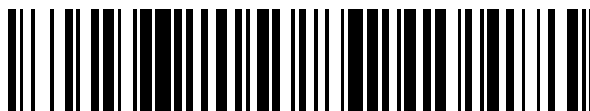


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 858 093**

51 Int. Cl.:

C07D 413/14 (2006.01)

A01N 43/50 (2006.01)

A01N 43/76 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **04.08.2017 PCT/EP2017/069798**

87 Fecha y número de publicación internacional: **15.02.2018 WO18029102**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **04.08.2017 E 17761016 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.12.2020 EP 3497101**

54 Título: **2-Heterocicliil-imidazolil-carboxamidas sustituidas como pesticidas**

30 Prioridad:

10.08.2016 EP 16183573

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

29.09.2021

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
(100.0%)**

**Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**WILLOT, MATTHIEU;
FISCHER, REINER;
HEIL, MARKUS;
JANSEN, JOHANNES-RUDOLF;
ILG, KERSTIN y
PORTZ, DANIELA**

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

ES 2 858 093 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).

DESCRIPCIÓN

2-Heterocicliil-imidazolil-carboxamidas sustituidas como pesticidas

La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos heterocíclicos, procedimiento para su preparación y a su uso para combatir plagas animales.

5 En los documentos WO 2011/009804 A2 y WO 2016/128298 A1 se describen compuestos heterocíclicos, entre otros, también imidazolil-carboxamidas, que pueden usarse como insecticidas.

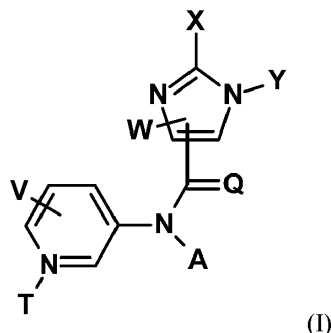
En el documento EP 2 236 505 A1 se describen derivados de piridil- o N-piridazinilo como agente para combatir insectos.

10 El documento WO 2012/107533 divulga distintas heteroarilcarboxamidas con grupo heteroarilo de 5 miembros, que está sustituido con un grupo isoxazolina.

15 Los insecticidas modernos deben satisfacer muchas demandas, por ejemplo, con relación al grado, persistencia y espectro de su acción y posible uso. Las cuestiones referentes a la toxicidad, preservación de especies beneficiosas y de los polinizadores, propiedades medioambientales, tasas de aplicación, capacidad de combinación con otros principios activos o adyuvantes de formulación desempeñan un papel, al igual que la cuestión del esfuerzo requerido para la síntesis de un principio activo, adicionalmente, pueden aparecer resistencias, por mencionar solo algunos parámetros. Por todos estos motivos solamente, la búsqueda de nuevos agentes fitoprotectores no se puede considerar completa, y existe una constante necesidad de nuevos compuestos con propiedades mejoradas en comparación con los compuestos conocidos, al menos con relación a los aspectos individuales.

20 Era objetivo de la presente invención proporcionar compuestos mediante los que se completa el espectro de los pesticidas en distintos aspectos.

El objetivo se consigue mediante la provisión de compuestos no de acuerdo con la invención de la fórmula (I)



en la que (configuración 0)

Q representa oxígeno o azufre,

25 V representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y ciano,

W representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y ciano,

Y representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, alqueno y alquino opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente interrumpido con heteroátomos, opcionalmente sustituido, cicloalquilalquilo, arilalquilo, hetarilalquilo opcionalmente interrumpido con heteroátomos, opcionalmente sustituido y ciano,

30 A representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, alqueno y alquino opcionalmente sustituido, cicloalquilo y cicloalquilalquilo opcionalmente interrumpido con heteroátomos, opcionalmente sustituido,

T representa oxígeno o un par de electrones,

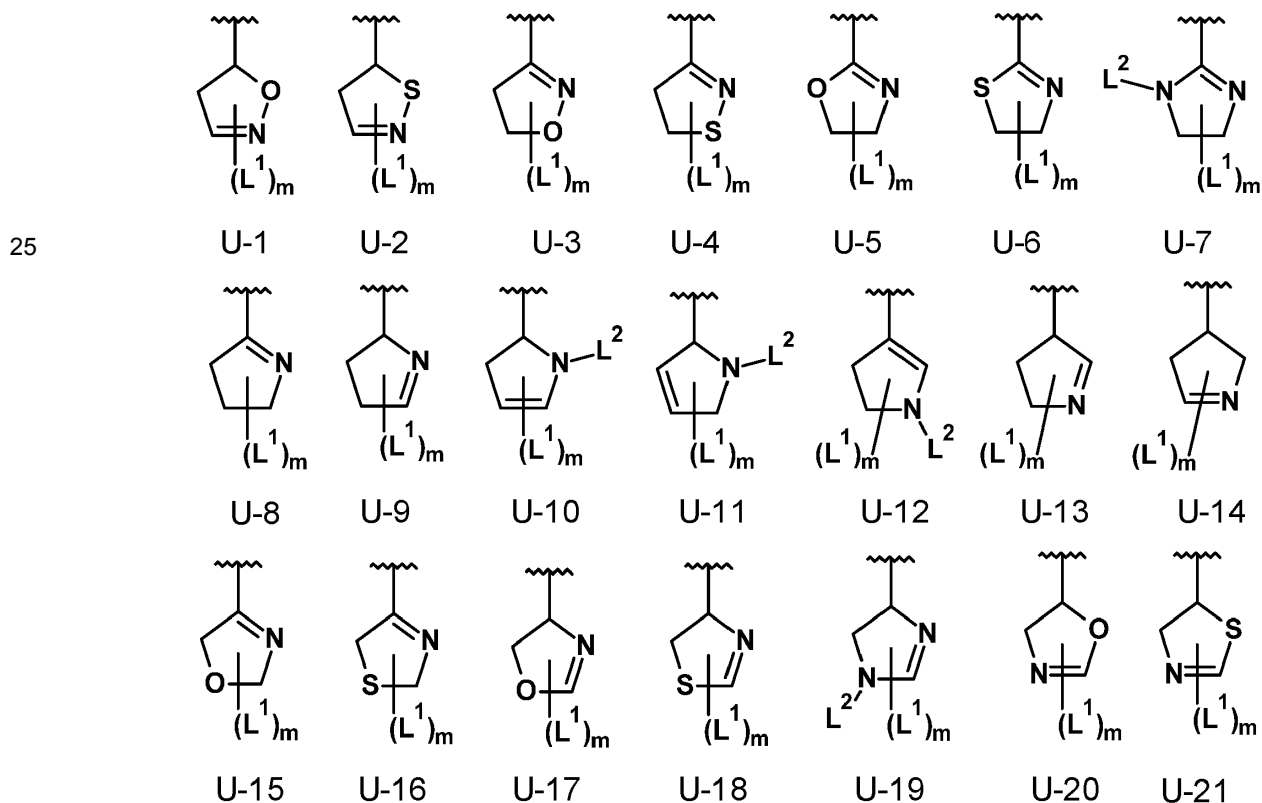
X representa un heterociclo parcialmente saturado, enlazado a través de un átomo de carbono, opcionalmente sustituido, que opcionalmente puede estar interrumpido con uno o dos grupos carbonilo,

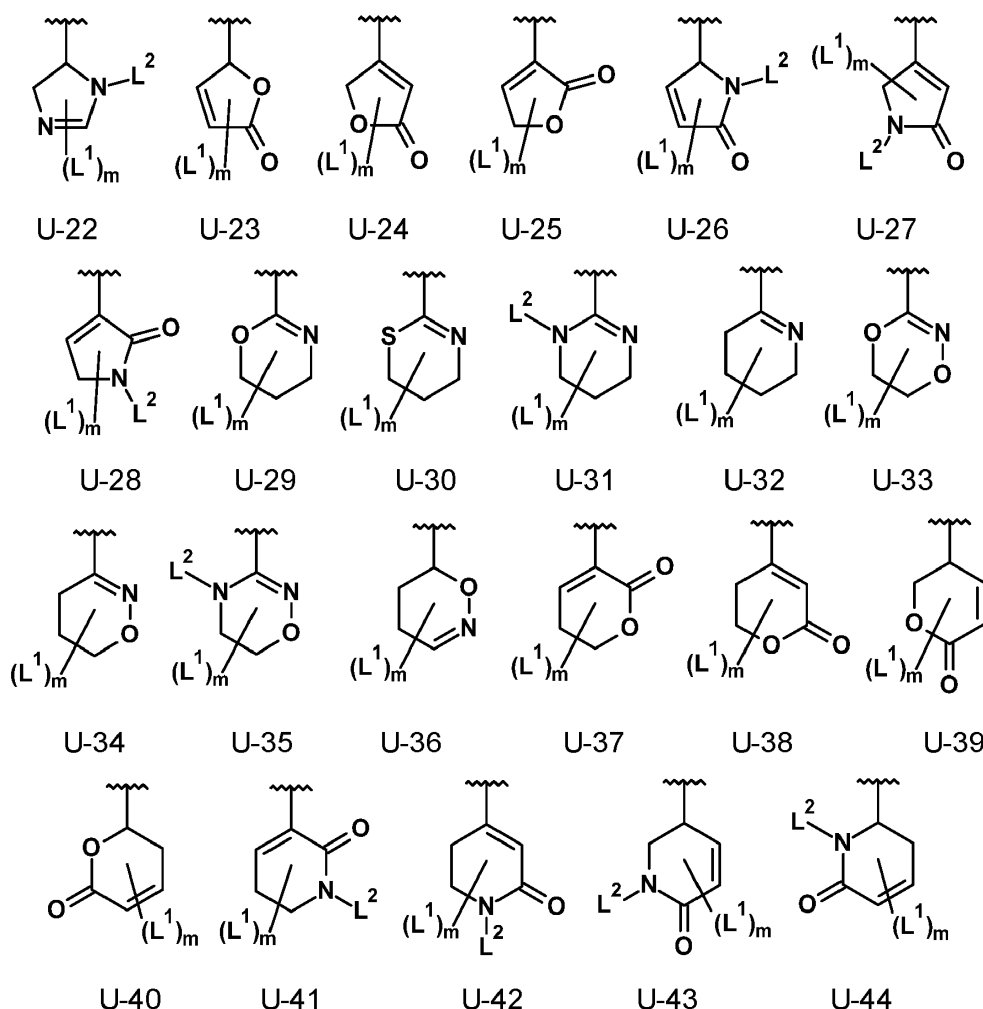
35 y sus sales.

Sustituyentes o intervalos preferidos de los restos expuestos en los compuestos de la fórmula (I) no de acuerdo con la invención se explican a continuación. Su combinación constituye el intervalo preferido (1-1).

Q representa oxígeno o azufre,

- V representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y ciano,
- W representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ y ciano,
- 5 Y representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆ y alquinilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido de una a varias veces independientemente entre sí con halógeno, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n- y ciano, cicloalquilo C₃-C₈ opcionalmente sustituido de una a cuatro veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado opcionalmente interrumpido de una a dos veces independientemente entre sí con O, S(O)_n y NR¹, opcionalmente sustituido de una a cuatro veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, aril-alquilo C₁-C₄ y hetaril-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n-, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n-, nitro y ciano,
- 10
- 15 A representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆ y alquinilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido de una a varias veces independientemente entre sí con halógeno, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n- y ciano, cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, que opcionalmente puede estar interrumpido con O, S(O)_n, NR¹, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, que opcionalmente puede estar interrumpido con O, S(O)_n o NR¹,
- 20
- T representa oxígeno o un par de electrones,
- X representa un heterociclo de cinco o seis miembros parcialmente saturado de la serie U-1 a U-44,





5 L^1 representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, $C(O)N(R^2)(R^3)$, $C(G)R^4$, $C(O)OR^5$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_3-C_6 y alquinilo C_3-C_6 opcionalmente sustituido de una a varias veces independientemente entre sí con halógeno, alcoxi C_1-C_4 , alquil $C_1-C_4-S(O)_n$ y ciano, cicloalquilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido de una a cuatro veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y ciano, cicloalquil C_3-C_8 -alquilo C_1-C_4 de cadena lineal o ramificado
 10 opcionalmente interrumpido de una a dos veces independientemente entre sí con O, $S(O)_n$ y NR^1 , opcionalmente sustituido de una a cuatro veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y ciano, arilo y hetarilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil $C_1-C_4-S(O)_n$, haloalcoxi C_1-C_4 , haloalquil $C_1-C_4-S(O)_n$, nitro y ciano, aril-alquilo C_1-C_4 y hetaril-alquilo C_1-C_4
 15 opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil $C_1-C_4-S(O)_n$, haloalcoxi C_1-C_4 , haloalquil $C_1-C_4-S(O)_n$, nitro y ciano,

L^2 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_3-C_6 y alquinilo C_3-C_6 opcionalmente sustituido de una a varias veces independientemente entre sí con halógeno, alcoxi C_1-C_4 , alquil $C_1-C_4-S(O)_n$ y ciano, cicloalquilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido de una a cuatro veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y ciano, cicloalquil C_3-C_8 -alquilo C_1-C_4 de cadena lineal o ramificado opcionalmente interrumpido de una a dos veces independientemente entre sí con O, $S(O)_n$ y NR^1 , opcionalmente sustituido de una a cuatro veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y ciano, aril-alquilo C_1-C_4 y hetaril-alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil $C_1-C_4-S(O)_n$, haloalcoxi C_1-C_4 , haloalquil $C_1-C_4-S(O)_n$, nitro y ciano,

G representa O, N-CN o $N-OR^5$,

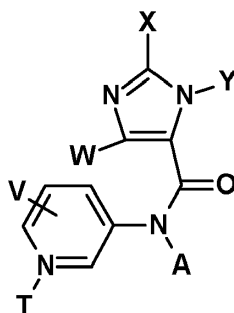
R^1 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquenilo C_3-C_8 y alquinilo C_3-C_8 opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alcoxi C_1-C_4
 30

- 5 y alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, cicloalquilo C₃-C₈ y cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, arilo y hetarilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano, aril-alquilo C₁-C₄ y hetaril-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano,
- 10 R² y R³ independientemente entre sí representan un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alqueno C₃-C₈ y alquino C₃-C₈ opcionalmente sustituido independientemente entre sí de una a cinco veces con halógeno y de una a dos veces con alcoxi C₁-C₄ y alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₃-C₈ y cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, arilo y hetarilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano, aril-alquilo C₁-C₄ y hetaril-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano,
- 15
- 20 o
- R² y R³ junto con el átomo de nitrógeno, al que están unidos, representan un anillo alifático de tres a ocho miembros, que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂ y alcoxi C₁-C₂ y puede estar opcionalmente interrumpido con O o S(O)_n,
- 25 R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alqueno C₃-C₈ y alquino C₃-C₈ opcionalmente sustituido independientemente entre sí de una a cinco veces con halógeno y de una a dos veces con alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻ y ciano, cicloalquilo C₃-C₈ y cicloalqueno C₃-C₈ opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, que pueden estar opcionalmente interrumpidos con O, S(O)_n, CO o NR¹, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado y cicloalqueno C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, que pueden estar opcionalmente interrumpidos con O, S(O)_n, CO o NR¹, arilo y hetarilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano, aril-alquilo C₁-C₄ y hetaril-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano,
- 30
- 35
- 40 R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alqueno C₃-C₈ y alquino C₃-C₈ opcionalmente sustituido independientemente entre sí de una a cinco veces con halógeno y de una a dos veces con alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻ y ciano, cicloalquilo C₃-C₈ y cicloalqueno C₃-C₈ opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y ciano, que pueden estar opcionalmente interrumpidos O, S(O)_n, CO, NR¹, opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, ciano, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado y cicloalqueno C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, que pueden estar opcionalmente sustituidos con O, S(O)_n, CO, NR¹, arilo y hetarilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano, aril-alquilo C₁-C₄ y hetaril-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n⁻, nitro y ciano,
- 45
- 50
- m representa un número de la serie 1 a 8, en el que en el caso de m ≥ 2 los restos L¹ pueden ser opcionalmente independientes entre sí,
- n representa un número 0, 1 o 2,
- 55 y sus sales.

A partir de la fórmula (I) resulta, teniendo en cuenta la posición del grupo carboxamida en el resto imidazol, la estructura de acuerdo con la invención muy especialmente preferida (I-1), sustituyentes o intervalos muy

especialmente preferidos de los restos expuestos en los compuestos de la fórmula (I-1) se explican a continuación. Su combinación constituye el intervalo preferido (3-1).

El objetivo, así como otros objetivos no mencionados explícitamente, que pueden derivarse o deducirse a partir de las relaciones discutidas en el presente documento, se consigue mediante la provisión de compuestos de acuerdo con la invención de la fórmula (I-1)



(I-1)

V representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, metilo y ciano,

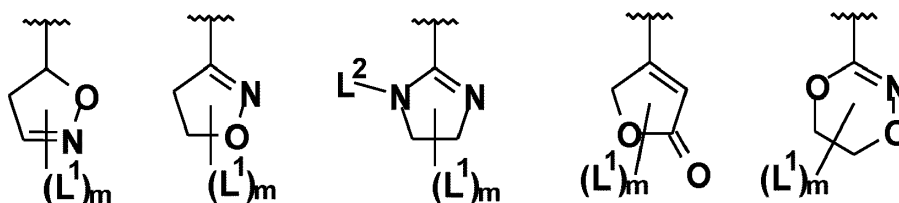
W representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo y ciano,

Y representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, etilo, propilo, alilo y propargilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con flúor, metoxi, etoxi y ciano,

A representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, etilo, propilo, alilo, propargilo, ciclopropilo y ciclopropilmetilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con flúor, metoxi, etoxi y ciano,

T representa un par de electrones,

X representa un heterociclo de cinco o seis miembros parcialmente saturado U-1, U-3, U-7, U-24 o U-33,



U-1

U-3

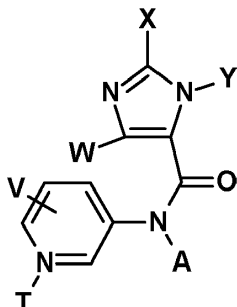
U-7

U-24

U-33

L¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, C(O)N(R²)(R³), C(O)OR⁵, metilo, etilo, propilo, isopropilo, *n*-butilo, isobutilo, *sec*-butilo, *terc*-butilo, pentilo, isopentilo, 2,2-dimetilpropilo, hexilo, neo-hexilo, alilo, metalilo, 2-butenilo, propargilo y 2-butilino opcionalmente sustituido de una a cinco veces independientemente entre sí con flúor, cloro y bromo, y una vez con metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, ciano, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, pirrolidilo, *N*-metilpirrolidilo, piperidilo y *N*-metilpiperidilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, fenilo, piridilo, pirimidilo, tienilo y tiazolilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano, bencilo, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo y pirazolilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano,

A partir de la fórmula (I) resulta, teniendo en cuenta la posición del grupo carboxamida en el resto imidazol, la estructura especialmente preferida (I-1). sustituyentes o intervalos especialmente preferidos de los restos expuestos en los compuestos de la fórmula (I-1) se explican a continuación. Su combinación constituye el intervalo preferido (4-1).

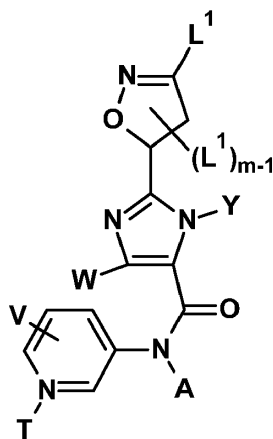


(I-1),

- 5
- V representa hidrógeno,
- W representa hidrógeno,
- Y representa metilo,
- A representa metilo o etilo,
- 10 T representa un par de electrones,
- X representa un heterociclo de cinco o seis miembros parcialmente saturado U-1, U-3, U-7, U-24 o U-33,
- L¹ representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, trifluorometilo, etilo, isopropilo, ciclopropilo, ciclopentilo, etoxicarbonilo, dimetilaminocarbonilo, fenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,3-diclorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo,
- 15 4-cianofenilo, 4-metilfenilo, 4-fluorofenilo, 4-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropan-2-il)fenilo, 2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenilo, 4-nitrofenilo, 4-metoxifenilo, 2-piridinilo, 4-trifluoropiridin-2-ilo, 3-piridinilo y 4-piridinilo,
- L² representa un resto de la serie hidrógeno y metilo,
- m representa un número de 1 a 4,
- 20 y sus sales.

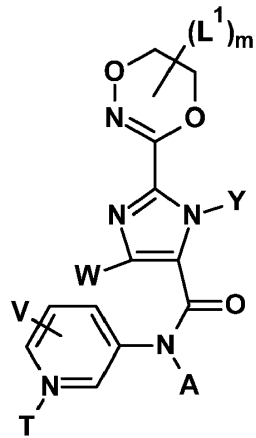
En las siguientes formas de realización preferidas (I-1a), (I-1b), (1-1d), (1-1f) y (I-1o) todos los grupos, restos y sustituyentes tienen el significado descrito anteriormente y en particular el significado descrito en la configuración (0) o en los intervalos preferidos (1) a (4). Se prefieren especialmente las formas de realización (I-1a), (I-1b) y (I-1d), se prefiere muy especialmente la forma de realización (I-1a).

- 25 En una forma de realización preferida la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I-1a).



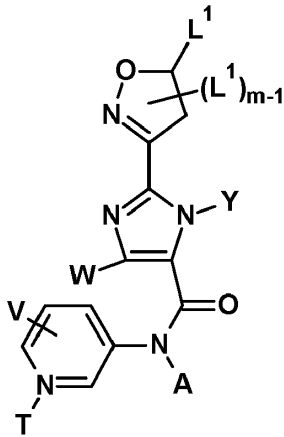
(I-1a)

En otra forma de realización preferida la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I-1b).



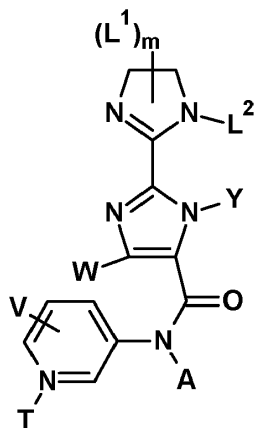
(I-1b)

En otra forma de realización preferida la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I-1d).



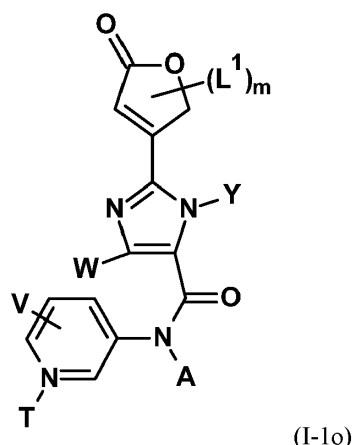
(I-1d)

En otra forma de realización preferida la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I-1f).



(I-1f)

En otra forma de realización preferida la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I-1o).



En el intervalo preferido (1), siempre que no se indique lo contrario,

halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente a su vez de la serie flúor, cloro y bromo,

- 5 hetarilo (sinónimo de heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, tal como por ejemplo hetarilalquilo) seleccionado de la serie furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, benzimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazoles, quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo,
- 10 heterociclilo representa un anillo saturado de 3, 4, 5 o 6, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, no debiendo estar sin embargo 2 átomos de nitrógeno directamente adyacentes, por ejemplo representa aziridinilo, azetidínilo, azolidínilo, azinánilo, oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo, oxanilo, dioxanilo, tiiranilo, tietanilo, tiolanilo, tianilo, tetrahidrofurilo.
- 15

En el intervalo preferido (2), siempre que no se indique lo contrario,

halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente representa flúor, cloro y bromo,

- 20 hetarilo (también como parte de una unidad más grande, tal como hetarilalquilo) representa piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, bencilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo así como

- heterociclilo (también como parte de una unidad más grande, tal como heterociclilalquilo) representa un anillo saturado o insaturado de 3, 4 o 5, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, no debiendo estar sin embargo 2 átomos de nitrógeno directamente adyacentes, por ejemplo representa 1- o 2-aziridinilo, 2-oxiranilo, 2-tiiranilo, 1- o 2-azetidínilo, 2- o 3-oxetanilo, 2- o 3-tietanilo, 1,3-dioxetan-2-ilo, 1-, 2- o 3-pirrolidinilo.
- 25

En el intervalo preferido (3), siempre que no se indique lo contrario,

halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente representa flúor, cloro y bromo y

- 30 heterociclilo (también como parte de una unidad más grande, tal como heterociclilalquilo) representa un anillo saturado o insaturado de 3 o 4, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, no debiendo estar sin embargo 2 átomos de nitrógeno directamente adyacentes, por ejemplo representa 1- o 2-aziridinilo, 2-oxiranilo, 2-tiiranilo, 1- o 2-azetidínilo, 2- o 3-oxetanilo, 2- o 3-tietanilo o 1,3-dioxetan-2-ilo. Restos sustituidos con halógeno, por ejemplo haloalquilo (= haloalquil), están, siempre que no se diga lo contrario, halogenados una vez o varias veces hasta el número de sustituyentes máximo posible. En el caso de halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o distintos. Halógeno representa a este respecto flúor, cloro, bromo o yodo, en particular representa flúor, cloro o bromo.
- 35

Restos hidrocarburo saturados o insaturados tales como alquilo o alqueniilo pueden ser, también en relación con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, siempre que sea posible, ser en cada caso de cadena lineal o ramificados.

