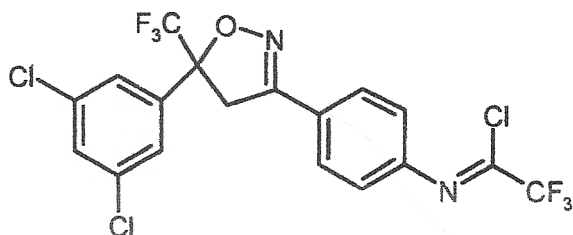
con una pequeña cantidad de acetato de etilo y se secó, obteniéndose 0,14 g de 4-[4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]fenil]-4H-1,3,4-triazol (p.fus.: >250°C, rendimiento: 39%).

Ejemplo de Síntesis 10 (Para ilustración únicamente)



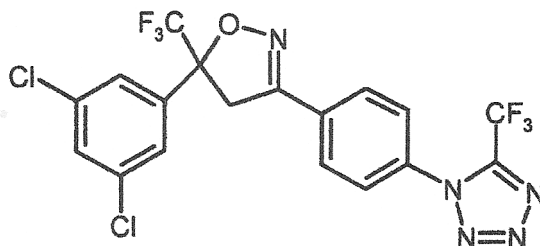
- 5 Se disolvieron 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]anilina (1,25 g, 3,33 mmol) y trietilamina (0,40 g, 3,95 mmol) en diclorometano. A la solución se agregaron bajo enfriamiento con hielo una solución en diclorometano de anhídrido de ácido trifluoroacético (0,80 g, 3,81 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Una vez completada la reacción, la solución se lavó con agua y se secó sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida, obteniéndose 1,5-5 g de N-(4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]fenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (p.fus.: 45-52°C, rendimiento: 99%).

Ejemplo de Síntesis 11 (Para ilustración únicamente)



- 15 Se disolvieron N-(4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]fenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (1,30 g, 2,76 mmol) y trifetilfosfina (1,00 g, 3,81 mmol) en diclorometano. A la solución se agregó tetracloruro de carbono (0,60 g, 3,90 mmol) a 30°C y la solución resultante se mantuvo a reflujo bajo calentamiento durante 5 horas. Una vez completada la reacción, se purificó un producto bruto obtenido mediante la concentración de la solución de reacción bajo presión reducida mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 1,20 g cloruro de N-(4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]fenil)-2,2,2-trifluoroetanimidoilo (rendimiento: 89%).

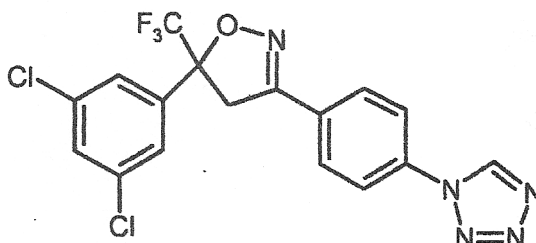
Ejemplo de Síntesis 12 (Para ilustración únicamente)



- 25 Se disolvió cloruro de N-(4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]fenil)-2,2,2-trifluoroetanimidoilo (0,125 g, 0,255 mmol) en acetonitrilo. A la solución se agregó azida sódica (0,05 g, 0,769 mmol) y, a continuación, se agitó a temperatura ambiente durante 15 horas. Una vez completada la reacción, se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. La capa

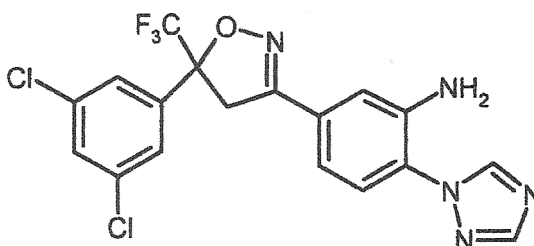
orgánica se secó sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,10 g de 1-[4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]fenil]-5-(trifluorometil)-1H-tetrazol (p.fus.: 147-151°C, rendimiento: 79%).