- 40 Restos opcionalmente sustituidos, siempre que no se mencione lo contrario, pueden estar sustituido una o varias veces, pudiendo ser los sustituyentes iguales o distintos en el caso de sustituciones múltiples. Sustituyentes posibles para restos opcionalmente sustituidos se seleccionan de halógeno, nitro, ciano, carbamoilo, formilo, hidroxiimino, cianimino, carboxi, alquilo C₁-C₆, alqueniilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄ de cadena lineal o ramificado, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n-, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n-, heterociclilo, arilo, hetarilo, aril-alquilo C₁-C₄ y hetaril-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆-minocarbonilo, di-(alquil C₁-

5 (aril-alcoxi C₁-C₄)-(alquenil C₃-C₈)imidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)-(alquinil C₃-C₈)imidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)-(cicloalquil C₃-C₈)imidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)-(cicloalquil C₃-C₈-alquil C₁-C₄)imidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)heterocicilimidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)arilimidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)hetarilimidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)(aril-alquil C₁-C₄)imidoilo, (aril-alcoxi C₁-C₄)(hetaril-alquil C₁-C₄)imidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)(alquil C₁-C₆)imidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)-(alquenil C₃-C₈)imidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)-(alquinil C₃-C₈)imidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)-(cicloalquil C₃-C₈)imidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)-(cicloalquil C₃-C₈-alquil C₁-C₄)imidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)heterocicilimidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)arilimidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)hetarilimidoilo, (hetaril-alcoxi C₁-C₄)(aril-alquil C₁-C₄)imidoilo y (hetaril-alcoxi C₁-C₄)(hetaril-alquil C₁-C₄)imidoilo, alquil C₁-C₆-cianimino, alquenil C₃-C₈-cianimino, alquinil C₃-C₈-cianimino, cicloalquil C₃-C₈-cianimino de cadena lineal o ramificados, cicloalquil C₃-C₈-alquil C₁-C₄-cianimino, heterocicilcianimino, arilcianimino, hetarilcianimino de cadena lineal o ramificados, aril-alquil C₁-C₄-cianimino y hetaril-alquil C₁-C₄-cianimino, alquil C₁-C₆-carboniloxi, alquenil C₃-C₈-carboniloxi, alquinil C₃-C₈-carboniloxi, cicloalquil C₃-C₈-carboniloxi de cadena lineal o ramificados, cicloalquil C₃-C₈-alquil C₁-C₄-carboniloxi, heterocicilcarboniloxi, arilcarboniloxi, hetarilcarboniloxi de cadena lineal o ramificados, aril-alquil C₁-C₄-carboniloxi y hetaril-alquil C₁-C₄-carboniloxi, pudiendo estar alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, heterocicilo, arilo, hetarilo, aril-alquilo C₁-C₄ o hetaril-alquilo C₁-C₄ en cada caso opcionalmente sustituido una o varias veces, de manera igual o distinta, con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n y representando n un número 0, 1 o 2.

20 En el caso de los restos Y y A, los sustituyentes se seleccionan preferentemente de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_n, haloalcoxi C₁-C₄, haloalquil C₁-C₄-S(O)_n, nitro y ciano, en los que n representa un número 0, 1 o 2. Cuando T en los compuestos de la fórmula (I) representa oxígeno, estos compuestos se encuentran como N-óxidos.

Cuando T en los compuestos de la fórmula (I) representa un par de electrones, estos compuestos se encuentran como piridinas.

25 Las definiciones de restos o explicaciones expuestas anteriormente en general o expuestas en intervalos preferidos son válidas para los productos finales y para los productos de partida y productos intermedios de manera correspondiente. Estas definiciones de restos pueden combinarse aleatoriamente entre sí, es decir, también entre los intervalos preferidos respectivos.

De acuerdo con la invención preferentemente se usan compuestos de la fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados expuestos anteriormente como preferidos (intervalo preferido (1)).

30 De acuerdo con la invención de manera especialmente preferente se usan compuestos de la fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados expuestos anteriormente como especialmente preferidos (intervalo preferido (2)).

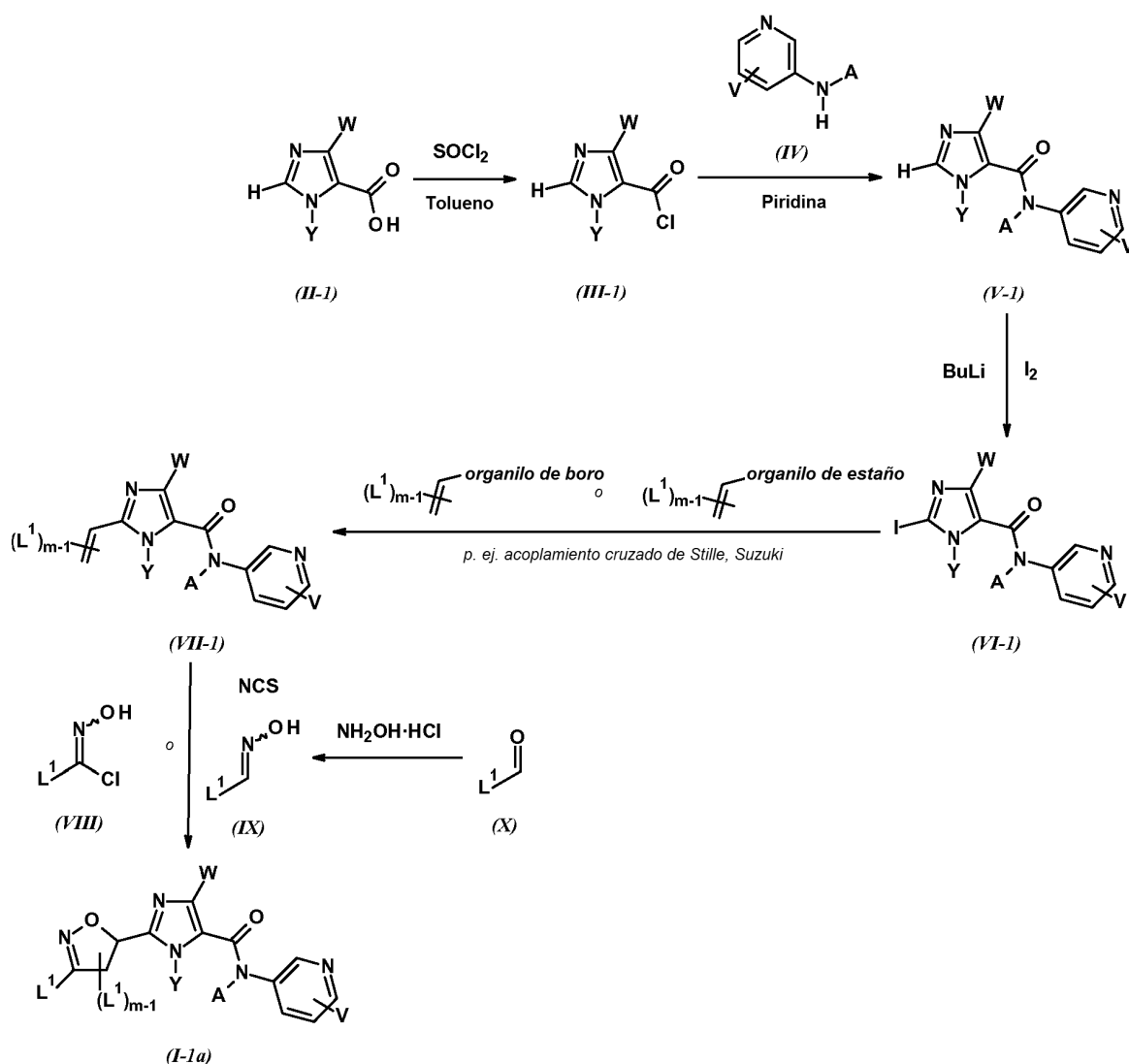
35 De acuerdo con la invención de manera muy especialmente preferente se usan compuestos de la fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados expuestos anteriormente como muy especialmente preferidos (intervalo preferido (3)).

De acuerdo con la invención en particular preferentemente se usan compuestos de la fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados expuestos anteriormente como especialmente preferidos (intervalo preferido (4)).

40 Los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse en función del tipo de sustituyentes como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o mezclas isoméricas correspondientes en diferente composición. Estos estereoisómeros son por ejemplo enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención comprende así tanto estereoisómeros puros como cualquier mezcla de estos isómeros.

Los compuestos de la fórmula (I-1) pueden sintetizarse por ejemplo según los procedimientos A y B tal como se representa en los siguientes esquemas.

45 **Procedimiento A (cuando X representa U-1)**



BuLi = *n*-Butil-litio, NCS = *N*-Clorosuccinimida

Los ácidos imidazolil-carboxílicos necesarios de la fórmula (II-1) se encuentran comercialmente disponibles o se pueden preparar por ejemplo según procedimientos conocidos de la bibliografía, por ejemplo, O'Connell, John F.; Parquette, Jonathan; Yelle, William E.; Wang, Wilhelm; Rapoport, Henry, *Synthesis* 1988, 767-771, patente de BASF Aktiengesellschaft: US4864030 A1, 1989, patente de Takeda Pharmaceutical Company Limited: EP2530078 A1, 2012, patente de TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.: US2012/10414 A1, 2012, Subrayan, Ramachandran P.; Thurber, Ernest L.; Rasmussen, Paul G., *Tetrahedron*, 1994, 50, 2641 -2656.

Las 3-amino-piridinas necesarias de la fórmula (IV) se encuentran comercialmente disponibles o se pueden preparar por ejemplo según procedimientos conocidos de la bibliografía, por ejemplo, Liu, Zhen-Jiang; Vors, Jean-Pierre; Gesing, Ernst R. F.; Bolm, Carsten, *Advanced Synthesis and Catalysis*, 2010, 352, 3158 - 3162, patente de BAYER CROPSCIENCE AG: US2010/305124 A1, 2010, Shafir, Alexandr; Buchwald, Stephen L., *Journal of the American Chemical Society*, 2006, 128*, 8742 - 8743.

Para el procedimiento de acoplamiento por litiación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de Hoechst Aktiengesellschaft: US4764624 A1, 1988. Ohta, Shunsaku; Yamamoto, Tetsuya; Kawasaki, Ikuo; Yamashita, Masayuki; Katsuma, Hideo; Nasako, Rieko; Kobayashi, Kazuhiro; Ogawa, Kazuo, *Chemical and Pharmaceutical Bulletin*, 1992, 40, 2681 - 2685. Hara, Kenji; Iwahashi, Keiji; Kanamori, Yoshikazu; Naito, Satoshi; Takakusagi, Satoru; Uosaki, Kohei; Sawamura, Masaya, *Chemistry Letters*, 2006, 35, 870 - 871.

Como disolvente se mencionan a modo de ejemplo: dietil éter, metil-terc-butil éter, tetrahidrofurano, dioxano.

Como agente de litiación se mencionan a modo de ejemplo: *n*-butil-litio, di-isopropilamina de litio, terc-butilato de litio.

La temperatura de reacción se encuentra opcionalmente entre -100 °C y -75 °C para la etapa de litación inicial.

Los organilos metálicos necesarios (por ejemplo ácido/éster vinil-borónico, etc.), así como los catalizadores necesarios son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica, por ejemplo, Coombs, John R.; Zhang, Liang; Morken, James P., *Organic Letters*, 2015, 17, 1708 - 1711. Barbero, Asunción; Pulido, Francisco J., *Chemical Society Reviews*, 2005, 34, 913 - 920.

Las cloroaloximas necesarias de la fórmula (VIII) se encuentran comercialmente disponibles o se pueden preparar por ejemplo según procedimientos conocidos de la bibliografía, por ejemplo, Liu, Kou-Chang; Shelton, Becky R.; Howe, Robert K., *J. Org. Chem.* 1980, 45, 3916 - 3918.

Las aldoximas necesarias de la fórmula (IX) se encuentran comercialmente disponibles o se pueden preparar a partir de aldehídos de la fórmula (X), por ejemplo pueden tener lugar análogamente a los procedimientos descritos en la patente de Astra Zeneca AB; NPS Pharmaceuticals: US2007/0037816 A1, 2007.

Los aldehídos necesarios de la fórmula (X) son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Para la ciclación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de Abbott Laboratories: WO2009/067613 A1, 2009. Tanaka, Kiyoshi; Masuda, Hideyuki; Mitsunashi, Keiryō, *Bulletin Chemical Society Japan*, 1984, 57, 2184 - 2187.

Ejemplos de agentes de halogenación adecuados (cuando se usan) son *N*-clorosuccinimida, 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína o *N*-bromosuccinimida.

Como disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos disolventes orgánicos inertes, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno, ciclohexano), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como dietil éter, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como acetato de etilo o metilo), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenzoceno), nitrilos (tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, hexametilfosforamida), así como dimetilsulfóxido, sulfolano o agua o mezclas de los disolventes mencionados.

Como aceptor de ácido se tienen en cuenta todas las bases orgánicas o inorgánicas habituales, por ejemplo, aminas orgánicas tales como trietilamina, diisopropilamina, *N*-metilmorfolina, piridina o *N,N*-dimetilaminopiridina, carbonatos de metal alcalino o de metal alcalinotérreo tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio; hidrogenocarbonatos de metal alcalino o hidrogenocarbonatos de potasio.

La reacción puede llevarse a cabo a vacío, a presión normal o sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferentemente la reacción tiene lugar a presión normal y temperaturas de 20 °C a 140 °C.

Procedimiento de amidación

Los productos intermedios de la fórmula (V-1) en el procedimiento de acuerdo con la invención pueden sintetizarse con ayuda de una reacción de amidación conocida de la bibliografía, o de manera análoga a los ejemplos mencionados de manera explícita.

Se han descrito numerosas condiciones de reacción para la etapa de amidación, por ejemplo G. Benz en *Comprehensive Organic Synthesis*, 1ª Ed., Pergamon Press, Oxford, 1991, Vol. 6, pág. 381 - 417; P.D. Bailey et al. en *Comprehensive Organic Functional Group Transformation*, 1ª Ed., Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, Vol. 5, pág. 257 - 308 y R.C. Larock en *Comprehensive Organic Transformations*, 2ª Ed., Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, pág. 1929 - 1994. Algunas de estas reacciones discurren a través de cloruros de ácido carboxílico intermedios, que pueden emplearse en forma aislada o en forma generada *in situ*.

Las reacciones de amidación tienen lugar opcionalmente en presencia de un agente de condensación, opcionalmente en presencia de un aceptor de ácido y opcionalmente en presencia de un disolvente.

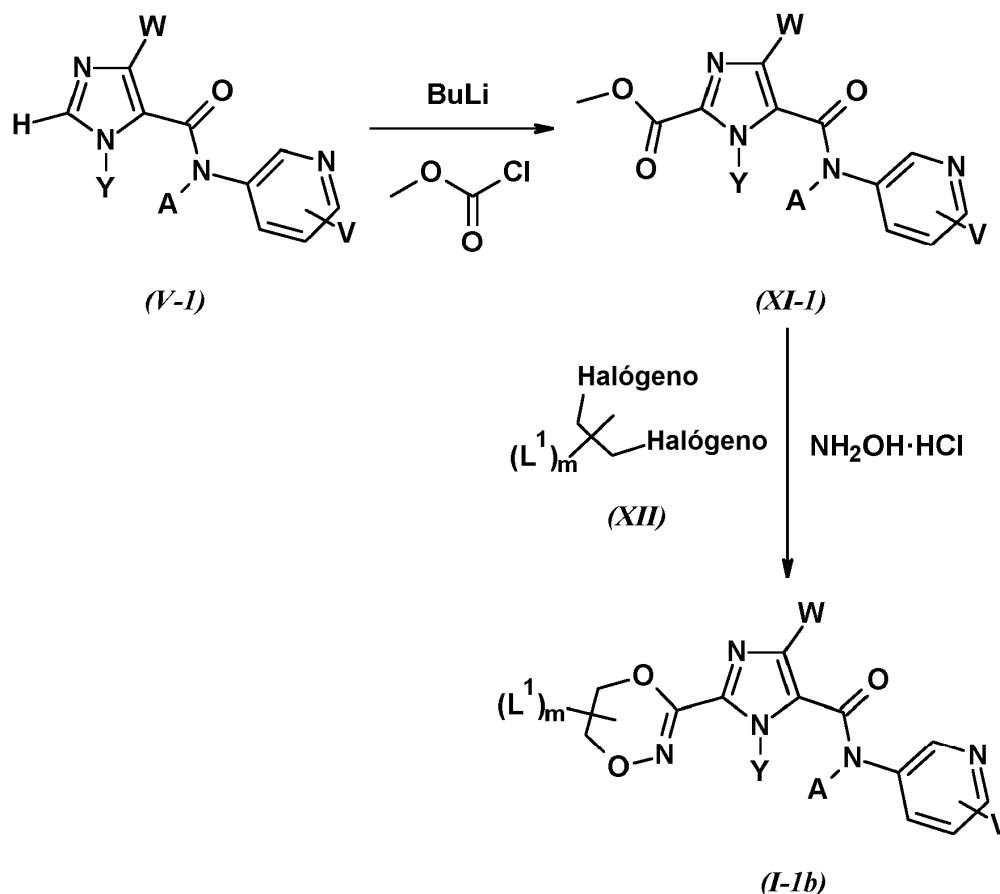
Como agentes de condensación se tienen en cuenta todos los agentes de condensación que pueden usarse habitualmente para reacciones de amidación de este tipo. A modo de ejemplo se mencionan reactivos de activación tales como fosgeno, tricloruro de fósforo, oxiclورو de fósforo, cloruro de oxalilo, bromuro de oxalilo o cloruro de tionilo; carbodiimidas tales como *N,N*-d ciclohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI), u otros agentes de condensación habituales tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, *N,N*-carbonildiimidazol, 1-metoyoduro de 2-cloropiridina (reactivo de Mukaiyama), 2-etoxi-*N*-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinfosfonio (BROP), hexafluorofosfato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)tris(dimetilamino)fosfonio (BOP), tetrafluoroborato de *N,N,N,N*-bis(tetrametilen)clorouronio, hexafluorofosfato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N*-tetrametiluronio (HBTU), hexafluorofosfato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N*-bis(tetrametilen)uronio, tetrafluoroborato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N*-tetrametiluronio (TBTU), tetrafluoroborato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N*-

bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBT) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT.MM), normalmente disponibles como cloruro. Estos reactivos pueden emplearse por separado o en combinación.

5 Como aceptor de ácido se tienen en cuenta todas las bases orgánicas o inorgánicas habituales, por ejemplo, aminas orgánicas tales como trietilamina, diisopropilamina, *N*-metilmorfolina, piridina o *N,N*-dimetilaminopiridina, carbonatos de metal alcalino o de metal alcalinotérreo tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio; hidrogenocarbonatos de metal alcalino o hidrogenocarbonatos de potasio. La reacción de amidación en los procedimientos de acuerdo con la invención se lleva a cabo opcionalmente en presencia de una reacción auxiliar tal como, por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilaminopiridina. Como disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos disolventes orgánicos inertes, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno, ciclohexano), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como acetato de etilo o metilo), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenceno), nitrilos (tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, hexametilsulforamida), así como dimetilsulfóxido, sulfolano o agua o mezclas de los disolventes mencionados.

20 También es posible usar anhídridos mixtos para la preparación de compuestos de la fórmula (V-1) (véase Anderson, George W.; Zimmerman, Joan E.; Callahan, Francis M., J. Am. Chem. Soc. 1967, 89, 5012 - 5017). En este procedimiento, es posible usar ésteres de ácido clorofórmico, tal como por ejemplo cloroformiato de metilo, cloroformiato de etilo, cloroformiato de isobutilo y cloroformiato de isopropilo. Del mismo modo, es posible para este fin usar cloruro de dietilacetilo, cloruro de trimetilacetilo y compuestos similares.

Procedimiento B (cuando X representa U-33)



BuLi = *n*-Butil-litio

25 Para el procedimiento de acoplamiento por litación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de Hoechst Aktiengesellschaft: US4764624 A1, 1988. Ohta, Shunsaku; Yamamoto, Tetsuya; Kawasaki, Ikuo; Yamashita, Masayuki; Katsuma, Hideo; Nasako, Rieko; Kobayashi, Kazuhiro; Ogawa, Kazuo,

Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 1992, 40, 2681 - 2685. Hara, Kenji; Iwahashi, Keiji; Kanamori, Yoshikazu; Naito, Satoshi; Takakusagi, Satoru; Uosaki, Kohei; Sawamura, Masaya, Chemistry Letters, 2006, 35, 870 - 871.

Como disolvente se mencionan a modo de ejemplo: dietil éter, metil-terc-butil éter, tetrahidrofurano, dioxano.

Como agente de litación se mencionan a modo de ejemplo: *n*-butil-litio, di-isoproilamina de litio, terc-butilato de litio.

- 5 La temperatura de reacción se encuentra opcionalmente entre -100 °C y -75 °C para la etapa de litación inicial.

Para la ciclación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de BAYER AG: US5476936, 1995.

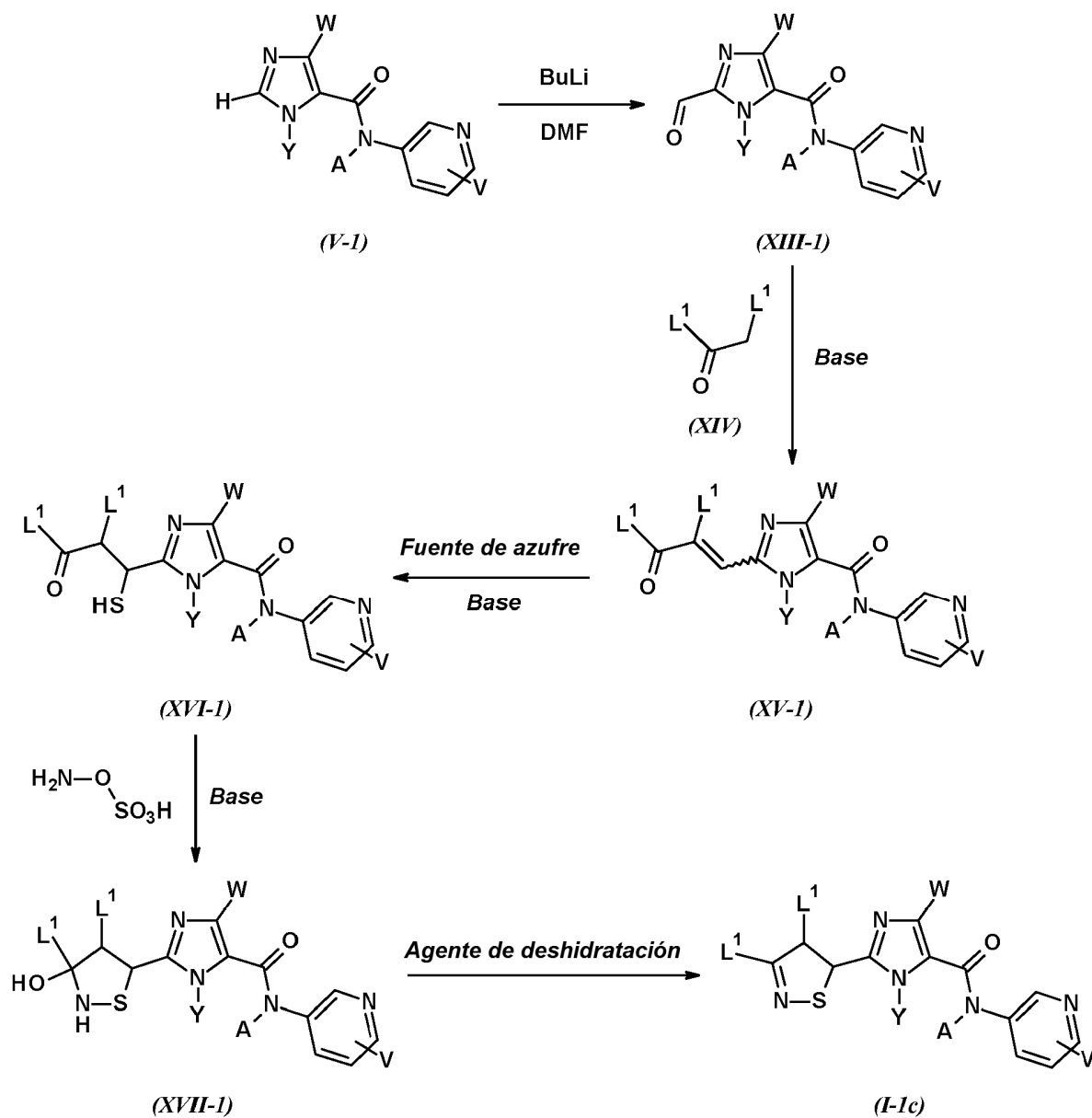
Los dihaloalquilos necesarios de la fórmula (XII) son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

- 10 Como disolvente se mencionan a modo de ejemplo: metanol, etanol.

Como aceptor de ácido se mencionan a modo de ejemplo: hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de litio.

La reacción puede llevarse a cabo a vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferentemente la reacción tiene lugar a presión normal y temperaturas de 20 °C a 140 °C.

Procedimiento C (cuando X representa U-2)



BuLi = *n*-Butil-litio

Para el procedimiento de acoplamiento por litiación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de Hoechst Aktiengesellschaft: US4764624 A1, 1988. Ohta, Shunsaku; Yamamoto, Tetsuya; Kawasaki, Ikuo; Yamashita, Masayuki; Katsuma, Hideo; Nasako, Rieko; Kobayashi, Kazuhiro; Ogawa, Kazuo, Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 1992, 40, 2681 - 2685. Hara, Kenji; Iwahashi, Keiji; Kanamori, Yoshikazu; Naito, Satoshi; Takakusagi, Satoru; Uosaki, Kohei; Sawamura, Masaya, Chemistry Letters, 2006, 35, 870 - 871.

Como disolvente se mencionan a modo de ejemplo: dietil éter, metil-terc-butil éter, tetrahidrofurano, dioxano.

Como agentes de litiación se mencionan a modo de ejemplo: *n*-butil-litio, di-isopropilamina de litio, terc-butolato de litio.

La temperatura de reacción se encuentra opcionalmente entre $-100\text{ }^\circ\text{C}$ y $-75\text{ }^\circ\text{C}$ para la etapa de litiación inicial.

10 La síntesis de los compuestos de la fórmula (I-1) a partir de aldehídos de la fórmula (XIII-1) se describe, por ejemplo, patente de SYNGENTA PARTICIPATIONS AG: WO2013/037626 A1, 2013. Patente de BASF SE: WO2013/092943 A1, 2013.

Los compuestos necesarios de la fórmula (XIV) son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

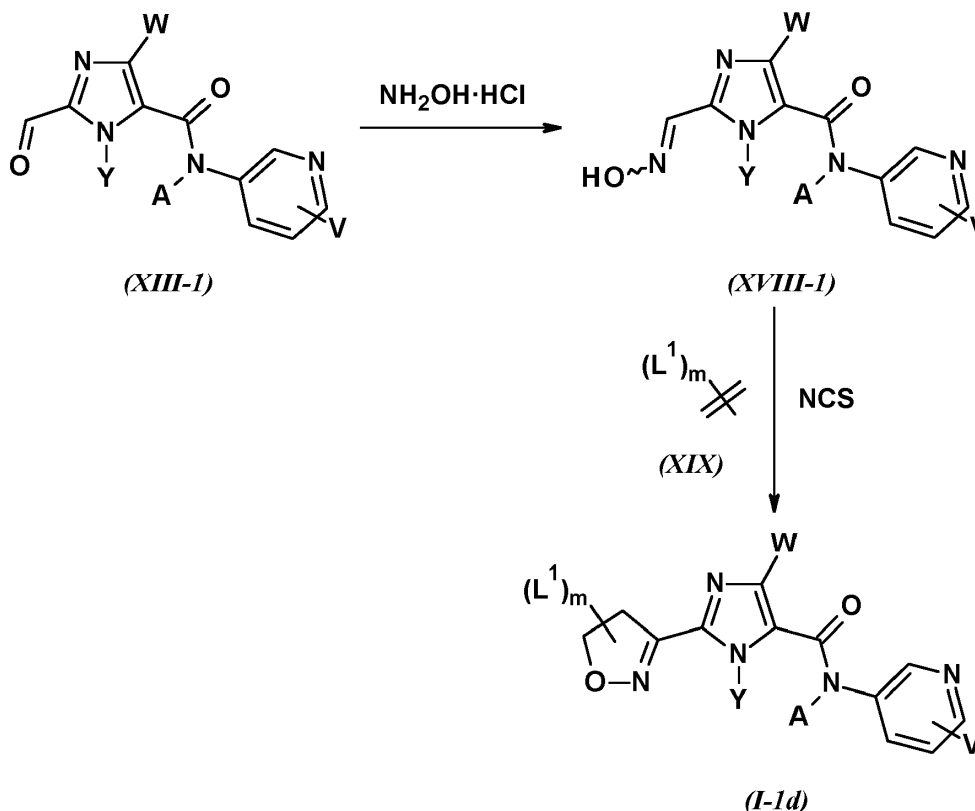
Como fuente de azufre se mencionan a modo de ejemplo: sulfuro de hidrógeno.

5 Como agente de deshidratación se mencionan a modo de ejemplo: ácidos tales como por ejemplo ácido sulfúrico concentrado, ácido trifluoroacético o ácido para-toluenosulfónico, tamiz molecular.

10 Como aceptor de ácido se tienen en cuenta todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales, por ejemplo, aminas orgánicas tales como trietilamina, diisopropilamina, *N*-metilmorfolina, piridina o *N,N*-dimetilaminopiridina, carbonatos alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio; hidrogenocarbonatos alcalinos tales como hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio. La reacción de amidación en los procedimientos de acuerdo con la invención se lleva a cabo opcionalmente en presencia de un auxiliar de reacción adecuado tal como, por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilaminopiridina. Como disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes, como ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno, ciclohexano), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como éster etílico o éster metílico de ácido acético), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenceno), nitrilos (tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, triamida de ácido hexametilfosfórico), así como dimetilsulfóxido, sulfolano o agua o mezclas de los disolventes mencionados.

20 Como disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno, ciclohexano), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como éster etílico o éster metílico de ácido acético), nitrohidrocarburos (como nitrometano, nitroetano, nitrobenceno), nitrilos (tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, triamida de ácido hexametilfosfórico), así como dimetilsulfóxido o sulfolano o mezclas de los disolventes mencionados.

Procedimiento D (cuando X representa U-3)



30 Las aldoximas de la fórmula (XVIII-1) se pueden preparar a partir de aldehídos de la fórmula (XIII-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en Astra Zeneca AB; patente de NPS Pharmaceuticals: US2007/0037816 A1, 2007.

Para la ciclación, se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de Abbott Laboratories: WO 2009/067613 A1, 2009.

Los alquenos necesarios de la fórmula (XIX) son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

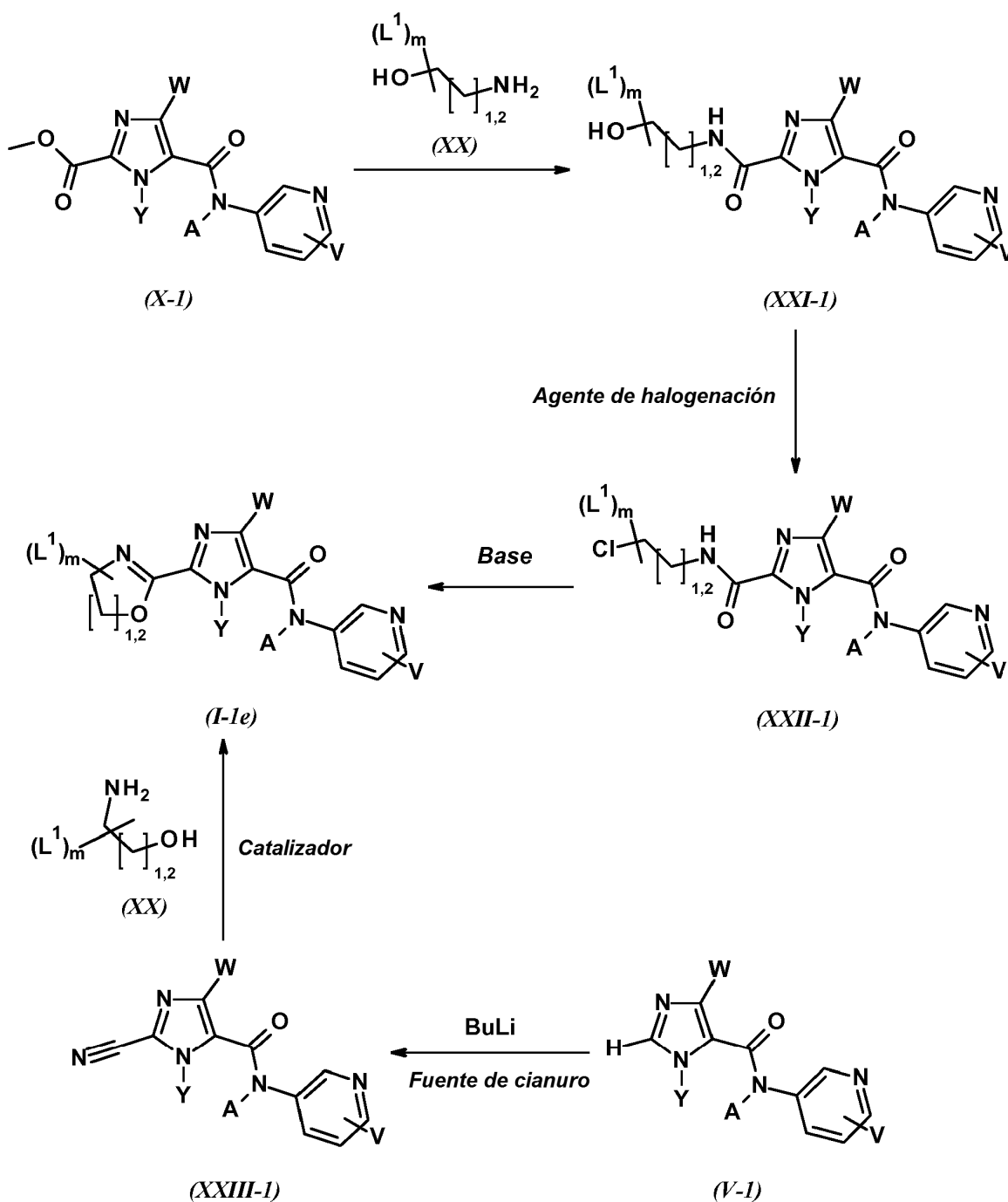
- 5 Ejemplos de agentes de halogenación adecuados son *N*-clorosuccinimida, 1,3-dicloro-5,5-dimetilhidantoína o *N*-bromosuccinimida.

10 disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno, ciclohexano), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como éster etílico o éster metílico de ácido acético), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenceno), nitrilos (tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, triamida de ácido hexametilfosfórico), así como dimetilsulfóxido o sulfolano o mezclas de los disolventes mencionados.

15 Como aceptor de ácido se tienen en cuenta todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales, por ejemplo, aminas orgánicas tales como trietilamina, diisopropilamina, *N*-metilmorfolina, piridina o *N,N*-dimetilaminopiridina, carbonatos alcalinos o alcalinotérreos tales como carbonato de litio carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio; hidrogenocarbonatos alcalinos tales como hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio.

20 La reacción puede llevarse a cabo a vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferentemente la reacción tiene lugar a presión normal y temperaturas de 20 °C a 140 °C.

Procedimiento E (cuando X representa U-5 o U-29)



BuLi = *n*-Butil-litio

Los compuestos de la fórmula (I-1e) se pueden preparar a partir de ésteres de la fórmula (X-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en Shafiee, Abbas; Ebrahimi-Bibalan, Tayebah; Bakhshi-Dezfouli, Mohammad E.; Ghanbarpour, Alireza, *Heterocycles*, 1987, 26, 2865 - 2869.

- 5 Los aminoalcoholes necesarios de la fórmula (XX) son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Como agente de halogenación se mencionan a modo de ejemplo: cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo.

Como bases se mencionan a modo de ejemplo: hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de litio, hidruro de sodio, carbonato de potasio.

Las reacciones se pueden llevar a cabo a vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferentemente la reacción tiene lugar a presión normal y temperaturas de 20 °C a 140 °C.

5 Para el procedimiento de acoplamiento por litación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente Hoechst Aktiengesellschaft: US4764624 A1, 1988. Ohta, Shunsaku; Yamamoto, Tetsuya; Kawasaki, Ikuo; Yamashita, Masayuki; Katsuma, Hideo; Nasako, Rieko; Kobayashi, Kazuhiro; Ogawa, Kazuo, Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 1992, 40, 2681 - 2685. Hara, Kenji; Iwahashi, Keiji; Kanamori, Yoshikazu; Naito, Satoshi; Takakusagi, Satoru; Uosaki, Kohei; Sawamura, Masaya, Chemistry Letters, 2006, 35, 870 - 871.

Como disolvente se mencionan a modo de ejemplo: dietil éter, metil-terc-butil éter, tetrahidrofurano, dioxano.

Como agentes de litación se mencionan a modo de ejemplo: *n*-butil-litio, di-isoproilamina de litio, terc-butilato de litio.

10 Como fuente de cianuro se mencionan a modo de ejemplo: cianuro de para-toluolenosulfonilo, dimetilmalononitrilo, acetoncianhidrina.

La temperatura de reacción se encuentra opcionalmente entre -100 °C y -75 °C para la etapa de litación inicial.

15 Para la ciclación de los nitrilos de la fórmula (XXIII-1) se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, Ge, Haixia; Liu, Ping; Li, Xiangnan; Sun, Wie; Li, Jianli; Yang, Bingqin; Shi, Zhen, Tetrahedron, 2013, 69, 6591 - 6597. Ge, Haixia; Liu, Ping; Li, Xiangnan; Sun, Wie; Li, Jianli; Yang, Bingqin; Shi, Zhen, Tetrahedron, 2012, 68, 5863 - 5881.

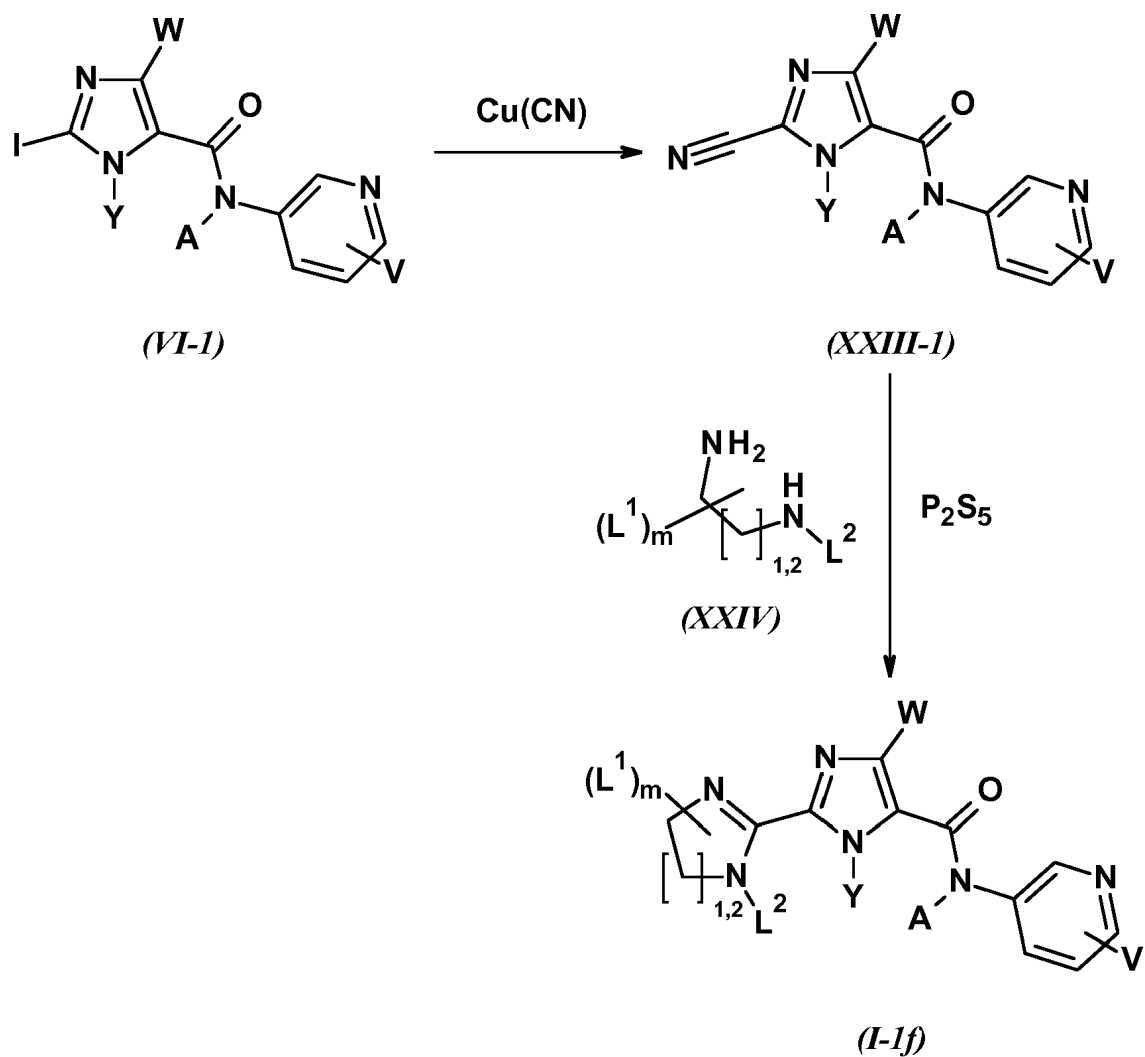
Como catalizador se mencionan a modo de ejemplo: nitrato de cobalto (II), cloruro de zinc (II), trifluorometansulfonato de bismuto (III).

20 Como disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno, ciclohexano), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como éster etílico o éster metílico de ácido acético), nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenceno), nitrilos (tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, triamida de ácido hexametilfosfórico), así como dimetilsulfóxido o sulfolano o mezclas de los disolventes mencionados.

25

La reacción se puede llevar a cabo a vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C bis 180 °C, preferentemente la reacción tiene lugar a presión normal y temperaturas de 20 °C a 140 °C.

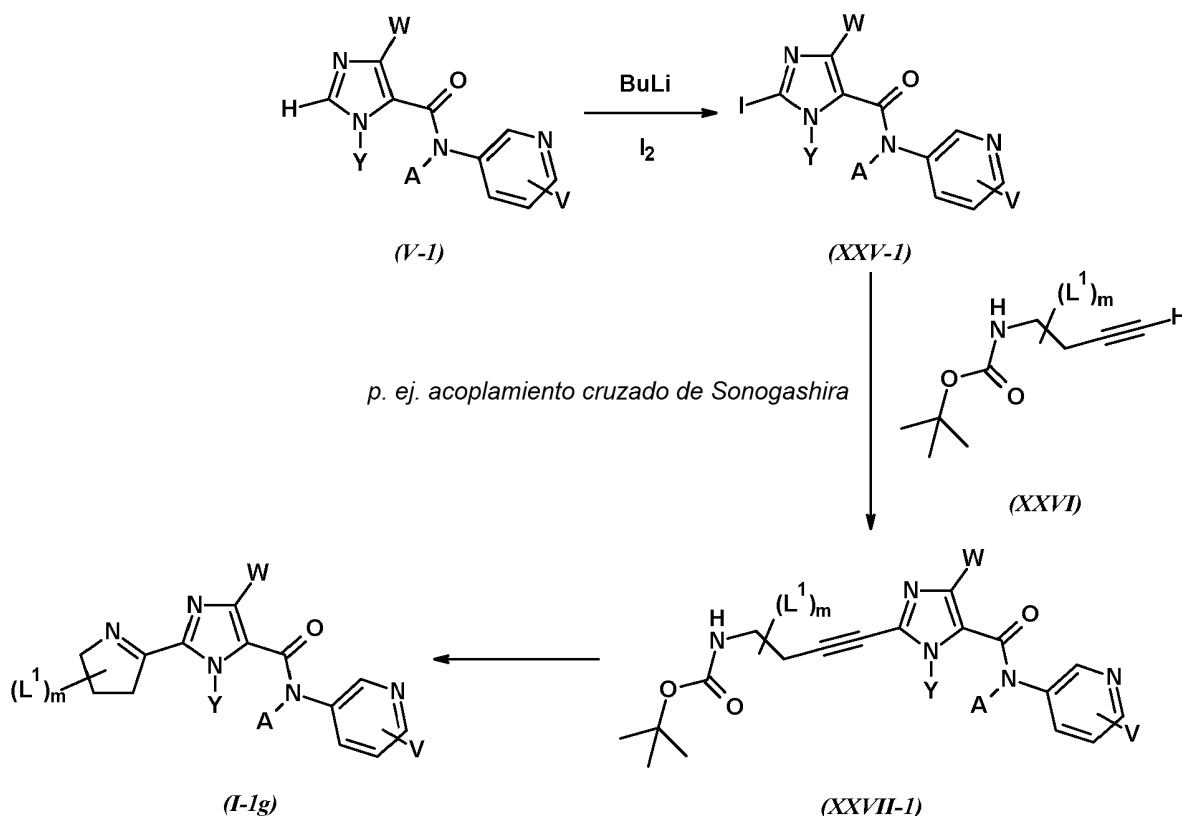
Procedimiento F (cuando X representa U-7 o U-31)



Los compuestos de la fórmula (I-1f) se pueden preparar a partir de nitrilos de la fórmula (XXIII-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en la patente de ELI LILLY AND COMPANY: WO 2011/060217 A1, 2011.

- 5 Las diaminas necesarias de la fórmula (XXIV) son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Procedimiento G (cuando X representa U-8)



BuLi = *n*-Butil-litio

Para el procedimiento de acoplamiento por litación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de Hoechst Aktiengesellschaft: US4764624 A1, 1988. Ohta, Shunsaku; Yamamoto, Tetsuya; Kawasaki, Ikuo; Yamashita, Masayuki; Katsuma, Hideo; Nasako, Rieko; Kobayashi, Kazuhiro; Ogawa, Kazuo, Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 1992, 40, 2681 - 2685. Hara, Kenji; Iwahashi, Keiji; Kanamori, Yoshikazu; Naito, Satoshi; Takakusagi, Satoru; Uosaki, Kohei; Sawamura, Masaya, Chemistry Letters, 2006, 35, 870 - 871.

Como disolvente se mencionan a modo de ejemplo: dietil éter, metil-terc-butil éter, tetrahidrofurano, dioxano.

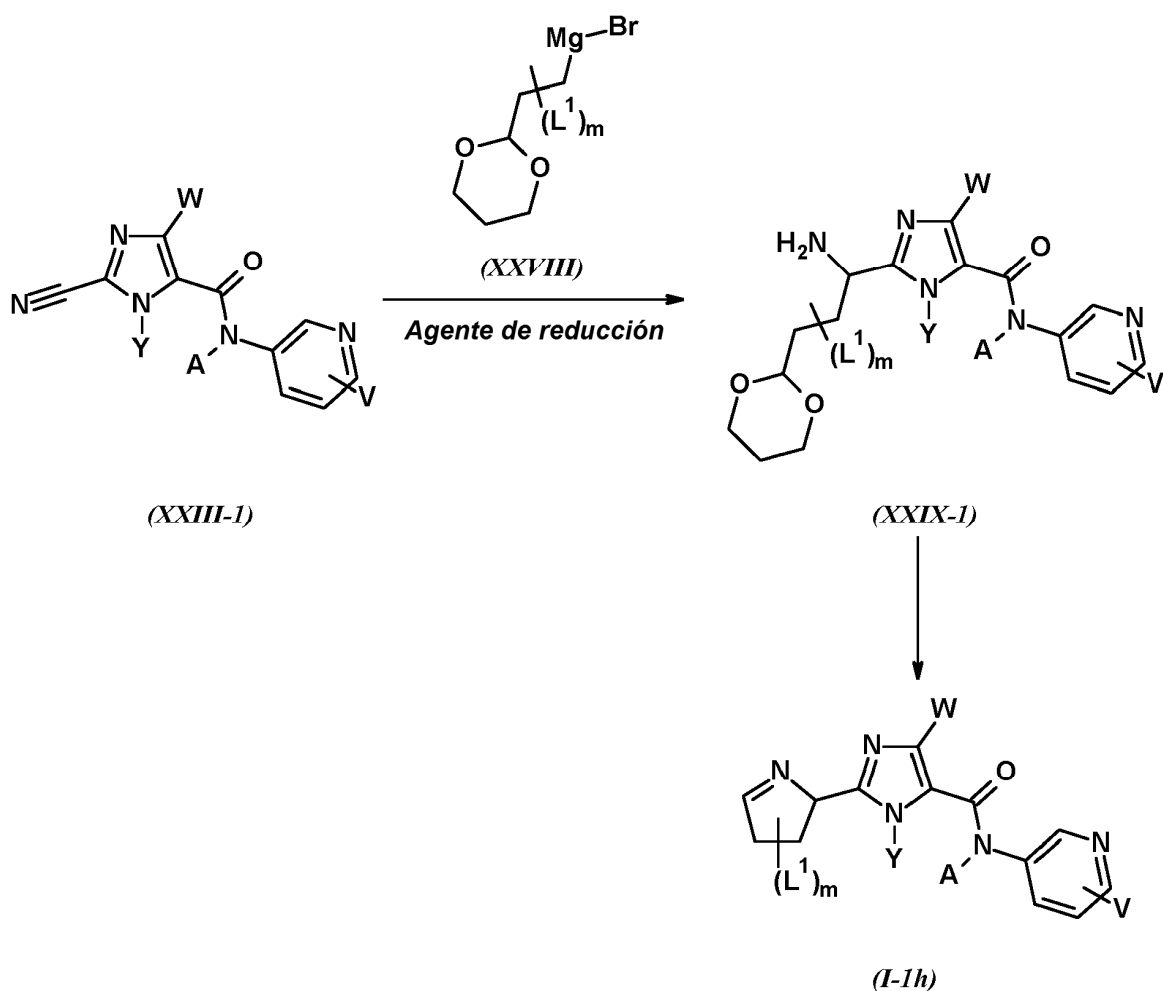
Como agentes de litación se mencionan a modo de ejemplo: *n*-butil-litio, di-isoproilamina de litio, terc-butilato de litio.

La temperatura de reacción se encuentra opcionalmente entre -100 °C y -75 °C para la etapa de litación inicial.

- 10 Los alquinos necesarios de la fórmula (XXVI) son productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica, por ejemplo, patente de ALLERGAN, INC.: US20089/0275627 A1, 2009.

Para la ciclación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, van Esseveldt, Bart C. J.; Vervoort, Paul W. H.; van Delft, Floris L.; Rutjes, Floris P. J. T., Journal of Organic Chemistry, 2005, 70, 1791 - 1795.