5 **Ejemplo de Síntesis 13** (Para ilustración únicamente)



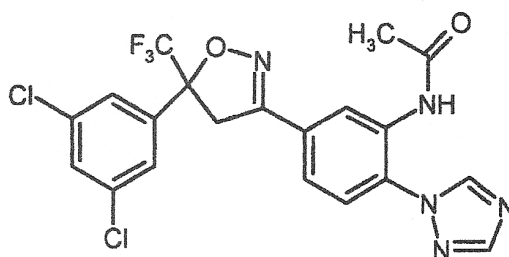
10 Se disolvieron 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]anilina (0,40 g, 1,07 mmol) y ortoformiato de etilo (0,30 g, 2,02 mmol) en ácido acético. A la solución se agregó azida sódica (0,10 g, 1,54 mmol), la cual, a continuación, se mantuvo a reflujo bajo calentamiento durante 5 horas. Una vez completada la reacción, se agregaron agua y acetato de etilo a la solución para separar la capa orgánica y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,25 g de 1-[4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]fenil]-1H-tetrazol (p.fus.: 198-199°C (descomposición), rendimiento: 55%).

15 **Ejemplo de Síntesis 14** (Para ilustración únicamente)



20 Se suspendieron 1-[4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-nitrofenil]-1H-1,2,4-triazol (0,53 g, 1,12 mmol) y cloruro estannoso dihidrato (1,01 g, 4,49 mmol) en etanol. Además, a la solución se agregó una cantidad catalítica de ácido clorhídrico concentrado. La solución de reacción se calentó a 60°C durante 4 horas. Una vez completada la reacción, la temperatura de la solución se volvió a la temperatura ambiente. A la solución se agregaron agua y acetato de etilo, la cual, a continuación, se neutralizó usando carbonato potásico con agitación vigorosa. La suspensión se pasó a través de Celite. La capa orgánica se separó y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,38 g de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)anilina (p.fus.: 244-246°C, rendimiento: 73%).

25 **Ejemplo de Síntesis 15** (Para ilustración únicamente)



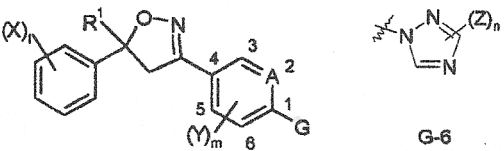
Se disolvieron 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)anilina (0,29 g, 0,66 mmol) y piridina (0,08 g, 0,98 mmol) en THF. A esta solución se agregó cloruro de acetilo (0,05 g, 0,69 mmol) a temperatura ambiente y la solución se agitó durante 1 hora. Una vez completada la reacción, se agregaron agua y acetato de etilo a la solución. La capa orgánica se separó y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y secaron sobre sulfato magnésico anhidro. Después de separar el agente desecante mediante filtración, el filtrado se concentró bajo presión reducida. El producto bruto obtenido se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice (hexano/acetato de etilo), obteniéndose 0,17 g de N-{5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)fenil}acetamida (p.fus.: 230-233°C, rendimiento: 51%).

- 5 Los compuestos de la fórmula (I), de acuerdo con la presente invención obtenidos de la misma manera que las síntesis de los materiales de partida y los ejemplos de síntesis para la sintetización de los productos finales, se muestra en la Tabla 1, y los ejemplos específicos de los compuestos intermedios se muestran en las Tablas 2 a 4.

Entre los ejemplos de síntesis anteriores, los compuestos que corresponden a los productos finales se muestran en la Tabla 1.

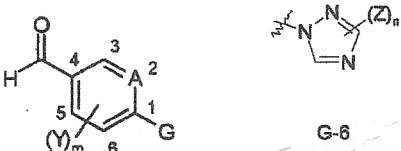
- 15 En las tablas siguientes, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr^{ciclo} significa ciclopropilo y Ph significa fenilo.

Tabla 1



	(X) ₁	R ¹	A	(Y) _m	G	(Z) _n	punto de fusión [°C]/índice de refracción
101	3,5-Cl ₂	CF ₃	C	2-CN	G-6	-	118-125

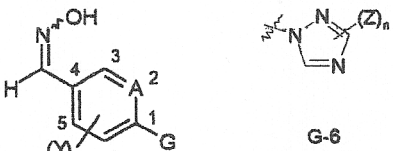
Tabla 2



	A	(Y) _m	G	(Z) _n	punto de fusión [°C]/índice de refracción
10	C	2-CN	G-6	-	134-141

20

Tabla 3



	A	(Y) _m	G	(Z) _n	punto de fusión [°C]/índice de refracción
10	C	2-CN	G-6	-	198-200

25

examinar el número de insectos muertos después de 7 días, calculándose, de este modo, la relación insecticida de la solución química.