- 15 Procedimiento H (cuando X representa U-9)

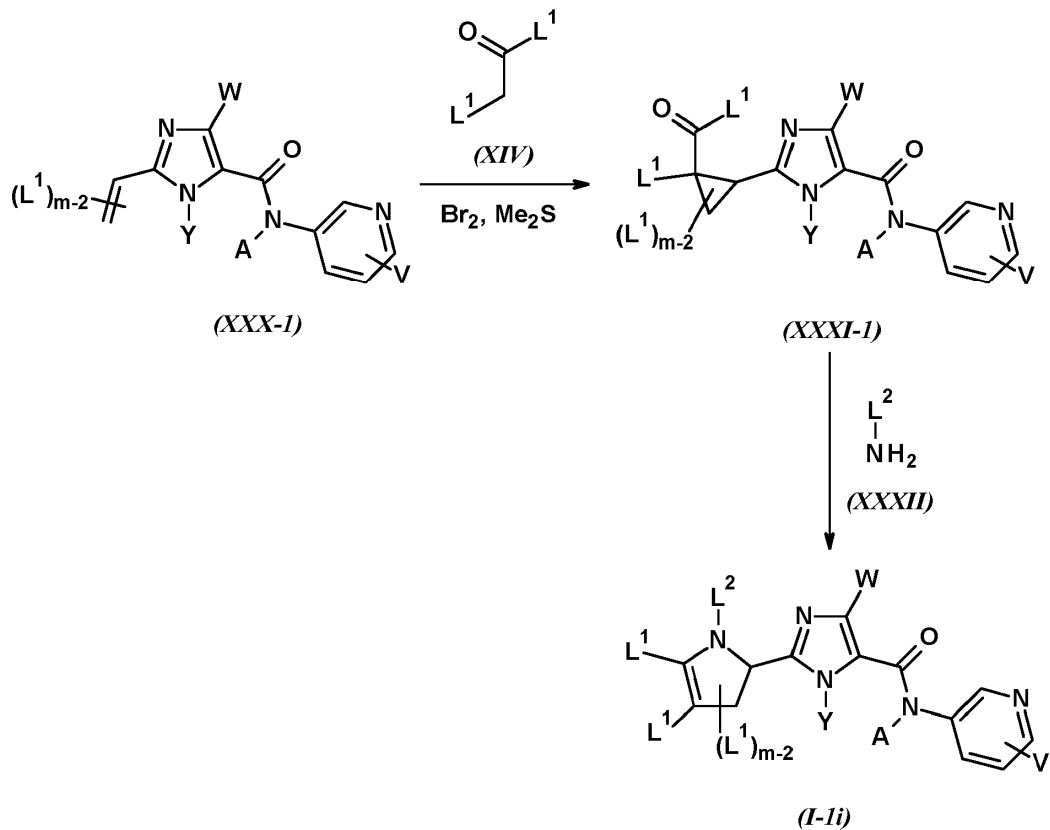


5 Los compuestos de la fórmula (I-1g) se pueden preparar a partir de nitrilos de la fórmula (XXIII-1), por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en Rinehart Jr., Kenneth L.; Kobayashi, Jun'ichi; Harbour, Gary C.; Gilmore, Jeremy; Mascal, Mark; Holt, Tom G.; Shield, Lois S.; Lafargue, Françoise, Journal of the American Chemical Society, 1987, 109,3378 - 3387.

Los haluros de magnesio necesarios de la fórmula (XXVIII) son productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Como agente de reducción se mencionan, a modo de ejemplo: borohidruro de sodio, cianoborohidruro de sodio, triacetoxiborohidruro de sodio.

10 Procedimiento I (cuando X representa U-10)



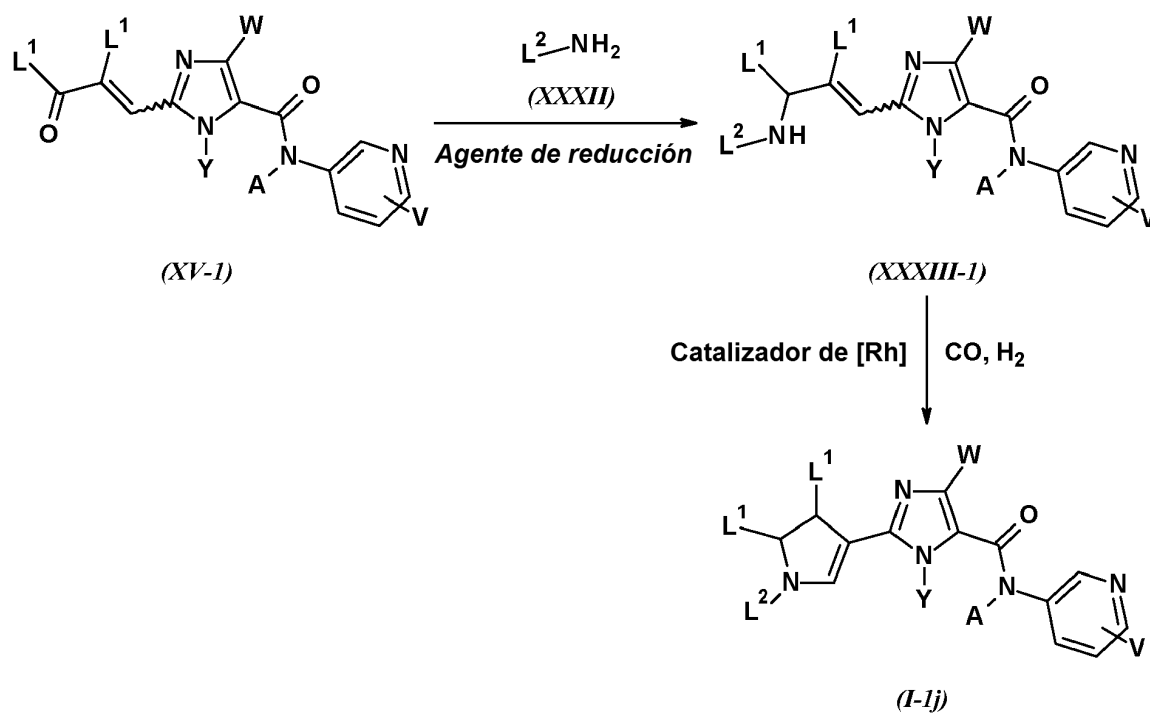
Los alquenos de la fórmula (XXX-1) necesarios se pueden preparar según un método similar al descrito en el procedimiento A.

5 Los compuestos de la fórmula (I-1i) se pueden preparar a partir de alquenos de la fórmula (XXX-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en Jacoby, Denis; Celerier, Jean Pierre; Haviari, Gjergi; Petit, Huguette; Lhomme, Gerard, Synthesis, 1992, 884 - 887.

Los compuestos necesarios de la fórmula (XIV) son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

10 Las aminas de la fórmula (XXXII) necesarias son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Procedimiento J (cuando X representa U-12)



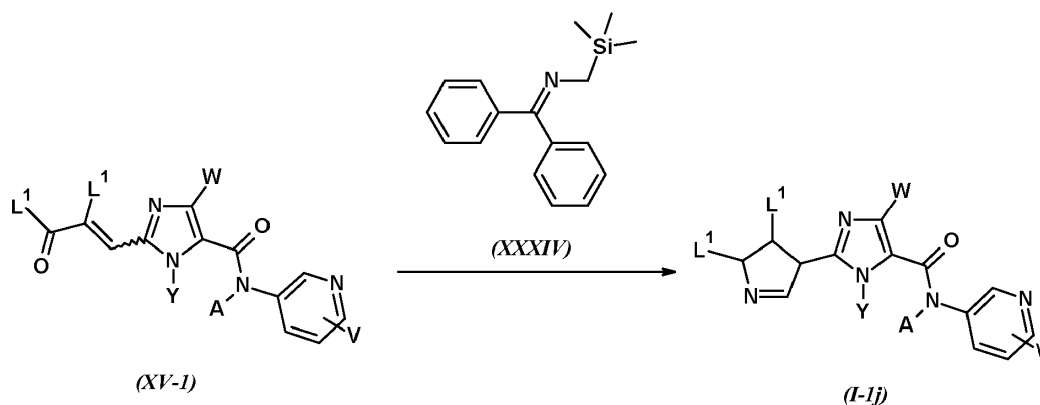
Las aminas de la fórmula (XXXIII-1) se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (XV-1), por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en He, Yong; Krishnamoorthy, Pasupathy; Lima, Heather M.; Chen, Yingzhong; Wu, Haiyan; Sivappa, Rasapalli; Rasika Dias, H. V.; Lovely, Carl J., *Organic & Biomolecular Chemistry*, 2011, 9, 2685 - 2701.

Las aminas de la fórmula (XXXII) necesarias son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Como agente de reducción se mencionan a modo de ejemplo: borohidruro de sodio, cianoborohidruro de sodio, triacetoxiborohidruro de sodio.

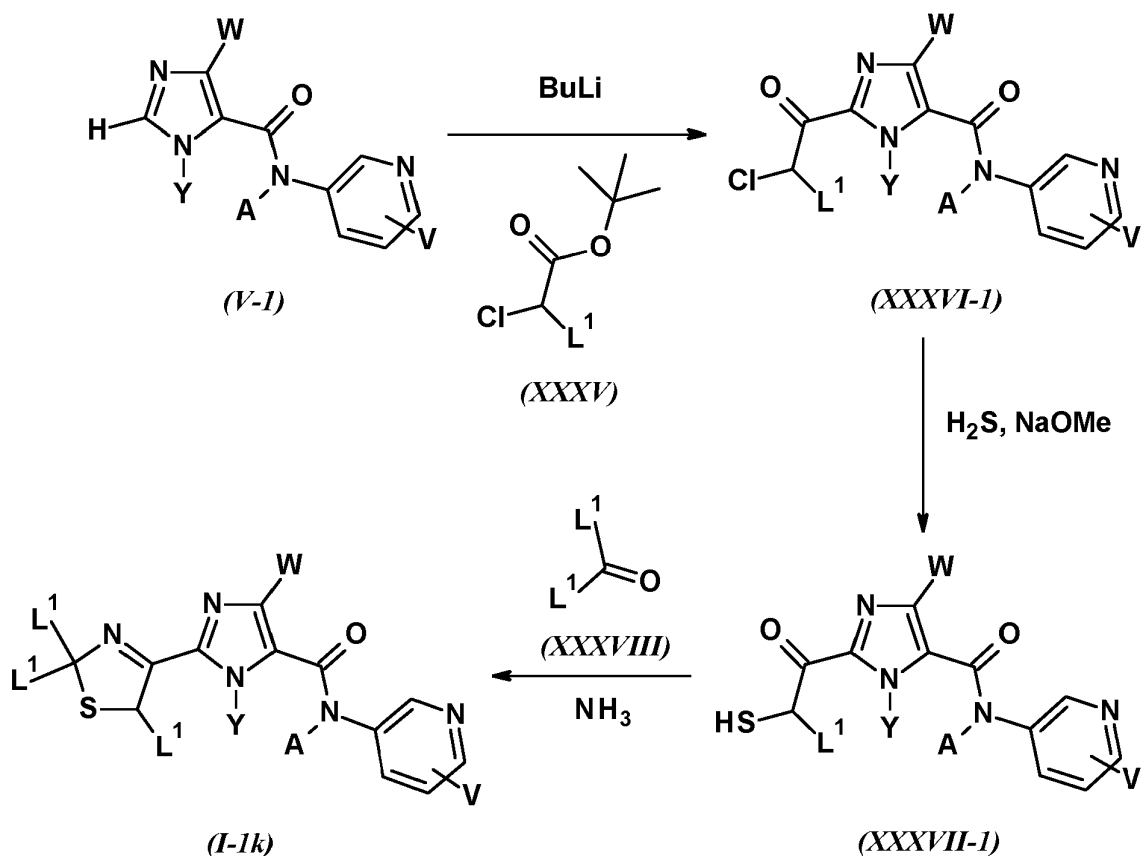
Para la ciclación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, Zheng, Xin; Cao, Bonan; Zhang, Xumu, *Tetrahedron Letters*, 2014, 55, 4489 - 4491.

Procedimiento J (cuando X representa U-14)



Los compuestos de la fórmula (I-1j) pueden prepararse a partir de compuestos de la fórmula (XV-1), por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en Tsuge, Otohiko; Kanemasa, Shuji; Hatada, Akira; Matsuda, Kojo, *Bulletin of the Chemical Society of Japan*, 1986, 59, 2537 - 2546.

Procedimiento K (cuando X representa U-16)



BuLi = *n*-Butil-litio

Para el procedimiento de acoplamiento por litiación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo, patente de Hoechst Aktiengesellschaft: US4764624 A1, 1988. Ohta, Shunsaku; Yamamoto, Tetsuya; Kawasaki, Ikuo; Yamashita, Masayuki; Katsuma, Hideo; Nasako, Rieko; Kobayashi, Kazuhiro; Ogawa, Kazuo, Chemical and Pharmaceutical Bulletin, 1992, 40, 2681 - 2685. Hara, Kenji; Iwahashi, Keiji; Kanamori, Yoshikazu; Naito, Satoshi; Takakusagi, Satoru; Uosaki, Kohei; Sawamura, Masaya, Chemistry Letters, 2006, 35, 870 - 871.

Como disolvente se mencionan a modo de ejemplo: dietil éter, metil-terc-butil éter, tetrahidrofurano, dioxano.

Como agentes de litiación se mencionan a modo de ejemplo: *n*-butil-litio, di-isoproilamina de litio, terc-butilato de litio.

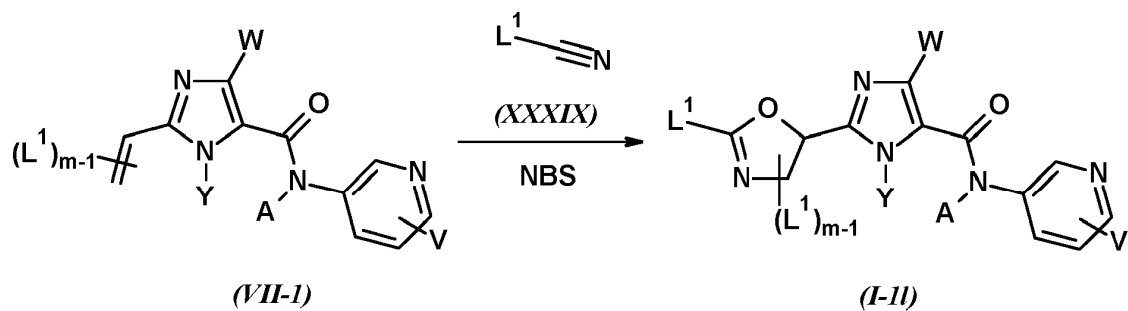
La temperatura de reacción se encuentra opcionalmente entre $-100\text{ }^\circ\text{C}$ y $-75\text{ }^\circ\text{C}$ para la etapa de litiación inicial.

- 10 Los ésteres de la fórmula (XXXV) necesarios son productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Los compuestos de la fórmula (I-1*k) pueden prepararse a partir de compuestos de la fórmula (XXXVI-1), por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en Asinger, F.; Schäfer, W.; Triem, H., Monatshefte für Chemie, 1966, 97, 1510 - 1522.

- 15 Los compuestos necesarios de la fórmula (XXXVIII) son productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Procedimiento L (cuando X representa U-17)²

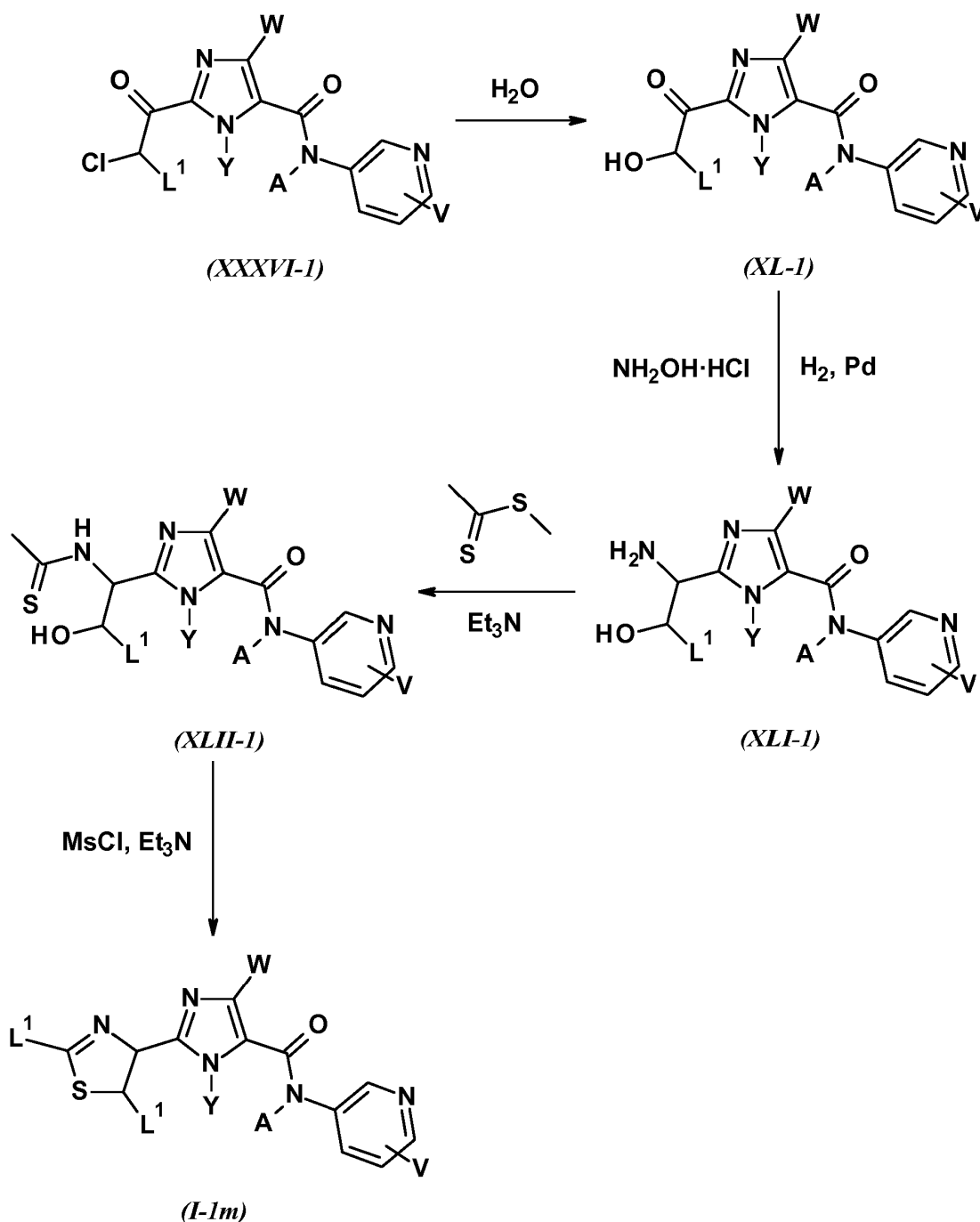


NBS = *N*-Bromosuccinimida

Los compuestos de la fórmula (I-1) se pueden preparar a partir de alquenos de la fórmula (VII-1), por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en Hajra, Säumen; Bar, Sukanta; Sinha, Debarshi; Maji, Biswajit, Journal of Organic Chemistry, 2008, 73, 4320 - 4322.

- 5 Los nitrilos de la fórmula (XXXIX) necesarios son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Procedimiento M (cuando X representa U-18)

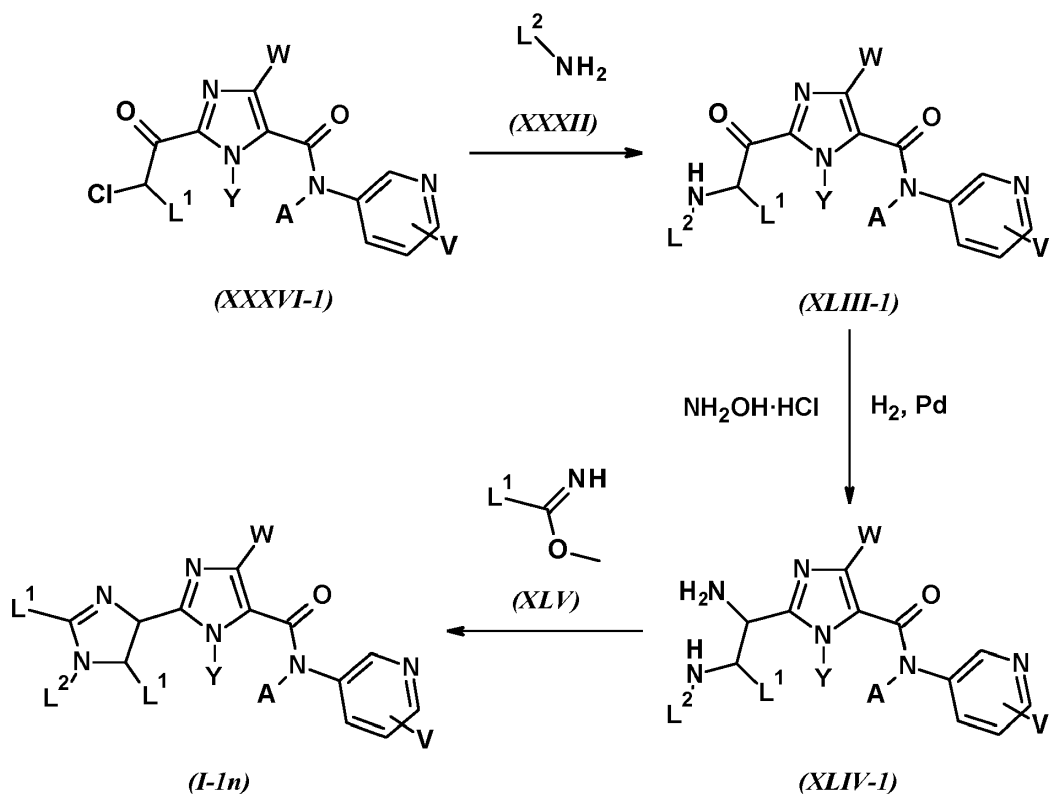


Los alcoholes de la fórmula (XL-1) se pueden preparar a partir de las cetonas de la fórmula (XXXVI-1), por ejemplo análogamente a los procedimientos descritos en Utsukihara, Takamitsu; Nakamura, Hiroaki; Watanabe, Masahige; Horiuchi, C. Akira, Tetrahedron Letters, 2006, 47, 9356 - 9364.

- 5 Los aminoalcoholes de la fórmula (XLI-1) se pueden preparar a partir de cetonas de la fórmula (XL-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en Pirkle, William H.; Simmons, Kirk A., Journal of Organic Chemistry, 1983, 48, 2520 - 2527.

10 Los compuestos de la fórmula (I-1m) se pueden preparar a partir de aminoalcoholes de la fórmula (XLI-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en Mercey, Guillaume; Brégeon, Delfine; Gaumont, Annie-Claude; Levillain, Jocelin; Gulea, Mihaela, Tetrahedron Letters, 2008, 49, 6553 - 6555.

Procedimiento N (cuando X representa U-19)



Los compuestos de la fórmula (XLIII-1) se pueden preparar a partir de cetonas de la fórmula (XXXVI-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en la patente de LONZA AG: WO 2008/077560 A1, 2008.

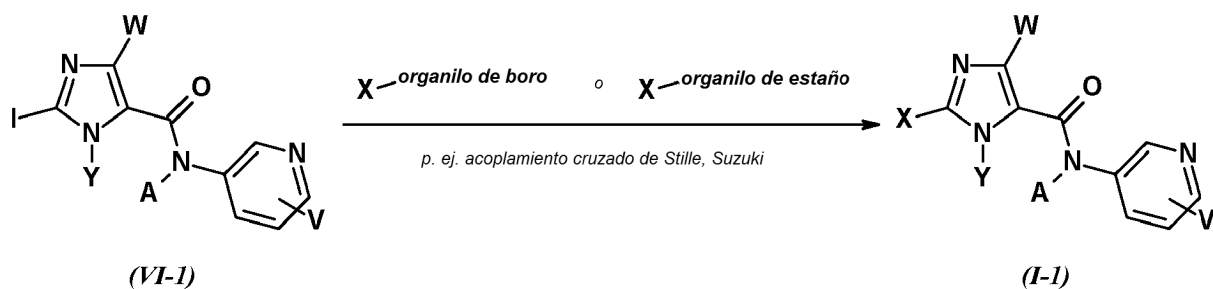
5 Las aminas de la fórmula (XXXII) necesarias son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica.

Las diaminas de la fórmula (XLIV-1) se pueden preparar a partir de las cetonas de la fórmula (XLIII-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en Dingess, Jurgen; Harris, Christopher M.; Wallace, Grier A.; Argiriadi, Maria A.; Queeney, Kara L.; Perron, Denise C.; Domínguez, Eric; Kebede, Tegest; Desino, Kelly E.; Patel, Hetal; Vasudevan, Anilo, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 2016, 26, 2297 - 2302.

10 Los compuestos de la fórmula (I-1n) se pueden preparar a partir de las diaminas de la fórmula (XLIV-1), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en Malcov, Andrei V.; Stewart-Liddon, Angus J. P.; McGeoch, Grant D.; Ramírez-López, Pedro; Kocovsky, Pavel, *Organic & Biomolecular Chemistry*, 2012, 10, 4864 - 4877.

15 Los compuestos de la fórmula (XLV) necesarios son productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica, por ejemplo, Ueno, Hiroaki; Maruyama, Akira; Miyake, Motoyoshi; Nakao, Etsuko; Nakao, Kenichiro; Umezumi, Kohei; Nitta, Issei, *Journal of Medicinal Chemistry*, 1991, 34, 2468 - 2473.

Procedimiento O



20 Los organilos metálicos necesarios (por ejemplo 4-(tributylestannil)furan-2(5H)-ona, etc.), así como los catalizadores necesarios son en gran parte productos comerciales o se pueden preparar según procedimientos conocidos en general en la química orgánica, por ejemplo, Clark, J. Stephen; Northall, John M.; Marlin, Frédéric; Nai, Bastien; Wilson, Claire; Blake, Alexander J.; Waring, Michael J., *Organic & Biomolecular Chemistry*, 2008, 6, 4012 - 4025.

Procedimientos y Usos

La invención se refiere también a un procedimiento para combatir plagas animales, en el que se dejan actuar compuestos de la fórmula (I) sobre plagas animales y/o su hábitat. Preferentemente el control de las plagas animales se lleva a cabo en agricultura y silvicultura, y en la protección de materiales. Esto excluye preferentemente procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se efectúan en el cuerpo humano o animal.

La invención se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) como pesticidas, en particular agentes fitoprotectores.