Resultados del ensayo

- 5 El compuesto anterior 101 produjo un efecto de control de la plaga tal que la relación acaricida fue del 100% a una concentración de componente eficaz de 500 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 4:

Ensayo para Myzus pérsicas resistente a agentes fosforosos y a agentes carbamato

Procedimiento de ensayo

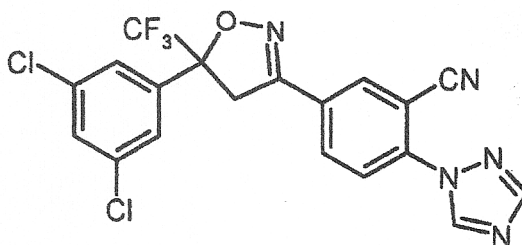
- 10 Aproximadamente 200 cabezas por plántula de Myzus pérsicas cultivadas resistentes a agentes fosforosos y a agentes carbamato se inocularon sobre una berenjena. Sobre la berenjena se pulverizó la dilución acuosa que contenía el compuesto activo preparado anteriormente conteniendo una concentración especificada mediante una pistola de pulverización un día después de la inoculación. La berenjena se dejó reposar a un invernadero a 28°C, para calcular la relación insecticida de la solución química 24 horas después de pulverizar la solución. En este caso, el ensayo se repitió dos veces.

- 15 Resultados del ensayo

El compuesto anterior nº 101 produjo un efecto de control de la plaga tal que la relación acaricida fue del 100% a una concentración de componente eficaz de 500 ppm.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto isoxazolino de la fórmula siguiente



2. Uso del compuesto isoxazolino de acuerdo con la reivindicación 1 como insecticida.

5 3. Uso del compuesto isoxazolino de acuerdo con la reivindicación 1, para la exterminación y destrucción de insectos chupadores, insectos masticadores y otras plagas parasíticas de plantas, plagas de productos almacenados y plagas para la higiene.

4. El uso de acuerdo con la reivindicación 3, en el que los insectos y plagas están seleccionados entre el grupo que consiste en plagas de coleópteros, plagas de lepidópteros, plagas de ácaros, y plagas de hemípteros.

10 5. El uso de acuerdo con la reivindicación 3, en el que los insectos y plagas están seleccionados entre Callosobruchus Chinensis, Sitophilus zeamais, Tribolium castaneum, Epilachna vigintioctomaculata, Agriotes fuscicollis, Anomla rufocuprea, Leptinotarsa decemlineata, Diabrotica spp., Monochamus alternatus, Lissorhoptrus oryzophilus, Lyctus bruneus y Aulacophora femoralis, Lymantria dispar, Malacosoma neustria, Pieris rapae, Spodoptera litura, Mamestra brassicae, Chilo suppressalis, Pyrausa nubilalis, Ephestia cautella, Adoxophyes orana, Carpocapsa pomonella, Agrostisfucosa, Galleria mellonella, Plutella maculipennis, Heliothis virescens y Phyllocnistis citella, Nephrotix cincticeps, Nilaparvata lugens, Pseudococcus comstocki, Unaspis yanonensis, Myzus persicas, Aphis pomi, Aphis gossypii, Phopalosiphum pseudobrassicas, Stephanitis nashi, Nazara spp., Trialeurodes vaporariorum y Phsyla spp., Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus urticae, Panonychus citri, Aculops pelekassi y Tarsonemus spp.

20 6. Uso de acuerdo con la reivindicación 3, en el que los insectos y plagas están seleccionados entre el grupo que consiste en plagas de Tisanópteros, plagas de Ortópteros, plagas de Isópteros, plagas de Dípteros, Nematodos.

7. Mezcla que comprende el compuesto isoxazolino de acuerdo con la reivindicación 1 e insecticidas, cebos venenosos, bactericidas, acaricidas, nematicidas, fungicidas, reguladores del crecimiento o herbicidas.