En el contexto de la presente solicitud, el término pesticida en cada caso también siempre abarca la expresión agente fitoprotector

Los compuestos de fórmula (I) son adecuados en el caso de una buena compatibilidad con las plantas, toxicidad para animales de sangre caliente favorable y buena compatibilidad ambiental para la protección de plantas y órganos de plantas frente a factores de estrés biótico y abiótico, para aumentar los rendimientos de las cosechas, mejorar la calidad del producto cosechado y para combatir plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, en particular nematodos y moluscos, que se presentan en la agricultura, en horticultura, en la cría de animales, en acuicultura, en bosques, en jardines e instalaciones de ocio, en la protección de productos almacenados y materiales así como en el sector de la higiene.

En el contexto de la presente solicitud de patente, el término "higiene" debe entenderse como cualesquiera y toda medida, disposición y modo de proceder que tenga como objetivo la prevención de enfermedades, especialmente enfermedades infecciosas, y que sirven para proteger la salud de los seres humanos y animales y/o proteger al medio ambiente y/o mantener la limpieza. De acuerdo con la invención, esto incluye especialmente medidas para la limpieza, desinfección y esterilización, por ejemplo de textiles o superficies duras, especialmente superficies hechas de vidrio, madera, cemento, porcelana, cerámica, plástico o de metal(es), a fin de asegurar que dichas superficies se encuentren libres de plagas de higiene y/o sus secreciones. El alcance de protección de la invención en este punto, preferentemente, excluye a los procedimientos de tratamientos quirúrgicos o terapéuticos a ser aplicados al cuerpo humano o a los cuerpos de animales, y procedimientos de diagnóstico que se llevan a cabo sobre el cuerpo humano o los cuerpos de animales.

El término "sector de la higiene" cubre todas las áreas, campos técnicos y aplicaciones industriales en donde estas medidas, disposiciones y procedimientos de higiene son importantes, por ejemplo con respecto a la higiene en cocinas, panaderías, aeropuertos, baños, piletas, hipermercados hoteles, hospitales, establos, áreas de mantenimiento de animales, etc.

El término "plaga de la higiene", por lo tanto, debe entenderse como una o más plagas animales cuya presencia en el sector de la higiene es problemática, especialmente por motivos de salud. Por consiguiente, un fin principal es el de evitar o limitar hasta un grado mínimo la presencia de plagas de la higiene y/o su exposición al sector de la higiene. Esto se puede lograr especialmente a través del uso de un pesticida que se puede utilizar tanto para la prevención de la infestación como para la prevención de una infestación existente. También es posible usar formulaciones que previenen o reducen la exposición a las plagas. Las plagas de la higiene incluyen, por ejemplo, los organismos mencionados más adelante.

El término "protección de la higiene" cubre por lo tanto todos los actos mediante los que se mantienen y/o mejoran estas medidas, disposiciones y procedimientos de higiene.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden utilizarse, preferentemente, como pesticidas. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo o estadios de desarrollo específicos. Entre las plagas mencionadas anteriormente figuran:

plagas del filo de los artrópodos, en particular de la clase de los arácnidos por ejemplo *Acarus* spp., por ejemplo *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., por ejemplo *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo *Eotetranychus hickoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., por ejemplo *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., por ejemplo *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., por ejemplo *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., por ejemplo *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*,

Tetranychus spp., por ejemplo *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

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

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

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

de la clase de los insectos, por ejemplo del orden de los blatodeos por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Loboptera decipiens*, *Neostylopyga rhombifolia*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

10 del orden de los coleópteros por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., por ejemplo *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*,
 15 *Cassida* spp., *Ceratomyza trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio caryae*,
 20 *Curculio caryatrides*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Diadrasa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcristata*, *Epitrix tuberosa*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychia arator*, *Heteronychia* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*,
 25 *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus (=Hyperodes)* spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., por ejemplo *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monoctonus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorynchus* spp., por ejemplo *Otiorynchus cribricollis*,
 30 *Otiorynchus ligustici*, *Otiorynchus ovatus*, *Otiorynchus rugosostriatus*, *Otiorynchus sulcatus*, *Oulema* spp., por ejemplo *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllorhiza* spp., *Phyllorhiza helleri*, *Phyllotreta* spp., por ejemplo *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., por ejemplo *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizophora dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., por ejemplo *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., por ejemplo *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., por ejemplo *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., por ejemplo *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., por ejemplo *Zabrus tenebrioides*;

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

del orden de los dípteros por ejemplo *Aedes* spp., por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., por ejemplo *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., por ejemplo *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., por ejemplo *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., por ejemplo *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., por ejemplo *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., por ejemplo *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., por ejemplo *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., por ejemplo *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnema* spp., *Euleia heraclei*, *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., por ejemplo *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*,
 55 *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., por ejemplo *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., por

ejemplo *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* o *Pegomyia* spp., por ejemplo *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophila casei*, *Platyparea poeciloptera*, *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., por ejemplo *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., por ejemplo *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., por ejemplo *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*, *Toxotrypana curvicauda*;

del orden de los hemípteros por ejemplo *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrata*, *Acyrtosiphon* spp., por ejemplo *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocairidara malayensis*, *Amrasca* spp., por ejemplo *Amrasca biguttula*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., por ejemplo *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., por ejemplo *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., por ejemplo *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastosylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Capulinia* spp., *Carnecephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cocomytilus halli*, *Coccus* spp., por ejemplo *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., por ejemplo *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., por ejemplo *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., por ejemplo *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Fiorinia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., por ejemplo *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., por ejemplo *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., por ejemplo *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., por ejemplo *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanai*, *Myzus* spp., por ejemplo *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephotettix* spp., por ejemplo *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., por ejemplo *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., por ejemplo *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivenae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp., por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., por ejemplo *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., por ejemplo *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., por ejemplo *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., por ejemplo *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pulvinaria* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., por ejemplo *Quadraspidiotus juglansregiae*, *Quadraspidiotus ostreaeformis*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., por ejemplo *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., por ejemplo *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sipha flava*, *Sitobion avenae*, *Sogatata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., por ejemplo *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialetrodes vaporariorum*, *Trioza* spp., por ejemplo *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

del suborden de los heterópteros por ejemplo *Aelia* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., por ejemplo *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., por ejemplo *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigmus*, *Euschistus variolarius*, *Eurydema* spp., *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptocoris varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., por ejemplo *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., por ejemplo *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Megacopta cribraria*, *Miridae*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., por ejemplo *Nezara viridula*, *Nysius* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., por ejemplo *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

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

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

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

del orden de los lepidópteros por ejemplo *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., por ejemplo *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., por ejemplo *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., por ejemplo *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., por ejemplo *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroplote* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., por ejemplo *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., *Chrysodeixis chalcites*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., por ejemplo *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diparopsis* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytoplopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., por ejemplo *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Erannis* spp., *Erschoviella musculana*, *Etiella* spp., *Eudocima* spp.,

Eulia spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., por ejemplo *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., por ejemplo *Grapholitha molesta*, *Grapholitha prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., por ejemplo *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., por ejemplo *Heliothis virescens*, *Hofmannophila pseudopretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Lampides* spp., *Laphygma* spp., *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., por ejemplo *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., por ejemplo *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., por ejemplo *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., por ejemplo *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omphisa* spp., *Operophtera* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., por ejemplo *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., por ejemplo *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., por ejemplo *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., por ejemplo *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., por ejemplo *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., por ejemplo *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia* nu, *Schoenobius* spp., por ejemplo *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., por ejemplo *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., por ejemplo *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., por ejemplo *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stenoma* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thaumetopoea* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., por ejemplo *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

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

del orden de los fitópteros por ejemplo *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

del orden de los psocópteros por ejemplo *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

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

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

del orden de los zigentomos (= tisanuros), por ejemplo *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

de la clase de los sínfilos por ejemplo *Scutigereilla* spp., por ejemplo *Scutigereilla immaculata*;

plagas del filo de los moluscos, por ejemplo de la clase de los bivalvos, por ejemplo *Dreissena* spp.;

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

10 plagas vegetales del filo de los nematodos, es decir nematodos parasitarios de plantas, en particular *Aglenchus* spp., por ejemplo *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., por ejemplo *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., por ejemplo *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., por ejemplo *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., por ejemplo *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., por ejemplo *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., por ejemplo *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., por ejemplo *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., por ejemplo *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., por ejemplo *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., por ejemplo *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora* spp., *Heterodera* spp., por ejemplo *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hirschmaniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., por ejemplo *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., por ejemplo *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paralongidorus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., por ejemplo *Paratrichodorus minor*, *Paratylenchus* spp., *Pratylenchus* spp., por ejemplo *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., por ejemplo *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., por ejemplo *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., por ejemplo *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., por ejemplo *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., por ejemplo *Xiphinema index*.

30 Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse dado el caso en determinadas concentraciones o cantidades de aplicación también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (inclusive agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo de tipo micoplasma) y RLO (organismo de tipo Rickettsia). Pueden emplearse dado el caso también como productos intermedios o previos para la síntesis de otros principios activos.

Formulaciones

35 La presente invención se refiere además a formulaciones y formas de aplicación preparadas a partir de las mismas como pesticidas tales como por ejemplo caldos para empapado, inmersión y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de fórmula (I). Dado el caso las formas de aplicación contienen otros pesticidas y/o adyuvantes que mejoran el efecto tales como promotores de la penetración, por ejemplo aceites vegetales tales como por ejemplo aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales tales como por ejemplo aceites de parafina, ésteres alquílicos de ácidos grasos vegetales tales como por ejemplo éster metílico de aceite de colza o aceite de soja o alcoxilatos de alcanol y/o agentes de esparcimiento tales como por ejemplo alquilsiloxanos y/o sales por ejemplo sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas tales como por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio y/o agentes que promueven la retención tales como por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropilguar y/o humectantes tales como por ejemplo glicerol y/o fertilizantes tales como por ejemplo fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

50 Formulaciones habituales son por ejemplo líquidos solubles en agua (SL), concentrados en emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), granulados dispersables en agua (WG), granulados (GR) y concentrados encapsulados (CS); estos y otros posibles tipos de formulación se describen por ejemplo por Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173, preparado por la FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Dado el caso, las formulaciones contienen, junto a uno o varios compuestos de fórmula (I), otros principios activos agroquímicos.

55 Preferentemente se trata de formulaciones o formas de aplicación, que contienen agentes auxiliares tales como por ejemplo extensores, disolventes, promotores de la espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, anticongelantes, biocidas, espesantes y/u otros agentes auxiliares tales como por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora la acción biológica de la formulación, sin que el componente en sí tenga una acción biológica. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, el comportamiento de extensión, la adherencia a la superficie de las hojas o la penetración.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo mediante mezclado de los compuestos de fórmula (I) con agentes auxiliares tales como por ejemplo extensores, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otros agentes auxiliares tales como por ejemplo sustancias tensioactivas. La preparación de las formulaciones tiene lugar o bien en instalaciones adecuadas o también antes o durante la aplicación.

- 5 Como agentes auxiliares pueden emplearse aquellas sustancias que son adecuadas para conferir a la formulación de los compuestos de fórmula (I) o a las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones (tal como por ejemplo pesticidas útiles tales como caldos de pulverización o productos de recubrimiento de semillas) propiedades especiales, tales como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas.

10 Como extensores son adecuados por ejemplo agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que dado el caso también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), de las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli-)éteres, de las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, de las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

15 En el caso del uso de agua como extensor pueden usarse por ejemplo también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol
20 así como sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido así como agua.

En principio pueden usarse todos los disolventes adecuados. Disolventes adecuados son por ejemplo hidrocarburos aromáticos tales como por ejemplo xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos clorados aromáticos o clorados alifáticos tales como por ejemplo clorobenceno, cloroetileno, o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como por ejemplo ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como por ejemplo metanol, etanol, iso-propanol, butanol o glicol así como sus éteres y ésteres, cetonas tales como por ejemplo acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilsulfóxido así como agua.

En principio pueden emplearse todos los vehículos adecuados. Como vehículos se tienen en cuenta en particular:
30 por ejemplo sales de amonio y harinas de roca naturales tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y harina de roca sintética, tales como ácido silícico altamente dispersado, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Mezclas de vehículos de este tipo pueden usarse asimismo. Como vehículos para granulados se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales quebradas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita así como
35 granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de material orgánico tales como serrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

También pueden emplearse extensores gaseosos licuados o disolventes. En particular son adecuados aquellos extensores o vehículos, que son gaseosos a temperatura normal y a presión normal, por ejemplo gases propelentes de aerosol tales como hidrocarburos halogenados así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

40 Ejemplos de agentes que generan emulsión y/o espuma, dispersantes o humectantes con propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estas sustancias tensioactivas son sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquifenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (preferentemente alquiltauratos), ésteres de ácido fosfórico
45 de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácido graso de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilarilpoliglicol éteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, lejjas sulfúricas de lignina de desecho y metilcelulosa. La presencia de una sustancia tensioactiva es ventajosa cuando uno de los compuestos de fórmula (I) y/o uno de los vehículos inertes no es soluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua.

50 Como agentes auxiliares adicionales pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrociano y colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, azo y ftalocianina de metal y nutrientes y oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Además, pueden estar contenidos estabilizadores tales como estabilizadores frente al frío, agentes conservantes,
55 antioxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Además, pueden estar contenidos agentes espumantes o antiespumantes.

Asimismo, las formulaciones y formas de aplicación derivadas de las mismas pueden contener como sustancias auxiliares adicionales también agentes adherentes tales como carboximetilcelulosa, polímeros pulverulentos,

granulosos o en forma de látex, naturales y sintéticos tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo) así como fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otras sustancias auxiliares pueden ser aceites minerales y vegetales.

5 Dado el caso pueden estar contenidas aún otras sustancias auxiliares en las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas. Tales aditivos son por ejemplo sustancias aromáticas, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, sustancias tixotrópicas, promotores de la penetración, promotores de la retención, estabilizadores, secuestrantes, agentes complejantes, humectantes, agentes de esparcimiento. En general, los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido, que se usa habitualmente para fines de formulación.

10 Como promotores de la retención se tienen en cuenta todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica tales como por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o aumentan la viscoelasticidad tales como por ejemplo polímeros de hidroxipropil-guar.

15 Como promotores de la penetración se tienen en cuenta en el presente contexto todas aquellas sustancias que se emplean habitualmente para mejorar la introducción de principios activos agroquímicos en las plantas. Los promotores de la penetración se definen en este contexto porque pueden introducirse en la cutícula de las plantas a partir del caldo de aplicación (por regla general acuoso) y/o a partir del producto de recubrimiento de pulverización y con ello pueden aumentar la movilidad de los principios activos en la cutícula. El método descrito en la bibliografía (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede emplearse para la determinación de esta propiedad. A modo de ejemplo se mencionan alcoxilatos de alcohol tales como por ejemplo etoxilato de grasa de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso tales como por ejemplo éster metílico de aceite de colza o de aceite de soja, alcoxilatos de amina graso tales como por ejemplo etoxilato de seboamina (15) o sales de amonio y/o fosfonio tales como por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio.

20 Las formulaciones contienen preferentemente entre el 0,00000001 y el 98 % en peso del compuesto de fórmula (I), de manera especialmente preferente entre el 0,01 y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I), de manera muy especialmente preferente entre 0,5 y 90 % en peso del compuesto de fórmula (I), con respecto al peso de la formulación.

25 El contenido en el compuesto de fórmula (I) en las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones (en particular pesticidas) puede variar en amplios intervalos. La concentración del compuesto de fórmula (I) en las formas de aplicación puede encontrarse habitualmente entre el 0,00000001 y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I), preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso, con respecto al peso de la forma de aplicación. La aplicación se efectúa de manera habitual adaptada a una de las formas de aplicación.

Mezclas

35 Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse también en mezcla con uno o varios fungicidas adecuados, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, agentes microbiológicos, insectos útiles, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de plantas, para ampliar así por ejemplo el espectro de acción, prologar la duración efectiva, aumentar la velocidad activa, impedir la repelencia o prevenir desarrollos de resistencias. Además, tales combinaciones de principios activos pueden mejorar el crecimiento de las plantas y/o la tolerancia frente a factores abióticos tales como por ejemplo temperaturas altas o bajas, frente a la sequedad o frente a un contenido en sal elevado en el agua o la tierra. También puede mejorarse el comportamiento de floración y crecimiento del fruto, optimizar la capacidad de germinación y enraizamiento, facilitar la cosecha y aumentar los rendimientos de la cosecha, influir en la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutricional de los productos de la cosecha, prolongar la estabilidad en almacén y/o mejorar la procesabilidad de los productos de la cosecha.

45 Además, los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse en mezcla con otros principios activos o semioquímicos, tales como sustancias atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores vegetales y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Igualmente, los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse en mezclas con agentes para mejorar las propiedades de las plantas tales como por ejemplo crecimiento, rendimiento y calidad del material de cosecha.

50 En una forma de realización de acuerdo con la invención particular, los compuestos de fórmula (I) se encuentran en formulaciones o en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos que se describen anteriormente.

Cuando uno de los compuestos mencionados a continuación puede encontrarse en distintas formas tautoméricas, puede estar abarcadas también estas formas, aunque estas no se mencionen explícitamente en cada uno de los casos. Todos los componentes de mezcla mencionados, cuando debido a sus grupos funcionales tengan la capacidad, forman dado el caso sales con bases o ácidos adecuados.

55 **Insecticidas/acaricidas/nematocidas**

Los principios activos denominados con su "nombre común" son conocidos y se describen por ejemplo en el manual de pesticidas ("The Pesticide Manual" 16ª Ed., British Crop Protection Council 2012) o pueden encontrarse en internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>). La clasificación se basa en el Esquema de Clasificación de Modos de Acción de IRAC aplicable en el momento de la presentación de esta solicitud de patente.

- 5 (1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), tales como por ejemplo carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofurano, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, xmc y xililcarb u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametipós, azinfón-etilo, azinfón-metilo, cadusafós, cloretoxifós, clorofenvinfós, clormefós, clorpirifós-metilo, cumafós, cianofós, demetón-S-metilo, diazinona, diclorvós/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, disulfoton, EPN, etiona, etoprofós, Famphur, fenamifós, fenitrotiona, fentiona, fostiazato, feptenofós, imiciafós, isofenfós, O-(metoxiaminotio-fosforil) salicilato de isopropilo, isoxationa, malatión, mecarbam, metamidofós, metidation, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemetonmetilo, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifós-metilo, profenofós, propetanfós, protiofós, piraclófós, piridafentiona, quinalfós, sulfotep, tebupirinfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometon, triazofós, triclofon y vamidotona.
- 10 (2) Bloqueadores de los canales de cloruro controlados por GABA, tales como por ejemplo ciclodieno-organocloro, por ejemplo clordano y endosulfán o fenilpirazol (fiprol), por ejemplo etiprol y fipronil.
- (3) Moduladores de los canales de sodio, tales como por ejemplo piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina isómero de S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómero (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, cadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómero (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.
- 20 (4) Moduladores competitivos del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), tales como por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefurán, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- 25 (5) Moduladores alostéricos del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), tales como por ejemplo espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.
- (6) Moduladores alostéricos del canal de cloruro dependiente de glutamato (GluCl), tales como por ejemplo avermectina/milbemicina, por ejemplo abamectina, emamectina-benzoato, lepimectina y milbemectina.
- (7) Miméticos de hormonas juveniles, tales como por ejemplo análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, quinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.
- 35 (8) Distintos inhibidores no específicos (multisitio), tales como por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o emético tartárico o generador de isocianato de metilo, por ejemplo diazomet y metam.
- (9) Moduladores de los órganos cordotonaes, por ejemplo pimetrozina o flonicamida.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.
- 40 (11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insecto, tales como por ejemplo *Bacillus thuringiensis* Subespecies israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* Subespecies aizawai, *Bacillus thuringiensis* Subespecies kurstaki, *Bacillus thuringiensis* Subespecies tenebrionis y proteínas vegetales de B.t.: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.
- (12) Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, tales como disruptores de ATP, tales como por ejemplo diafentiurón o compuestos de organoestaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina y fenbutatin-óxido o propargita o tetradifón.
- 45 (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante alteración del gradiente de protones, tales como por ejemplo clorofenapir, DNOC y sulfluramida.
- (14) Bloqueadores de los canales del receptor nicotínico de la acetilcolina, tales como por ejemplo bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam, y tiosultap-sodio.
- 50 (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, (15) Inhibidores de la síntesis de quitina, tipo 0, tales como por ejemplo bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón y triflumurón.
- (16) Inhibidores de la síntesis de quitina, tipo 1, tales como por ejemplo buprofezina.

- (17) Disruptores de la ecdisis (en particular en dípteros, es decir Diptera), tales como por ejemplo ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de la ecdisona, tales como por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas del receptor de octopamina, tales como por ejemplo amitraz.
- 5 (20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo microcondrial III, tales como por ejemplo hidrametilnon o acequinocil o fluacripirim.
- (21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo I mitocondrial, tales como por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- 10 (22) Bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje, tales como por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.
- (23) Inhibidores de acetil CoA carboxilasa, tales como por ejemplo derivados de ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV mitocondrial, tales como por ejemplo fosfinas, por ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc, o cianuros, cianuro de calcio, cianuro de potasio y cianuro de sodio.
- 15 (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, tales como por ejemplo derivados de beta-ceto nitrilo, por ejemplo cienopirafeno y ciflumetofeno y carboxanilidas, tales como por ejemplo piflubumida.
- (28) Moduladores del receptor de rianodina, tales como por ejemplo diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida,
- 20 otros principios activos, por ejemplo afidopiropen, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, broflanilida, bromopropilato, quinometionato, cloropraetrina, criolita, ciclaniliprol, ciclozaprid, cihalodiamida, dicloromezotiaz, dicofol, épsilon metoflutrina, épsilon momflutrina, flometoquina, fluazaindolicina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fluxametamida, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidaclotiz, iprodiona, kappa bifentrina, kappa teflutrina, lotilaner, meperflutrina, paichongding, piridalil, pirifluquinazon, piriminostrobina, espirobudiclofen, tetrametilflutrina, traniliprol, tetraclorantraniliprol, tiozazafen, tiofluoximato, triflumezopirim y yodometano; adicionalmente preparaciones basadas en *Bacillus firmus* (1-1582, BioNeem, Votivo), y los siguientes compuestos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida por el documento WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidina]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida por el documento WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida por el documento WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), etilcarbonato de 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo (conocida por el documento EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida por el documento WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido por el documento JP2010/018586) (CAS Reg.No. 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-ilideno]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocida por el documento WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridilideno]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (conocida por el documento WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida (conocida por el documento CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-óxido-3-tietanil)benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(trans-1-óxido-3-tietanil)benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-óxido-3-tietanil)benzamida (conocida por el documento WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfonil]propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfonil]propanamida y (-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfonil]propanamida (conocida por el documento WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[[(2E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (conocido por el documento CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tiioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida, (Liudaibenjiaxuanan, conocido por el documento CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[[[(1,1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxi]fenoxi]propoxi]-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida por el documento CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- y 2(Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]hidrazinacboxamida (conocida por el documento CN

101715774 A) (CAS 1232543-85-9); éster 3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetil-4-(1H-benzimidazol-2-il)fenílico del ácido ciclopropanocarboxílico (conocido por el documento CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); éster metílico del ácido (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[[(metoxicarbonil)4-[(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazina-4a(3H)-carboxílico (conocido por el documento CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-desoxi-3-O-etil-2,4-di-O-metil-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamatol]- α -L-manopiranosol (conocida por el documento US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-sin)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (conocido por el documento WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8) y N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)tio]propanamida (conocida por el documento WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9).

Fungicidas

Los principios activos especificados en la presente invención por su nombre común son conocidos y se hallan descritos, por ejemplo, en "Pesticide Manual" (Ed. número 16 British Crop Protection Council) o se pueden buscar en la Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Todos los componentes de mezcla mencionados en las clases (1) a (15), según sea el caso, pueden formar sales con bases o ácidos adecuados si son capaces de hacerlo sobre la base de sus grupos funcionales. Todos los componentes de mezcla fungicidas mencionados en las clases (1) a (15), según sea el caso, pueden incluir las formas tautoméricas.

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.001) ciproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamida, (1.005) fenpropidina, (1.006) fenpropimorf, (1.007) fenpirazamina, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) sulfato de imazalil, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) miclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) procloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) prothioconazol, (1.019) pirisoxazol, (1.020) spiroxamina, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorf, (1.025) triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (1.029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il]piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il]piridin-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il]piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-((2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-((2S,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il)metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) tiocianato de 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.040) tiocianato de 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.041) tiocianato de 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.050) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.056) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.057) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.058) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.060) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.064) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.065) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.066) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(pentafluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.067) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(1,1,2,2-

- tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.068) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.069) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.070) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.072) N'-(4-{3-[(difluorometoxi)fenil]sulfanil}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.073) N'-(4-{3-[(difluorometil)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.075) N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.076) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.077) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.078) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.079) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.080) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoforamida.
- 2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.001) benzovindiflupir, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopiram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxapiroxad, (2.008) furametpir, (2.009) isofetamid, (2.010) isopirazam (enantiómero antiepipimérico 1R,4S,9S), (2.011) isopirazam (enantiómero antiepipimérico 1S,4R,9R), (2.012) isopirazam (racemato antiepipimérico 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopirazam (mezcla del racemato sinépimérico 1RS,4SR,9RS y el racemato antiepipimérico 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopirazam (enantiómero sinépimérico 1R,4S,9R), (2.015) isopirazam (enantiómero sinépimérico 1S,4R,9S), (2.016) isopirazam (racemato sinépimérico 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) pentipirad, (2.019) pidiflumetofen, (2.020) piraziflumid, (2.021) sedaxano, (2.022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.024) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.026) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2.027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.030) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.031) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.032) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil]etil]quinazolin-4-amina, (2.034) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.035) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.036) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.037) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.038) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.
- 3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.001) ametocradina, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxistrobina, (3.004) coumetoxistrobina, (3.005) coumoxistrobina, (3.006) ciazofamida, (3.007) dimoxistrobina, (3.008) enoxastrobina, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxistrobina, (3.012) fluoxastrobina, (3.013) kresoxim-metilo, (3.014) metominostrobrina, (3.015) orisastrobina, (3.016) picoxistrobina, (3.017) piraclostrobina, (3.018) pirametostrobina, (3.019) piraxistrobina, (3.020) trifloxistrobina (3.021) (2E)-2-[[[1E]-1-(3-[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi}fenil)etilideno]amino]oxi]metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.025) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-

metoxipiridin-2-il}carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo, (3.026) 2-[2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.027) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.028) (2E,3Z)-5-[[1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.

4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4.001) carbendazim, (4.002) dietofencarb, (4.003) etaboxam, (4.004) fluopicolida, (4.005) pencicuron, (4.006) tiabendazol, (4.007) tiofanato-metilo, (4.008) zoxamida, (4.009) 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4.011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.014) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.015) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.018) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.022) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (4.023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.

5) Compuestos que tienen capacidad para actividad multisitio, por ejemplo (5.001) mezcla de Bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) clorotalonil, (5.005) hidróxido de cobre, (5.006) naftenato de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxiclورو de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) ditionon, (5.011) dodina, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) zinc metiram, (5.017) oxina de cobre, (5.018) propineb, (5.019) azufre y preparaciones de azufre que incluye polisulfuro de calcio, (5.020) tiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram.

6) Compuestos capaces de activar la defensa del huésped, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-metilo, (6.002) isotianilo, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinilo.

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

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

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

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

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

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

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

14) Compuestos que pueden actuar como desacopladores, por ejemplo (14.001) fluazinam, (14.002) meptildinocap.

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

1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.037) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.038) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.041) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.042) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.043) 2-[3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.044) 2-[3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenil metanosulfonato, (15.045) 2-fenilfenol y sus sales, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.047) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butírico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 2-sulfonohidrazida de 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilene]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de but-3-in-1-ilo, (15.056) (Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.057) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.058) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.061) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de terc-butilo.

Pesticidas biológicos como componentes de mezcla

Los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con pesticidas biológicos.

Los pesticidas biológicos abarcan en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos vegetales, y productos de este tipo, que se formaron por microorganismos inclusive proteínas y productos metabólicos secundarios.

Los pesticidas biológicos abarcan bacterias tales como bacterias esporógenas, bacterias que colonizan las raíces y bacterias que actúan como isecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Ejemplos de bacterias de este tipo, que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

Bacillus amiloliquefaciens, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de registro de CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular cepa GB34 (n.º de registro ATCC 700814) y cepa QST2808 (n.º de registro NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular cepa GB03 (n.º de registro ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (n.º de registro NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (n.º de registro NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecies *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (n.º de registro ATCC 1276), o *B. thuringiensis subsp. aizawai*, en particular cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis subsp. kurstaki* cepa HD-1, o *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (nematodo *Rotylenchulus reniformis*)-PR³ (número de registro ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (número de registro NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levaduras, que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

Beauveria bassiana, en particular cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, en particular cepa CON/M/91-8 (n.º de registro DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, en particular cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (antes conocido como *Verticillium lecanii*), en particular cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (neu: *Isaria fumosorosea*), en particular cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (número de registro ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en particular cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, en particular cepa SC₁ (número de registro CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, en particular *T. harzianum rifai* T39. (número de registro CNCM 1-952).

Ejemplos de virus que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

Adoxophyes orana (gusano de la piel de manzana) granulovirus (GV), *Cydia pomonella* (gusano de la manzana) granulovirus (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano de la cápsula del algodón) virus de la polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano soldado) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (cogollero) mNPV, *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra africana) NPV.

Están abarcadas también bacterias y hongos, que se agregan como plantas o partes de plantas u órganos de plantas "inoculantes" y mediante sus propiedades especiales promueven el crecimiento de las plantas y la salud de las plantas. Como ejemplos se mencionan:

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

Ejemplos de extractos vegetales y productos de este tipo, que se formaron por microorganismos inclusive proteínas y productos metabólicos secundarios, que se emplean o pueden usarse como pesticidas biológicos, son:

5 Allium sativum, Artemisia absinthium, azadiractina, Biokeeper WP, Cassia nigricans, Celastrus angulatus, Chenopodium anthelminticum, quitina, Armour-Zen, Dryopteris filix-mas, Equisetum arvense, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (Chenopodium quinoa-extracto de saponina), piretro/piretrina, Quassia amara, Quercus, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, Ryania/Ryanodine, Symphytum officinale, Tanacetum vulgare, timol, Triact 70, TriCon, Tropaeolum majus, Urtica dioica, veratrin, Viscum album, extracto de Brassicaceae, en particular polvo de colza o mostaza.

Protectores como componentes de mezcla

10 Los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con protectores, tales como por ejemplo benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinil, ciprosulfamida, diclormid, fenclorazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo), mefenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinil, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

15 **Plantas y partes de plantas**

De acuerdo con la invención, pueden tratarse todas las plantas y partes de plantas. Por plantas se entienden en este sentido todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas salvajes o plantas de cultivo deseadas e indeseadas (inclusive plantas de cultivo que aparecen de manera natural), por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, pimiento, pepinos, melones, zanahorias, sandías, cebollas, lechuga, espinacas, puerro, judías *Brassica oleracea* (por ejemplo col) y otras especies de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse por procedimientos convencionales de fitogenética y de optimización o por procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que se pueden proteger o que no se pueden proteger por derechos de obtención vegetal. Por plantas se entenderán todos los estadios de desarrollo, plantas jóvenes (no maduras) hasta plantas maduras. Por partes de plantas deberían entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, como brote, hoja, flor y raíz, exponiéndose a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y simientes así como raíces, bulbos y rizomas. A las partes de plantas también pertenecen plantas recogidas o partes de plantas recogidas así como material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y simientes.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de fórmula (I') tiene lugar directamente o por acción sobre el entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, rociado, en particular en el caso de las semillas, además por envolturas simples o multicapa.

Tal como ya se ha mencionado, de acuerdo con la invención, pueden tratarse todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente, se tratan tipos de plantas y variedades de plantas silvestres u obtenidas por procedimientos fitogenéticos biológicos convencionales, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En otra forma de realización preferente, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido por procedimientos de ingeniería genética, dado el caso, en combinación con procedimientos convencionales (*Genetically Modified Organisms*, organismos modificados genéticamente) y sus partes. El término "partes" o "partes de las plantas" o "partes de plantas" se ha explicado anteriormente. De manera especialmente preferente, de acuerdo con la invención, se tratan plantas de las variedades de plantas en cada caso comercialmente disponibles o en uso. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("rasgos"), que se han obtenido tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinantes. Estos pueden ser variedades, razas, biotipos y genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de las semillas y acontecimientos de integración

A las plantas o variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) preferentes que se van a tratar de acuerdo con la invención pertenecen todas las plantas que han obtenido material genético por la modificación de ingeniería genética, que otorga a estas plantas propiedades ("rasgos") valiosas especialmente ventajosas. Ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento de la planta, tolerancia aumentada con respecto a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequía o frente a salinidad en el agua o en el suelo, mayor rendimiento de floración, simplificación de la cosecha, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mejor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de la cosecha. Otros ejemplos, y especialmente destacados, de tales propiedades son una capacidad de defensa aumentada de las plantas contra parásitos animales y microbianos, tales como insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, caracoles, provocada por ejemplo por toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus

combinaciones) en las plantas, asimismo una capacidad de defensa elevada de las plantas contra hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, provocada por ejemplo por resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitors así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de manera correspondiente, así como una tolerancia aumentada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonil-ureas, glifosatos o fosfotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que otorgan respectivamente las propiedades ("rasgos") deseadas también pueden presentarse en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de plantas transgénicas se mencionan las importantes plantas de cultivo, como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, guisantes y otras especies de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), destacándose especialmente maíz, soja, trigo, arroz, patata, algodón, caña de azúcar, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos") se destacan especialmente la capacidad de defensa elevada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

Protección de plantas - tipos de tratamiento

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de fórmula (I) tiene lugar directamente o por acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, rociado, pulverización, riego, evaporación, atomización, nebulización, esparcimiento, espumación, propagación, extendido, inyección, vertido (empapado), riego por goteo y, en el caso del material de propagación, en particular en el caso de las semillas, además mediante aplicación como recubrimiento en seco, desinfección en mojado, desinfección en suspensión, incrustación, envoltura de una capa o múltiples capas, etc. Asimismo es posible esparcir los compuestos de fórmula (I) según el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar la forma de aplicación o el compuesto de fórmula (I) en sí en la tierra.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación en las hojas, es decir los compuestos de fórmula (I) se aplican sobre el follaje, debiendo adaptarse la frecuencia de tratamiento y la cantidad de aplicación a la infestación de la plaga respectiva.

En el caso de principios activos que actúan de manera sistémica, los compuestos de fórmula (I) llegan a las plantas también a través de las raíces. El tratamiento de las plantas tiene lugar entonces mediante la acción de los compuestos de fórmula (I) sobre el hábitat de la planta. Esto puede ser por ejemplo mediante empapado, mezclado en la tierra o la solución nutriente, es decir la ubicación de la planta (por ejemplo el suelo o sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de fórmula (I), o mediante la aplicación en la tierra, es decir los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se introducen en forma sólida, (por ejemplo en forma de un granulado) en la ubicación de las plantas. En el caso de cultivos de arrozales, esto puede ser también mediante dosificación del compuesto de fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo como granulado) en un campo de arroz inundado.

Tratamiento de semillas

Combatir plagas animales mediante el tratamiento de las semillas de plantas se conoce desde hace mucho tiempo y es objeto de mejoras continuas. No obstante, en el caso del tratamiento de semillas, se produce una serie de problemas que no siempre pueden resolverse satisfactoriamente. Así, es deseable desarrollar procedimientos para proteger las semillas y la planta en germinación que hagan superflua o al menos reduzcan considerablemente la aplicación adicional de pesticidas en el almacenamiento, tras la siembra o tras la emergencia de las plantas.

Además, es deseable optimizar la cantidad del principio activo empleado para que la semilla y la planta en germinación se protejan lo mejor posible frente al ataque por plagas animales, pero sin dañar la propia planta por el principio activo utilizado. En particular, procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían incluir las propiedades insecticidas o nematocidas intrínsecas de plantas transgénicas tolerantes o resistentes a plagas para conseguir una protección óptima de la semilla y de las plantas en germinación con un gasto mínimo de pesticidas.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere en particular a un procedimiento para proteger semillas y plantas en germinación antes del ataque de plagas, tratándose la semilla con uno de los compuestos de fórmula (I). El procedimiento de acuerdo con la invención para la protección de semillas y plantas en germinación frente al ataque de plagas comprende asimismo un procedimiento, en el que la semilla se trata simultáneamente en un proceso o secuencialmente con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla. Este comprende asimismo también un procedimiento en el que la semilla se trata en diferentes tiempos con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla.

Asimismo, la invención se refiere al uso de los compuestos de fórmula (I) para el tratamiento de semillas para la protección de la semilla y de la planta que se genera a partir de la misma frente a plagas animales.

Además, la invención se refiere a la semilla que se trató para la protección frente a plagas animales con un compuesto de fórmula (I). La invención se refiere también a semillas que se trataron al mismo tiempo con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla. La invención se refiere además a semillas que se trataron en diferentes tiempos con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla. En el caso de semillas que se trataron en diferentes tiempos con un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla, las sustancias individuales pueden

estar presentes en diferentes capas sobre la semilla. A este respecto, las capas que contienen un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla, puede estar separadas dado el caso por una capa intermedia. La invención se refiere también a semillas en las que un compuesto de fórmula (I) y componente de mezcla están aplicados como constituyente de una envoltura o como capa adicional o capas adicionales además de una envoltura.

- 5 Además, la invención se refiere a semillas que después de tratamiento con un compuesto de fórmula (I) se someten a un procedimiento de filmcoating (recubrimiento con película), para impedir el desgaste por polvo en las semillas.

Una de las ventajas que se presentan cuando actúa de manera sistémica uno compuesto de fórmula (I), es que el tratamiento de la semilla no protege solamente a la semilla en sí, sino también las plantas que resultan de la misma después de la emergencia frente a plagas animales. De esta manera, el tratamiento inmediato del cultivo puede suprimirse en el momento de la siembra o poco después.

10 Otra ventaja se basa en que mediante el tratamiento de las semillas con un compuesto de fórmula (I) pueden promoverse la germinación y emergencia de la semilla tratada.

Del mismo modo, resulta ventajoso considerar que los compuestos de fórmula (I) también pueden emplearse en particular en semillas transgénicas.

- 15 Los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse asimismo en combinación con agentes de la tecnología de señalización, mediante lo cual tiene lugar una mejor colonización con simbioses, tales como por ejemplo rizobios, micorrizas y/o bacterias u hongos endoparasitarios, y/o se produce una fijación de nitrógeno optimizada.

Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de plantas, que se emplean en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en jardinería. A este respecto, se trata en particular de semillas de cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, café, tabaco, canola, colza, remolacha (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, verduras (por ejemplo tomate, pepino, judía, coles, cebolla y lechuga), plantas frutales, céspedes y plantas ornamentales. Se da especial importancia al tratamiento de la semilla de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza, verduras y arroz.

20 Tal como ya se ha mencionado anteriormente, tiene una particular importancia también el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de fórmula (I). A este respecto, en el caso de las semillas se trata de plantas que por regla general contienen al menos un gen heterólogo, que controla la expresión de un polipéptido con en particular propiedades insecticidas o nematocidas. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden proceder a este respecto de microorganismos tales como Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. La presente invención es adecuada especialmente para el tratamiento de semillas transgénicas, que contienen al menos un gen heterólogo, que procede de Bacillus sp. De manera especialmente preferente se trata a este respecto de un gen heterólogo, que procede de Bacillus thuringiensis.

En el contexto de la presente invención, el compuesto de fórmula (I) se aplica sobre las semillas. Preferentemente, la semilla se trata en un estado en el que es tan estable que no aparece ningún daño durante el tratamiento. Generalmente, el tratamiento de la semilla puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Habitualmente, se usan semillas que se habían separado de la planta y se habían liberado de espádice, vaina, tallos, envueltas, lana o carne de fruto. Así, por ejemplo, pueden usarse semillas que se han cosechado, limpiado y secado hasta un contenido en humedad almacenable. Como alternativa, también se pueden usar semillas que después del secado se han tratado, por ejemplo, con agua y después se han vuelto a secar, por ejemplo imprimación. En el caso de material de semilla de arroz es también posible usar semillas que se empaparon, por ejemplo en agua hasta un estadio determinado del embrión de arroz ("estadio de pecho de paloma"), mediante lo cual se estimula la germinación y la emergencia más uniforme.

35 Generalmente, durante el tratamiento de la semilla tiene que tenerse en cuenta que la cantidad del compuesto de fórmula (I) y/u otros aditivos aplicados sobre la semilla se seleccione de manera que no se perjudique la germinación de la semilla o no se dañe la planta que surge de la misma. Esto tiene que tenerse en cuenta, sobre todo, en el caso de principios activos que pueden mostrar efectos fitotóxicos en determinadas dosis de aplicación.

Los compuestos de fórmula (I) se aplican por regla general en forma de una formulación adecuada sobre las semillas. Formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas son conocidos por el experto en la materia.

- 50 Los compuestos de fórmula (I) pueden transferirse a las formulaciones de desinfectante habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas o masas de envoltura para semillas, así como formulaciones de ULV.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, mezclándose los compuestos de fórmula (I) con aditivos habituales, tales como por ejemplo extensores habituales así como disolventes o diluyentes, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, agentes conservantes, espesantes secundarios, pegamentos, giberelinas y también agua.

55

Como colorantes que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los colorantes habituales para tales fines. A este respecto pueden usarse tanto polímeros poco solubles en agua como colorantes solubles en agua. Como ejemplos se mencionan los colorantes conocidos con las denominaciones Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

- 5 Como humectantes que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todas las sustancias que promueven la humectación, habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente pueden usarse sulfonatos de alquilnaftaleno, tales como sulfonatos de diisopropil- o diisobutil-naftaleno.

- 10 Como dispersantes y/o emulsionantes, que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Pueden usarse preferentemente dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados se mencionan en particular polímeros de bloque de óxido de etileno-óxido de propileno, alquilfenolpoliglicol éter así como tristrilfenolpoliglicol éter y sus derivados fosfatados o sulfatados. Dispersantes aniónicos adecuados son en particular ligninsulfonatos, sales de poli(ácido acrílico) y condensados de arilsulfonato-formaldehído.
- 15

Como antiespumantes pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que pueden emplearse de acuerdo con la invención todas las sustancias antiespumantes habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente pueden usarse antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

- 20 Como agentes conservantes pueden estar presentes en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención todas las sustancias que pueden emplearse para tales fines en agentes agroquímicos. A modo de ejemplo se mencionan diclorofeno y hemiformal de alcohol bencílico.

- 25 Como espesantes secundarios que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todas las sustancias que pueden emplearse para tales fines en agentes agroquímicos. Preferentemente se tienen en cuenta derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y ácido silícico altamente dispersado.

- 30 Como adhesivos, que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todos los aglutinantes habituales que pueden emplearse en desinfectantes. Preferentemente se mencionan polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

Como giberelinas, que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7, de manera especialmente preferente se usa el ácido giberélico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, páginas 401-412).

- 35 Las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención pueden emplearse o bien directamente o bien después de dilución previa con agua para el tratamiento de semillas de las más diversas especies. De este modo, los concentrados o las preparaciones que pueden obtenerse a partir de los mismos mediante dilución con agua pueden emplearse para la desinfección de la semilla de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de la semilla de maíz, arroz, colza, guisante, judías, algodón, girasol, soja y nabo o también de semillas de verduras de la más diversa naturaleza. Las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención o sus formas de aplicación diluidas pueden emplearse también para la desinfección de semillas de plantas transgénicas.
- 40

- 45 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención o formas de aplicación preparadas a partir de las mismas mediante adición de agua se tienen en cuenta todos los aparatos de mezclado que pueden emplearse habitualmente para la desinfección. En detalle en la desinfección se procede de modo que las semillas se añaden a una mezcladora en el funcionamiento discontinuo o continuo, se agrega la cantidad deseada en cada caso a las formulaciones de desinfectante o bien como tal o bien después de dilución previa con agua y se mezcla hasta la distribución uniforme sobre la semilla. Dado el caso a esto le sigue un proceso de secado.

- 50 La cantidad de aplicación de formulaciones de desinfectante que pueden usarse de acuerdo con la invención puede variarse en dentro de gran intervalo. Depende del contenido respectivo de los compuestos de fórmula (I) en las formulaciones y de la semilla. Las cantidades de aplicación en el caso del compuesto de fórmula (I) se encuentran en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

Salud animal

- 55 En el campo de la salud animal, es decir el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de fórmula (I) son eficaces contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásito abarca en

particular helmintos y protozoos tales como coccidios. Los ectoparásitos son habitual y preferentemente artrópodos, en particular insectos o ácaros.

5 En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de fórmula (I) que presentan una toxicidad favorable frente a animales de sangre caliente, para combatir parásitos que aparecen en la cría de animales y en la cría de ganado en animales útiles, sementales, animales de zoo, animales de laboratorio, animales de ensayo y animales domésticos. Estos son efectivos contra todos o cada uno de los estadios de desarrollo de los parásitos.

10 Entre los animales útiles agrícolas figuran por ejemplo mamíferos tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos y en particular ganado vacuno y cerdos; aves de corral tales como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; pescados o crustáceos, por ejemplo en la acuicultura o dado el caso insectos tales como abejas.

Entre los animales domésticos figuran por ejemplo mamíferos tales como hámsteres, conejillos de indias, ratas, ratones, chinchillas, hurones y en particular perros, gatos, aves enjauladas, reptiles, anfibios o peces de acuario.

De acuerdo con una forma de realización determinada, los compuestos de fórmula (I) se administran a mamíferos.

15 De acuerdo con una forma de realización determinada adicional, los compuestos de fórmula (I) se administran a aves, en concreto aves enjauladas o en particular aves de corral.

Mediante el uso de los compuestos de fórmula (I) para combatir parásitos de animales se reducirá o impedirá la enfermedad, muertes y disminuciones de rendimiento (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de modo que se permite una cría de ganado más económico y más sencillo y puede conseguirse un bienestar de los animales.

20 Con respecto al campo de la salud animal, el término "combate" o "combatir", significa en el presente contexto que mediante los compuestos de fórmula (I) se reduce eficazmente la aparición del parásito respectivo en un animal que está infectado con parásitos de este tipo en una medida inofensiva. Más precisamente, "combatir" en el presente contexto, significa que los compuestos de fórmula (I) destruyen los parásitos respectivos, impiden su crecimiento o impide su multiplicación.

25 Entre los artrópodos figuran, por ejemplo, sin limitarse a ello, del orden anoplúridos, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.;

30 del orden malofágidos y los subórdenes ambliceros y ischnóceros, por ejemplo *Bovicola* spp., *Damalina* spp., *Felicola* spp.; *Lepikentron* spp., *Menopon* spp., *Trichodectes* spp., *Trimenopon* spp., *Trinoton* spp., *Werneckiella* spp.; del orden dípteros y los subórdenes nematóceros y braquíceros, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Atylotus* spp., *Braula* spp., *Calliphora* spp., *Chrysomyia* spp., *Chrysops* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Eusimulium* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematobia* spp., *Haematopota* spp., *Hippobosca* spp., *Hybomitra* spp., *Hydrotaea* spp., *Hypoderma* spp., *Lipoptena* spp., *Lucilia* spp., *Lutzomyia* spp., *Melophagus* spp., *Morellia* spp., *Musca* spp., *Odagmia* spp., *Oestrus* spp., *Philipomyia* spp., *Phlebotomus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Sarcophaga* spp.,

35 *Simulium* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tipula* spp., *Wilhelmia* spp., *Wohlfahrtia* spp.;

del orden sifonápteros, por ejemplo *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., *Pulex* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp.;

del orden heterópteros, por ejemplo *Cimex* spp., *Panstrongylus* spp., *Rhodnius* spp., *Triatoma* spp.; así como insectos molestos y plagas antihigiénicas del orden blatáridos.

40 Además en el caso de los artrópodos pueden mencionarse a modo de ejemplo, sin limitarse a ello, los siguientes ácaros:

45 de la subclase ácaros (Acarina) y del orden Metastigmata, por ejemplo de la familia Argasidae, tal como *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia Ixodidae, tal como *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Rhipicephalus* spp. (el género original de las garrapatas heteróxenas); del orden Mesostigmata, tal como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Sternostoma* spp., *Tropilaelaps* spp., *Varroa* spp.; del orden Actiniedida (Prostigmata), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Demodex* spp., *Listrophorus* spp., *Myobia* spp., *Neotrombicula* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Psorergates* spp., *Trombicula* spp.; y del orden Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarus* spp., *Caloglyphus* spp., *Chorioptes* spp., *Cytodites* spp., *Hypodectes* spp., *Knemidocoptes* spp.,

50 *Laminosioptes* spp., *Notoedres* spp., *Otodectes* spp., *Psoroptes* spp., *Pterolichus* spp., *Sarcoptes* spp., *Trixacarus* spp., *Tyrophagus* spp.

Entre los ejemplos de protozoos parasitarios figuran, sin limitarse a ello:

Mastigophora (Flagellata), tal como:

Metamonada: del orden Diplomonadida por ejemplo *Giardia* spp., *Spironucleus* spp.

55 Parabasala: del orden Trichomonadida por ejemplo *Histomonas* spp., *Pentatrachomonas* spp., *Tetratrachomonas* spp., *Trichomonas* spp., *Tritrachomonas* spp.

Euglenozoa: del orden Trypanosomatida por ejemplo *Leishmania* spp., *Trypanosoma* spp.

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

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

10 Microspora tal como *Encephalitozoon* spp., *Enterocytozoon* spp., *Globidium* spp., *Nosema* spp., y además por ejemplo *Myxozoa* spp.

Entre los helmintos patógenos para seres humanos o animales figuran por ejemplo acantocéfalos, nematodos, pentastoma y plathelminths (por ejemplo monogéneos, cestodos y trematodos).

Entre los helmintos a modo de ejemplo figuran, sin limitarse a ello:

15 monogéneos: por ejemplo: *Dactylogyrus* spp., *Gyrodactylus* spp., *Microbothrium* spp., *Polystoma* spp., *Troglocephalus* spp.;
cestodos: del orden pseudofilídeos por ejemplo: *Bothridium* spp., *Diphyllobothrium* spp., *Diplogonoporus* spp., *Ichthyobothrium* spp., *Ligula* spp., *Schistocephalus* spp., *Spirometra* spp.

20 Del orden ciclofilidos por ejemplo: *Andrya* spp., *Anoplocephala* spp., *Avitellina* spp., *Bertiella* spp., *Cittotaenia* spp., *Davainea* spp., *Diorchis* spp., *Diplopylidium* spp., *Dipylidium* spp., *Echinococcus* spp., *Echinocotyle* spp., *Echinolepis* spp., *Hydatigera* spp., *Hymenolepis* spp., *Joyeuxiella* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Paranoplocephala* spp., *Raillietina* spp., *Stilesia* spp., *Taenia* spp., *Thysaniezia* spp., *Thysanosoma* spp.

25 Trematodos: de la clase digeneos por ejemplo: *Austrobilharzia* spp., *Brachylaima* spp., *Calicophoron* spp., *Catantropis* spp., *Clonorchis* spp., *Collyriclum* spp., *Cotylophoron* spp., *Cyclocoelum* spp., *Dicrocoelium* spp., *Diplostomum* spp., *Echinochasmus* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinostoma* spp., *Eurytrema* spp., *Fasciola* spp., *Fasciolides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Gigantocotyle* spp., *Heterophyes* spp., *Hypoderaeum* spp., *Leucochloridium* spp., *Metagonimus* spp., *Metorchis* spp., *Nanophyetus* spp., *Notocotylus* spp., *Opisthorchis* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Plagiorchis* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Prosthogonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Troglostrongylus* spp.,
30 *Typhlocoelum* spp.

Nematodos: del orden triquinélidos por ejemplo: *Capillaria* spp., *Trichinella* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichuris* spp.

Del orden tilénquidos por ejemplo: *Micronema* spp., *Parastrongyloides* spp., *Strongyloides* spp.

35 Del orden rabdítidos por ejemplo: *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Bronchonema* spp., *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Cooperia* spp., *Cooperioides* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostomum* spp., *Cyclocercus* spp., *Cyclodontostomum* spp., *Cylicocyclus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Cystocaulus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Globocephalus* spp., *Graphidium* spp., *Gyalocephalus* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Hyostrongylus* spp., *Marshallagia* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Neostongylus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Oesophagodontus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp.;
40 *Ornithostrongylus* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Paracooperia* spp., *Paracrenosoma* spp., *Parafilaroides* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Pneumocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Poteriostomum* spp., *Protostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Stephanurus* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Teladorsagia* spp., *Trichonema* spp., *Trichostrongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Troglostrongylus* spp., *Uncinaria* spp.

45 Del orden espirúridos por ejemplo: *Acanthocheilonema* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp., *Ascaris* spp., *Ascarops* spp., *Aspicularis* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Cercopithifilaria* spp.,

50 *Crassicauda* spp., *Dipetalonema* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp.; *Draschia* spp., *Enterobius* spp., *Filaria* spp., *Gnathostoma* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Heterakis* spp.; *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Onchocerca* spp., *Oxyuris* spp., *Parabronema* spp., *Parafilaria* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Physaloptera* spp., *Probstmayria* spp., *Pseudofilaria* spp., *Setaria* spp., *Skjrabinema* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Strongyluris* spp., *Syphacia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Wuchereria* spp.

Acantocéfalos: del orden Oligacanthorhynchida por ejemplo: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden Moniliformida por ejemplo: *Moniliformis* spp.,

del orden polimórfidos por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden Echinorhynchida por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.

Pentastoma: del orden porocefálicos por ejemplo Linguatula spp.

5 En el campo de la medicina veterinaria y en la cría de ganado tiene lugar la administración de los compuestos de fórmula (I) según procedimientos conocidos en la técnica en general, tal como por vía enteral, parenteral, dérmica o nasal en forma de preparados adecuados. La administración puede tener lugar de manera profiláctica, metafiláctica o terapéutica.

Por lo tanto, una forma de realización de la presente invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para su uso como fármaco.

Un aspecto adicional se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para su uso como agente antiendoparasitario.

10 Un aspecto especial adicional de la invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para su uso como agente antihelmíntico, en particular para su uso como nematocida, pesticida contra platelmintos, pesticida contra acantocéfalos o pesticida contra pentastómidos.

Un aspecto especial adicional de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) para su uso como agente antiprotozoico.

15 Un aspecto adicional se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para su uso como agente antiectoparasitario, en particular un artropodicida, muy especialmente un insecticida o un acaricida.

20 Otros aspectos de la invención son formulaciones de medicamentos veterinarios que comprenden una cantidad eficaz de por lo menos un compuesto de la fórmula (I) y por lo menos uno de los siguientes: un excipiente farmacéuticamente aceptable (por ejemplo, diluyentes sólidos o líquidos), un agente auxiliar farmacéuticamente aceptable (por ejemplo, tensioactivos), en particular un excipiente farmacéuticamente aceptable empleado convencionalmente en formulaciones de medicamentos veterinarios y/o un agente auxiliar farmacéuticamente aceptable empleado convencionalmente en formulaciones de medicamentos veterinarios.

25 Un aspecto relacionado de la invención es un procedimiento para la producción de una formulación medicinal veterinaria tal como se describe en el presente documento, que comprende la etapa de mezclar por lo menos un compuesto de la fórmula (I) con excipientes y/o agentes auxiliares farmacéuticamente aceptables, en particular con excipientes farmacéuticamente aceptables empleados convencionalmente en formulaciones de medicamentos veterinarios y/o agentes auxiliares empleados convencionalmente en formulaciones de medicamentos veterinarios.

30 Otro aspecto especial de la invención son formulaciones de medicamentos veterinarios seleccionadas del grupo de formulaciones ectoparasiticidas y endoparasiticidas, en particular seleccionadas del grupo de formulaciones antihelmínticas, antiprotozoarias y artropodicidas, muy especialmente seleccionadas del grupo de formulaciones nematocidas, antiplatelmintos, formulaciones contra acantocéfalos, formulaciones contra los pentastómidos, insecticidas y acaricidas, de acuerdo con los aspectos mencionados, y procedimientos para su producción.

35 Otro aspecto se refiere a un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, en particular una infección por un parásito seleccionado del grupo de los ectoparásitos y endoparásitos mencionados en el presente documento, mediante el uso de una cantidad eficaz de un compuesto de la fórmula (I) en un animal, en particular un animal no humano, que lo necesita.

Otro aspecto se refiere a un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, en particular una infección por un parásito seleccionado del grupo de los ectoparásitos y endoparásitos mencionados en el presente documento, mediante el uso de una formulación de medicamento veterinario tal como se define en el presente documento en un animal, en particular en un animal no humano, que lo necesita.

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

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

45 En una forma de realización determinada, de esta manera, se proporcionan mezclas de por lo menos un compuesto de la fórmula (I) con otros principios activos, en particular con endo- y ectoparasiticidas, para el campo de la medicina veterinaria.

50 En el campo de la salud animal, "mezcla" significa no solo que dos (o más) principios activos diferentes se formulan en una formulación común y se emplean de manera correspondiente juntos, sino que además se refiere a productos que comprenden formulaciones separadas para cada principio activo. Por consiguiente, cuando se han de emplear más de dos principios activos, todos los principios activos se pueden formular en una formulación común o todos los principios activos se pueden formular en formulaciones separadas; igualmente concebibles son las formas mixtas en las que algunos de los principios activos se formulan juntos y algunos de los principios activos se formulan por separado. Las formulaciones separadas permiten la aplicación separada o sucesiva de los principios activos en

cuestión.

Los principios activos especificados en el presente documento con sus "nombres comunes" son conocidos y se describen, por ejemplo, en el "Pesticide Manual" (véase más arriba) o pueden buscarse en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

- 5 Principios activos a modo de ejemplo del grupo de los ectoparasiticidas como componentes de mezcla, sin que esto pretenda ser una limitación, incluyen a los insecticidas y acaricidas enumerados expresamente anteriormente. Otros principios activos que pueden usarse se mencionan a continuación de acuerdo con la clasificación antes mencionada en base al Esquema de Clasificación de Modo de Acción de IRAC actual: (1) inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE); (2) bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA; (3) moduladores del canal de sodio; (4) moduladores competitivos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR); (5) moduladores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR); (6) moduladores alostéricos del canal de cloruro regulado con glutamato (GluCl); (7) miméticos de la hormona juvenil; (8) otros inhibidores (multisitio) no específicos; (9) moduladores de órganos cordotonales; (10) inhibidores del crecimiento de ácaros; (12) inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, tales como interruptores de ATP; (13) desacopladores de fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente de protones; (14) bloqueadores del canal del receptor nicotínico de acetilcolina; (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0; (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1; (17) interruptores de la muda (especialmente en los dípteros); (18) agonistas del receptor de ecdisona; (19) agonistas del receptor de octopamina; (21) inhibidores del transporte de electrones del complejo I mitocondrial; (25) inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial; (20) inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial; (22) bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje; (23) inhibidores de acetil CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina;
- 10 principios activos que tienen mecanismos de acción desconocidos o no específicos, por ejemplo fentripanilo, fenoxacrim, ciclopreno, clorobencilato, clordimeform, flubenzimina, diciclanil, amidoflumet, quinometionato, triaratenol, clotiazoben, tetrasul, oleato de potasio, petróleo, metoxadiazona, gossiplur, flutenzina, brompropilato, crolita;
- 15 compuestos de otras clases, por ejemplo butacarb, dimetilan, cloetocarb, fosfocarb, pirimifos(-etilo), paration(-etilo), metacrifos, o-salicilato de isopropilo, triclofon, sulprofos, propafos, sebufos, piridation, protoato, diclofention, demeton-S-metil sulfona, isazofos, cianofenos, dialifos, carbofenotion, autatiofos, aromfenvinfos(-metilo), azinfos(-etilo), clorpirifos(-etilo), fosmetilan, yodofenos, dioxabenzofos, formotion, fonofos, flupirazofos, fensulfotion, etrimfos;
- 20 compuestos de organocloro, por ejemplo camfeclor, lindano, heptaclor; o fenilpirazoles, por ejemplo acetoprol, pirafuprol, piriprol, vaniliprol, sisapronil; o isoxazolininas, por ejemplo sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner; piretroides, por ejemplo (cis-, trans-)metoflutrina, proflutrina, flufenprox, flubrocitrinato, fubfenprox, fenflutrina, protrifenbut, piresmetrina, RU15525, teraletrina, cis-resmetrina, heptaflutrina, bioetanometrina, biopermetrina, fenpiritrina, cis-cipermetrina, cis-permetrina, clocitrina, cihalotrina (lambda-), clovaportrina, o compuestos de
- 25 hidrocarburos halogenados (HCHs), neonicotinoides, por ejemplo nitiazina dicloromezotiaz, triflumezopirim lactonas macrocíclicas, por ejemplo nemadectina, ivermectina, latidectina, moxidectina, selamectina, eprinomectina, doramectina, benzoato de emamectina; oxima de milbemicina
- 30 tripreno, epofenonano, diofenolan; compuestos biológicos, hormonas o feromonas, por ejemplo productos naturales, por ejemplo thuringiensina, codlemona o componentes del Neem dinitrofenoles, por ejemplo dinocap, dinobuton, binapacril; benzoilureas, por ejemplo fluazuron, penfluron;
- 35 derivados de amidina, por ejemplo clormebuform, cimiazol, demiditraz acaricidas para el control de varroa en colmenas, por ejemplo ácidos orgánicos, por ejemplo ácido fórmico, ácido oxálico.

Los principios activos ilustrativos del grupo de los endoparasiticidas, como componentes de mezclado, incluyen, pero de manera no taxativa, principios activos antihelmínticos e principios activos antiprotozoarios.

- 50 Los principios activos antihelmínticos incluyen, pero de manera no taxativa, a los siguientes principios activos nematocidas, trematocidas y/o cestocidas:

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

- 55 de la clase de los benzimidazoles y probenzimidazoles, por ejemplo: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, tiofanato, parabendazol, oxfendazol, netobimin, fenbendazol, febantel, tiabendazol, ciclobendazol, cambendazol, sulfóxido de albendazol, albendazol, flubendazol;

de la clase de los depsipéptidos, preferentemente depsipéptidos cíclicos, especialmente los depsipéptidos cíclicos de 24 miembros, por ejemplo: emodepsida, PF1022A;

de la clase de las tetrahidropirimidinas, por ejemplo: morantel, pirantel, oxantel;

- de la clase de los imidazotiazoles, por ejemplo: butamisol, levamisol, tetramisol;
- de la clase de las aminofenilamidinas, por ejemplo: amidantel, amidantel desacilado (dAMD), tribendimidina;
- de la clase de los aminoacetonitrilos, por ejemplo: monepantel;
- de la clase de los paraherquamidas, por ejemplo: paraherquamida, derquantel;
- 5 de la clase de las salicilanilidas, por ejemplo: tribromsalan, bromoxanida, brotianida, cloixanida, closantel, niclosamida, oxiclozanida, rafoxanida;
- de la clase de los fenoles sustituidos, por ejemplo: nitroxinil, bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolan, meniclofolan;
- 10 de la clase de los organofosfatos, por ejemplo: triclorfon, naftalofos, diclorvos/DDVP, crufomato, cumafos, haloxon;
- de la clase de las piperazinonas/quinolinas, por ejemplo: praziquantel, epsiprantel;
- de la clase de las piperazinas, por ejemplo: piperazina, hidroxizina;
- de la clase de las tetraciclinas, por ejemplo: tetraciclina, clorotetraciclina, doxiciclina, oxitetraciclina, rolitetraciclina;
- 15 de diversas otras clases, por ejemplo: bunamidina, niridazol, resorantel, omfalotina, oltipraz, nitroscanato, nitroxinilo, oxamniquina, mirasan, miracil, lucanton, hicanton, hetolin, emetin, dietilcarbamazina, diclorofen, diamfenetida, clonazepam, befenio, amoscanato, clorsulon.

Los principios activos antiprotozoarios incluyen, pero de manera no taxativa, a los siguientes principios activos:

- de la clase de las triazinas, por ejemplo: diclazuril, ponazuril, letrazuril, toltrazuril;
- 20 de la clase de los ionóforos de poliéter, por ejemplo: monensina, salinomycin, maduramicina, narasina;
- de la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo: milbemicina, eritromicina;
- de la clase de las quinolonas, por ejemplo: enrofloxacin, pradofloxacin;
- de la clase de las quininas, por ejemplo: cloroquina;
- de la clase de las pirimidinas, por ejemplo: pirimetamina;
- 25 de la clase de las sulfonamidas, por ejemplo: sulfaquinoxalina, trimetoprim, sulfaclozina;
- de la clase de las tiaminas, por ejemplo: amprolio;
- de la clase de las lincosamidas, por ejemplo: clindamicina;
- de la clase de las carbanilidas, por ejemplo: imidocarb;
- de la clase de los nitrofuranos, por ejemplo: nifurtimox;
- 30 de la clase de los alcaloides de quinazolinona, por ejemplo: halofuginona;
- de diversas otras clases, por ejemplo: oxamniquina, paromomicina;
- de la clase de las vacunas o antígenos de microorganismos, por ejemplo: Babesia canis rossi, Eimeria tenella, Eimeria praecox, Eimeria necatrix, Eimeria mitis, Eimeria maxima, Eimeria brunetti, Eimeria acervulina, Babesia canis vogeli, Leishmania infantum, Babesia canis canis, Dictyocaulus viviparus.
- 35 Todos los componentes de mezcla mencionados, según sea el caso, también pueden formar sales con bases o ácidos adecuados si son capaces de hacerlo sobre la base de sus grupos funcionales.

Combate de vectores

- Los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse también en el combate de vectores. Un vector en el sentido de la presente invención es un artrópodo, en particular un insecto o arácnido, que es capaz de transmitir agentes patógenos tales como por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de una reserva (planta, animal, ser humano, etc.) a un hospedador. Los agentes patógenos pueden transmitirse o bien de manera mecánica (por ejemplo Trachoma mediante moscas que no muerden) a un hospedador, o después de la inyección (por ejemplo parásitos de malaria mediante mosquitos) a un hospedador.
- 40

Ejemplos de vectores y las enfermedades o agentes patógenos transmitidos por estos son:

1) mosquitos

- Anopheles: malaria, Filarirose;
- Culex: encefalitis japonesa, Filariasis, otras enfermedades virales, transmisión por otros gusanos;

5 - Aedes: fiebre amarilla, fiebre del Dengue, otras enfermedades virales, Filariasis;

- Simulium: transmisión por gusanos en particular Onchocerca volvulus;

- Psychodidae: transmisión de leishmaniasis

2) piojos: infecciones cutáneas, tifus exantemático epidémico;

3) pulgas: peste, tifus exantemático endémico, tenias;

10 4) moscas: enfermedad del sueño (trpanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;

5) ácaros: acarosis, tifus exantemático epidémico, rickettsiosis, tularemia, encefalitis de San Luis, encefalitis centroeuropea por garrapatas (FSME), fiebre de Crimea-Congo, borreliosis;

6) garrapatas: borreliosis tales como Borrelia burgdorferi sensu lato, Borrelia duttoni, encefalitis centroeuropea, fiebre Q (Coxiella burnetii), babesias (Babesia canis canis), erliquiosis.

15 Ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos, por ejemplo, áfidos, moscas, cigarras o trips, que pueden transmitir virus de plantas a las plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas, son arañas, piojos, escarabajos y nematodos.

20 Otros ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, en particular de los géneros Aedes, Anopheles, por ejemplo A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (Malaria) y Culex, Psychodide tal como Phlebotomus, Lutzomyia, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas, que pueden transmitir agentes patógenos a animales y/o seres humanos.

Un combate de vector es también posible cuando los compuestos de fórmula (I) rompen la resistencia.

25 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para su uso en la prevención de enfermedades y/o agentes patógenos, que se transmiten por vectores. Por lo tanto, otro aspecto de la presente invención es el uso de compuestos de fórmula (I) para el combate de vectores, por ejemplo en la agricultura, en horticultura, en bosques, en jardines e instalaciones de ocio así como en la protección de productos almacenados y de materiales.

Protección de materiales industriales

30 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para la protección de materiales industriales contra el ataque o la destrucción por insectos, por ejemplo de los órdenes coleópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, psocópteros y zifentomas.

Por materiales industriales se entienden en el presente contexto materiales no vivos, tales como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de la madera y pinturas. La aplicación de la invención para la protección de la madera es especialmente preferida.

35 En otra forma de realización, los compuestos de fórmula (I) se emplean junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En otra forma de realización, los compuestos de fórmula (I) se encuentran como un pesticida listo para usar (ready-to-use), es decir, pueden aplicarse sin cambios adicionales en el material correspondiente. Como insecticidas adicionales o como fungicidas se tienen en cuenta en particular los mencionados anteriormente.

40 Sorprendentemente se descubrió también que los compuestos de fórmula (I) pueden usarse para la protección frente al crecimiento de vegetación de objetos, en particular de cascos de embarcaciones, cribas, redes, edificios, muelles e instalaciones de señalización, que entran en contacto con agua de mar o agua salobre. Igualmente, los compuestos de fórmula (I) pueden emplearse solos o en combinaciones con otros principios activos como agentes antiincrustación.

Combatir plagas animales en el sector de la higiene

45 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para combatir plagas animales en el sector de la higiene. En particular, la invención puede usarse en la protección doméstica, de la higiene y de los productos almacenados, principalmente para combatir insectos, arácnidos, garrapatas y ácaros, que existen en espacios cerrados, tal como

por ejemplo viviendas, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos, instalaciones de cría de animales. Para combatir las plagas animales, los compuestos de fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros principios activos y/o agentes auxiliares. Preferentemente se usan en productos de insecticida doméstico. Los compuestos de fórmula (I) son eficaces contra especies sensibles y resistentes así como contra todos los estados de desarrollo.

- 5 Entre estas plagas figuran por ejemplo plagas de la clase arácnidos, de los órdenes escorpiones, arañas y opiliones, de las clases quilópodos y diplópodos, de la clase insectos el orden blatodeos, de los órdenes coleópteros, dermápteros, dípteros, heterópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, ftirápteros, psocópteros, saltatorios u ortópteros, sifonápteros y zigentomas y de la clase malacostraca el orden isópodos.

- 10 La aplicación tiene lugar por ejemplo en aerosoles, pulverizaciones sin presión, por ejemplo pulverizaciones de bombeo y atomización, nebulizadores, formadores de niebla, espumas, geles, productos de evaporador con placas de evaporador de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados por propelente, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles antipollas, bolsitas antipollas y geles antipollas, como gránulos o polvos, en cebos de dispersión o estaciones de cebo.

Explicación de los procedimientos y productos intermedios

- 15 Los siguientes ejemplos de preparación y de uso ilustran la invención sin limitarla. Los productos se caracterizaron mediante espectroscopía de RMN de ^1H y/o CL-EM (Cromatografía Líquida Espectrometría de Masas).

La determinación de los valores de logP tuvo lugar de acuerdo con la directiva OECD 117 (Directiva EC 92/69/EEC) mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en columnas de fase inversa (RP) (C18), con los siguientes métodos:

- 20 [a] La determinación con CL-EM en el intervalo ácido tuvo lugar a pH 2,7 con ácido fórmico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo (contiene ácido fórmico al 0,1 %) como eluyentes; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo.

- 25 [b] La determinación con CL-EM en el intervalo neutro tuvo lugar a pH 7,8 con solución acuosa de hidrogenocarbonato de amonio 0,001 molar y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo.

La calibración tuvo lugar con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (determinación de los valores de logP por medio de los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

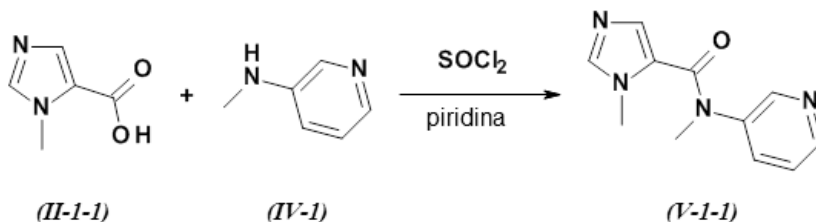
- 30 Los espectros de RMN se determinaron con un aparato Bruker Avance 400 equipado con un cabezal de sonda de flujo (volumen de 60 μl). En casos individuales, los espectros de RMN se midieron con un aparato Bruker Avance II 600.

- 35 Los datos de RMN de los ejemplos seleccionados se indican en forma clásica (valores δ , separación por multiplete, número de átomos de H). La separación de las señales se describió de la siguiente manera: s (singlete), d (doblete), t (triplete), q (cuartete), quint (quintuplete), m (multiplete), a (para señales anchas). Como disolvente se usaron CD_3CN , CDCl_3 o $\text{D}_6\text{-DMSO}$, empleándose como referencia tetrametilsilano (0,00 ppm).

Ejemplos de preparación

Procedimiento A

Ejemplo: *N*,1-Dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (V-1-1)

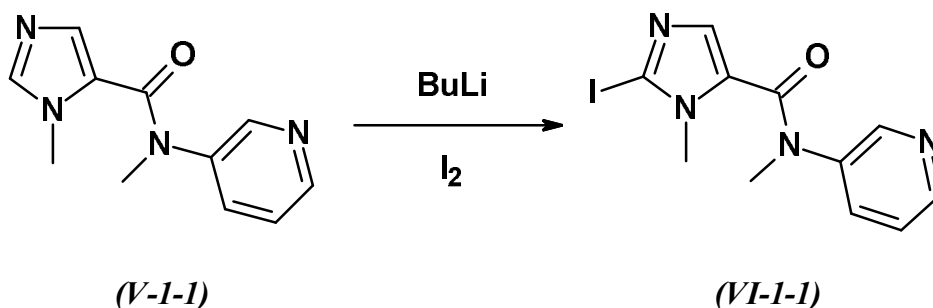


- 40 Una suspensión de 12,0 g (95,2 mmol) de ácido 1-metilimidazol-5-carboxílico (II-1-1) en 72 ml de tolueno se mezcló con 12,7 g (105 mmol) de cloruro de tionilo y se agitó durante la noche a 130 °C. La mezcla de reacción se concentró a vacío. El residuo se mezcló con una solución de 10,3 g (95,2 mmol) de 3-metilamino-piridina (IV-1) en 72 ml de piridina y la mezcla de reacción resultante se agitó durante 4 horas a 115 °C. A continuación se concentró nuevamente a vacío. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetonitrilo/metanol como eluyente.
- 45 Después de purificar, se obtuvieron 8,1 g (39,3 % del teórico).

logP[n] = 0,44;

RMN de ^1H (CD_3CN , 400 MHz); δ = 3,39 (s, 3H), 3,81 (s, 3H), 6,17 (s, 1H), 7,36-7,40 (m, 2H), 7,67-7,70 (m, 1H), 8,41 (m, 1H), 8,47 (m, 1H) ppm.

Ejemplo: 2-Yodo-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (VI-1-1)



5

5,00 g (23,1 mmol) de *N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (V-1-1) se disolvieron en 150 ml de THF y se enfriaron hasta -90°C . La temperatura se mantuvo durante la reacción entre -85°C y -90°C . Se añadieron gota a gota 9,68 ml (24,2 mmol) de solución 2,5 molar de *n*-BuLi en *n*-hexano en el plazo de 30 minutos a -90°C y se agitó durante 5 minutos. A continuación se añadieron gota a gota en el plazo de 20 minutos 0,242 g (69,4 mmol) de yodo, disueltos en 50 ml de THF. Se agitaron durante otros 30 minutos a -80°C y a continuación se calentaron en el plazo de 1 hora hasta temperatura ambiente. La preparación se extrajo con solución semiconcentrada de hidrogenocarbonato de sodio/diclorometano. La fase acuosa se extrajo nuevamente tres veces con diclorometano. Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron con un poco de agua, se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 4,35 g (55,0 % del teórico).

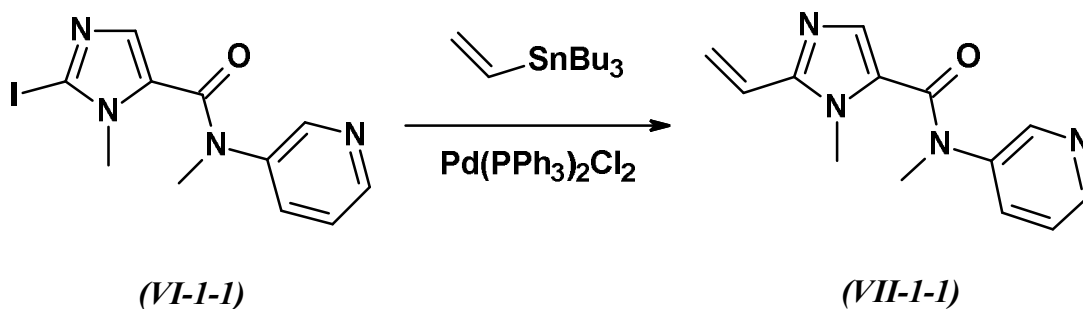
10

15

logP[a]: 0,66; logP[n]: 0,97;

RMN de ^1H ($\text{DMSO}-d_6$, 400 MHz); δ = 3,37 (s, 3H), 3,74 (s, 3H), 6,27 (s, 1H), 7,42-7,45 (m, 1H), 7,82-7,85 (m, 1H), 8,465-8,495 (m, 2H) ppm.

Ejemplo: *N*,1-Dimetil-*N*-(piridin-3-il)-2-vinil-1*H*-imidazol-5-carboxamida (VII-1-1)



20

Una solución de 400 mg (1,17 mmol) de 2-yodo-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (VI-1-1) y 535 mg (1,64 mmol) de tributil(vinil)estannano en 12 ml de *N,N*-dimetilformamida se desgasificó con argón. 8,2 mg (0,012 mmol) de dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio se añadieron y la solución se agitó durante 18 horas a 70°C . Se añadieron 535 mg (1,64 mmol) de tributil(vinil)estannano y 8,2 mg (0,012 mmol) de dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio y la solución se agitó otra vez durante 18 horas a 70°C . La preparación se concentró. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 200 mg (70,6 % del teórico).

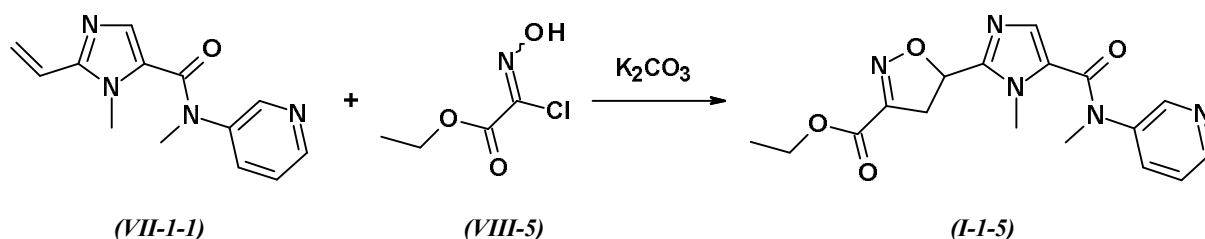
25

logP[n]: 0,82;

30

RMN de ^1H (CD_3CN , 400 MHz); δ = 3,395 (s, 3H), 3,78 (s, 3H), 5,42-5,46 (dd, 1H), 6,06-6,11 (dd, 1H), 6,27 (s, 1H), 6,65-6,72 (dd, 1H), 7,34-7,37 (m, 1H), 7,66-7,68 (m, 1H), 8,397-8,403 (m, 1H), 8,44-8,45 (m, 1H) ppm.

Ejemplo: 5-{1-metil-5-[metil(piridin-3-il)carbamoil]-1*H*-imidazol-2-il}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-carboxilato de etilo (I-1-5)

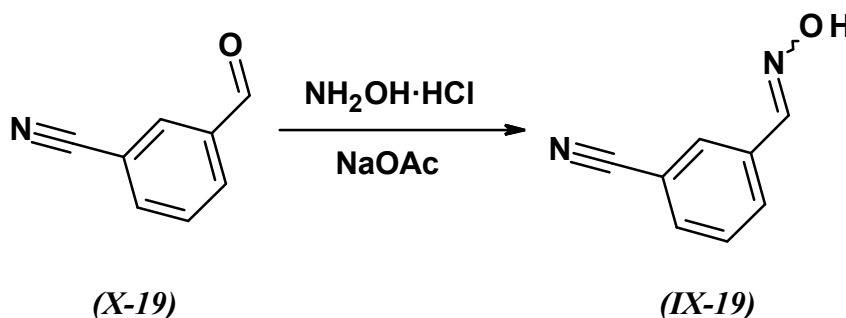


Una suspensión de 90,0 mg (0,371 mmol) de *N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-2-vinil-1*H*-imidazol-5-carboxamida (VII-1-1), 61,9 mg (0,409 mmol) de cloro(hidroxiimino)acetato de etilo (VIII-5) y 56,5 mg (0,409 mmol) carbonato de potasio en 5,0 ml de diclorometano se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. La preparación se extrajo con agua/diclorometano. La fase acuosa se extrajo nuevamente tres veces con diclorometano. La fase orgánica se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 66,9 mg (50,4 % del teórico).

logP[a]: 1,04; logP[n]: 1,32;

RMN de ¹H (CDCl₃, 400 MHz); δ = 1,33-1,37 (t, 3H), 3,43-3,50 (dd, 1H), 3,47 (s, 3H), 3,98 (s, 3H), 4,14-4,21 (dd, 1H), 4,31-4,37 (q, 2H), 5,79-5,84 (dd, 1H), 6,21 (s, 1H), 7,32-7,35 (m, 1H), 7,52-7,55 (m, 1H), 8,45-8,46 (m, 1H), 8,53-8,54 (m, 1H) ppm.

Ejemplo: 3-(Hidroxiimino)metilbenzonitrilo (IX-19)

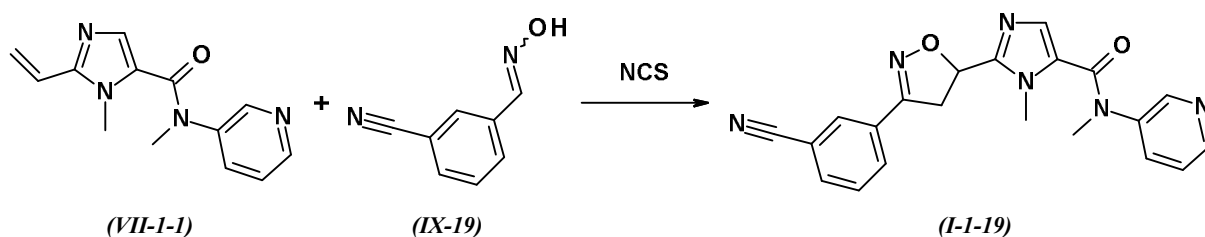


Una suspensión de 500 mg (3,81 mmol) de 3-formilbenzonitrilo (X-19), 530 mg (7,62 mmol) de clorhidrato de hidroxilamina y 313 mg (3,18 mmol) de acetato de sodio en 6,0 ml de etanol se agitó durante 3 horas a temperatura ambiente. La preparación se concentró. El residuo se disolvió en dietil éter y se filtró. El filtrado se concentró, se disolvió en 5,0 ml de etanol y se precipitó con 20 ml de *n*-pentano. Después de la filtración, se obtuvieron 126 mg (22,7 % del teórico).

logP[a]: 1,20;

RMN de ¹H (CDCl₃, 400 MHz); δ = 7,41-7,45 (m, 1H), 7,65-7,67 (m, 1H), 7,79-7,81 (m, 1H), 7,885 (s, 1H), 8,13 (s, 1H) ppm.

Ejemplo: 2-[3-(3-Cianfenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (I-1-19)



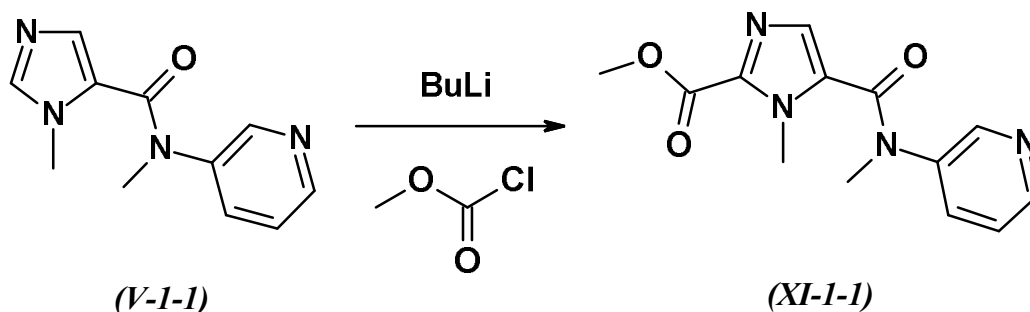
Una solución de 121 mg (0,826 mmol) de 3-(hidroxiimino)metilbenzonitrilo (IX-19), 110 mg (0,826 mmol) de *N*-clorosuccinimida y 6,7 μl (0,083 mmol) de piridina se agitaron durante 4,5 horas a temperatura ambiente. Se añadieron 40,0 mg (0,165 mmol) de *N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-2-vinil-1*H*-imidazol-5-carboxamida (VII-1-1) y 0,115 ml (0,826 mmol) de trietilamina y la solución se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. La preparación se extrajo con agua/diclorometano. La fase orgánica se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se purificó sobre RP18 por HPLC con acetonitrilo/agua como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 37,4 mg (55,7 % del teórico).

logP[a]: 1,39; logP[n]: 1,63;

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , 400 MHz); δ = 3,385 (s, 3H), 3,71-3,78 (dd, 1H), 3,87 (s, 3H), 4,08-4,14 (dd, 1H), 6,02-6,07 (dd, 1H), 6,21 (s, 1H), 7,42-7,45 (m, 1H), 7,65-7,69 (m, 1H), 7,84-7,87 (m, 1H), 7,93-7,95 (m, 1H), 8,04-8,06 (m, 1H), 8,135 (s, 1H), 8,45-8,46 (m, 1H), 8,50-8,51 (m, 1H) ppm.

Procedimiento B

5 Ejemplo: 1-Metil-5-[metil(piridin-3-il)carbamoi]l-1H-imidazol-2-carboxilato de metilo (compuesto XI-1-1)

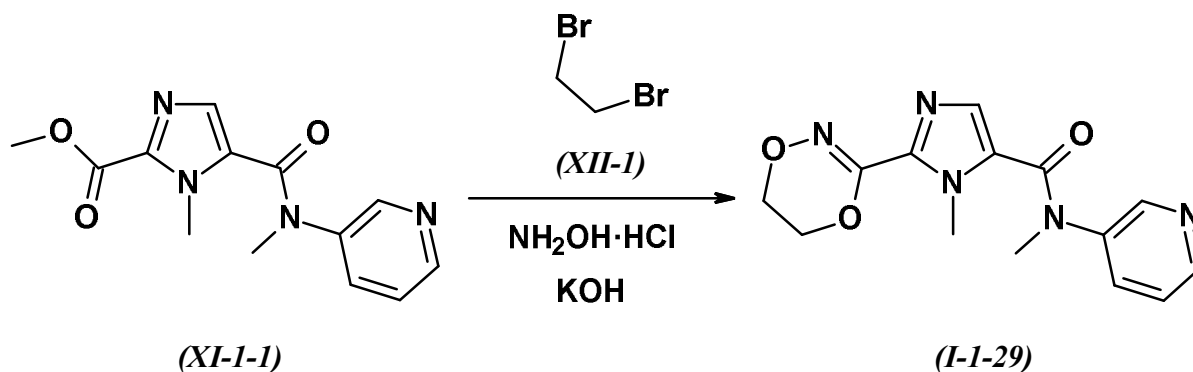


3,00 g (13,9 mmol) de *N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (V-1-1) se disolvieron en 120 ml de THF y se enfriaron hasta $-90\text{ }^\circ\text{C}$. La temperatura se mantuvo durante la reacción entre $-85\text{ }^\circ\text{C}$ y $-90\text{ }^\circ\text{C}$. Se añadieron gota a gota 6,10 ml (15,3 mmol) de solución 2,5 molar de *n*-BuLi en *n*-hexano en el plazo de 5 minutos a $-90\text{ }^\circ\text{C}$ y se agitaron durante 5 minutos. A continuación se añadieron gota a gota en el plazo de 5 minutos 3,22 ml de metilcarbonocloridato (41,6 mmol). Se agitaron durante otros 30 minutos a $-80\text{ }^\circ\text{C}$ y a continuación se calentaron en el plazo de 5 minutos hasta $-60\text{ }^\circ\text{C}$. La preparación se extrajo con solución semiconcentrada de hidrogenocarbonato de sodio/diclorometano. La fase acuosa se extrajo nuevamente tres veces con diclorometano. Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron con un poco de agua, se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 2,78 g (72,5 % del teórico).

logP[a]: 0,53; logP[n]: 0,84;

RMN de ^1H (CD_3CN , 400 MHz); δ = 3,42 (s, 3H), 3,83 (s, 3H), 4,05 (s, 3H), 6,46 (s, 1H), 7,32-7,36 (m, 1H), 7,64-7,67 (m, 1H), 8,387-8,393 (m, 1H), 8,43-8,45 (m, 1H) ppm.

20 Ejemplo: 2-(5,6-Dihidro-1,4,2-dioxazin-3-il)-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (I-1-29)

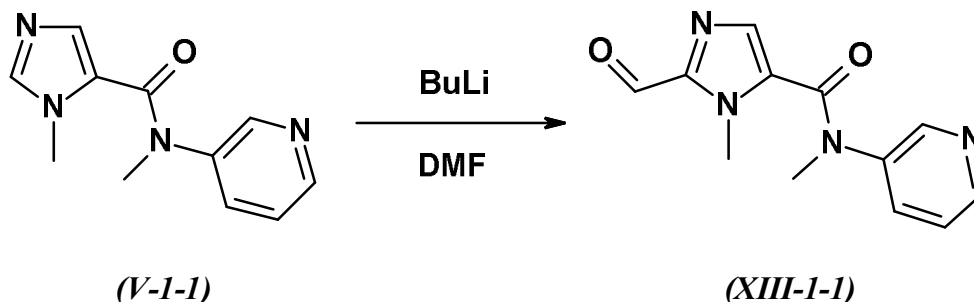


64,3 mg (0,926 mmol) de clorhidrato de hidroxilamina se disolvieron en 3,0 ml de metanol. Se añadieron gota a gota 34,3 mg (0,611 mmol) de hidróxido de potasio en 2,0 ml de metanol y 127 mg (0,463 mmol) de 1-metil-5-[metil(piridin-3-il)carbamoi]l-1*H*-imidazol-2-carboxilato de metilo (X-1-1) en varias porciones. Se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente, durante 2 horas a $40\text{ }^\circ\text{C}$ y 2 horas a $60\text{ }^\circ\text{C}$. Se añadieron gota a gota 17,7 mg (0,315 mmol) de hidróxido de potasio en 1,0 ml de metanol y se agitaron durante otras 2 horas a $60\text{ }^\circ\text{C}$. Se añadieron 64,0 mg (0,463 mmol) de carbonato de potasio y 0,178 ml (2,07 mmol) de 1,2-dibromoetano y se agitaron durante otras 18 horas a $60\text{ }^\circ\text{C}$. La preparación se concentró y se extrajo con agua/diclorometano. La fase orgánica se combinó, se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. La fracción deseada se purificó sobre RP18 por HPLC con acetonitrilo/agua como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 4,3 mg (3,1 % del teórico).

logP[a]: 0,45; logP[n]: 0,76;

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , 400 MHz); δ = 3,39 (s, 3H), 3,87 (s, 3H), 4,17-4,20 (m, 2H), 4,46-4,48 (m, 2H), 6,39 (s, 1H), 7,42-7,45 (m, 1H), 7,83-7,86 (m, 1H), 8,46-8,47 (m, 1H), 8,49-8,50 (m, 1H) ppm.

35 Procedimiento C

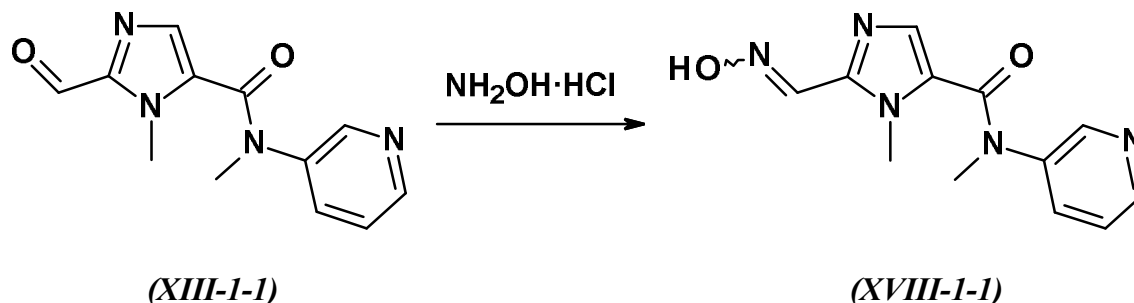
Ejemplo: 2-Formil-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (XIII-1-1)

4,00 g (18,5 mmol) de *N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (*V-1-1*) se disolvieron en 150 ml de THF y se enfriaron hasta -90 °C. La temperatura se mantuvo durante la reacción entre -85 °C y -90 °C. Se añadieron gota a gota 8,14 ml (20,3 mmol) de solución 2,5 molar de *n*-BuLi en *n*-hexano en el plazo de 30 minutos a -90 °C y se agitaron durante 5 minutos. A continuación se añadieron gota a gota en el plazo de 20 minutos 4,27 ml (55,5 mmol) de yodo, disueltos en 50 ml de THF. Se agitaron durante otros 60 minutos a -80 °C y a continuación se calentaron en el plazo de 30 minutos hasta temperatura ambiente. La preparación se extrajo con solución semiconcentrada de hidrogenocarbonato de sodio/diclorometano. La fase acuosa se extrajo nuevamente tres veces con diclorometano.

Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron con un poco de agua, se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 3,00 g (65,1 % del teórico).

logP[a]: 0,43; logP[n]: 0,60;

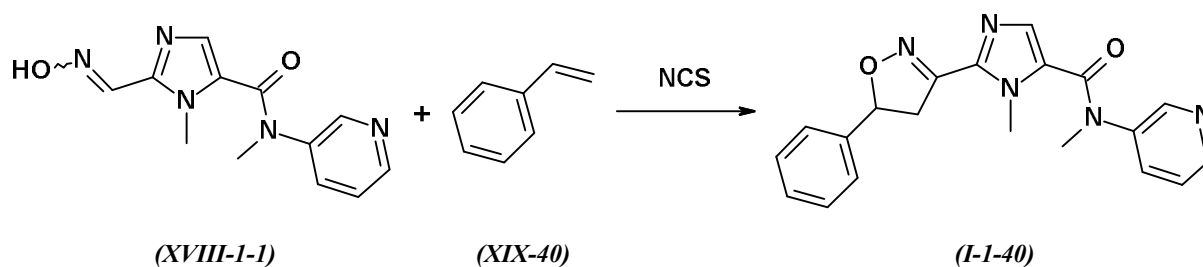
RMN de ¹H (DMSO-d⁶, 400 MHz); δ = 3,42 (s, 3H), 4,05 (s, 3H), 6,65 (s, 1H), 7,42-7,455 (m, 1H), 7,85-7,88 (m, 1H), 8,47-8,49 (m, 1H), 8,52 (m, 1H), 9,66 (s, 1H) ppm.

Procedimiento D**Ejemplo: 2-[(Hidroxiimino)metil]-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (XVIII-1-1)**

Una solución de 1,00 g (4,09 mmol) de 2-formil-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (*XIII-1-1*), 337 mg (4,86 mmol) de cloruro de hidroxilamonio y 398 mg (4,86 mmol) de acetato de sodio en 3,75 ml de etanol y 1,17 ml de agua durante 1 hora a temperatura ambiente y 3 horas a reflujo. La preparación se concentró. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. La fracción deseada se disolvió en diclorometano/metanol, se filtró y se concentró. Después de purificar, se obtuvieron 1,12 g (93,9 % del teórico).

logP[n]: 0,51;

RMN de ¹H (DMSO-d⁶, 400 MHz); δ = 3,39 (s, 3H), 3,94 (s, 3H), 6,39 (s, 1H), 7,42-7,45 (m, 1H), 7,83-7,86 (m, 1H), 8,03 (s, 1H), 8,46-8,47 (m, 1H), 8,50 (m, 1H), 11,79 (s, 1H) ppm.

Ejemplo: *N*,1-Dimetil-2-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (I-1-40)

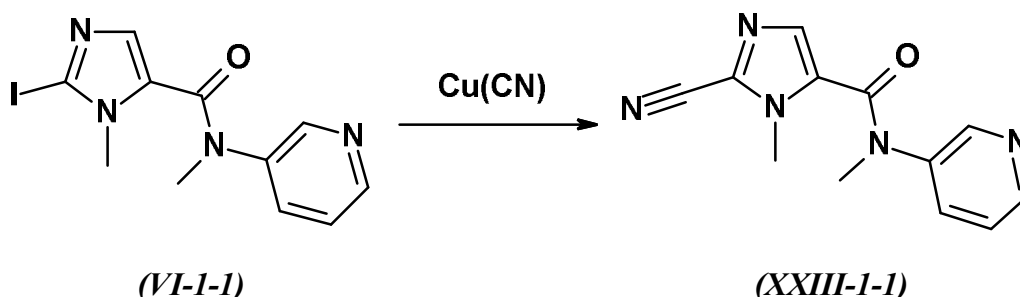
Una solución de 100 mg (0,386 mmol) de 2-(hidroxiimino)-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (XVIII-1-1), 51,5 mg (0,386 mmol) de *N*-clorosuccinimida y 3,1 μ l (0,039 mmol) de piridina se agitó durante 4,5 horas a temperatura ambiente. Se añadieron 53,0 μ l (0,463 mmol) de estireno (XIX-40) y 53,8 μ l (0,386 mmol) de trietilamina y la solución se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. La preparación se extrajo con agua/diclorometano. La fase orgánica se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. La fracción deseada se purificó sobre RP18 por HPLC con acetonitrilo/agua como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 34,0 mg (23,9 % del teórico).

logP[a]: 1,86; logP[n]: 1,97;

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , 400 MHz); δ = 3,29-3,36 (dd, 1H), 3,41 (s, 3H), 3,83-3,90 (dd, 1H), 4,05 (s, 3H), 5,65-5,70 (dd, 1H), 6,46 (s, 1H), 7,31-7,39 (m, 5H), 7,42-7,46 (m, 1H), 7,85-7,88 (m, 1H), 8,46-8,47 (m, 1H), 8,52 (m, 1H) ppm.

Procedimiento F

Ejemplo: 2-Cian-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (XXIII-1-1)

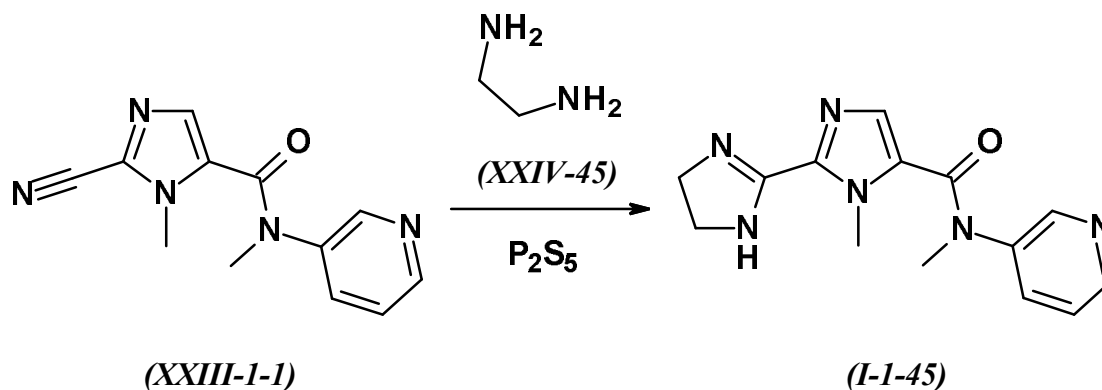


Una solución de 1,00 g (2,92 mmol) de 2-yodo-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (VI-1-1) y 314 mg (3,51 mmol) de cianuro de cobre (I) en 29 ml de piridina se agitó durante 3 horas a 120 °C. La preparación se extrajo con solución concentrada de cloruro de amonio / acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con solución concentrada de EDTA. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 371 mg (52,6 % del teórico).

logP[a]: 0,63; logP[n]: 0,85;

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , 400 MHz); δ = 3,405 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 6,49 (s, 1H), 7,44-7,47 (m, 1H), 7,86-7,88 (m, 1H), 8,53 (m, 2H) ppm.

Ejemplo: *N*,1-Dimetil-*N*-(piridin-3-il)-4',5'-dihidro-1*H*,1'*H*-2,2'-biimidazol-5-carboxamida (I-1-45)



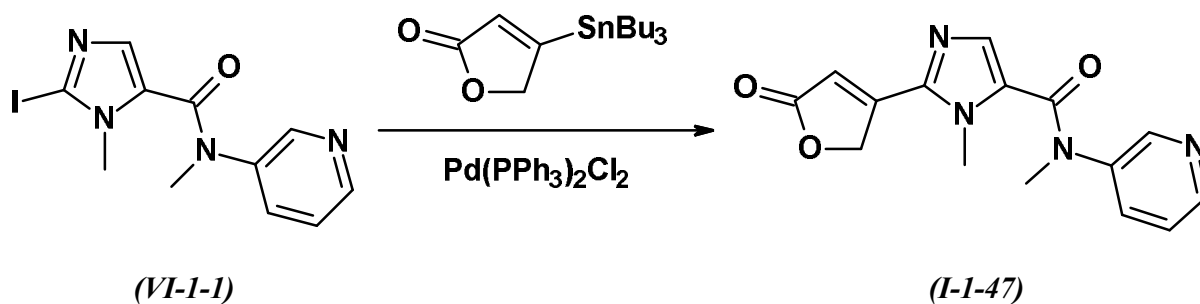
Una solución de 25,0 mg (0,104 mmol) de 2-cian-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (XXIII-1-1) y 1,6 mg (0,004 mmol) de pentasulfuro de fósforo en 3,0 ml de etilendiamina (XXIV-45) se agitó durante 20 minutos a 116 °C en microondas. La preparación se extrajo con agua/diclorometano. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 4,3 mg (14,2 % del teórico).

logP[n]: 0,54;

RMN de ^1H (DMSO- d_6 , 400 MHz); δ = 3,40 (s, 3H), 3,78 (m, 4H), 4,13 (s, 3H), 6,39 (s, 1H), 6,89 (m, 1H), 7,41-7,44 (m, 1H), 7,82-7,85 (m, 1H), 8,45-8,46 (m, 1H), 8,49-8,50 (m, 1H) ppm.

Procedimiento O

Ejemplo: *N*,1-Dimetil-2-(5-oxo-2,5-dihidrofuran-3-il)-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (I-1-47)



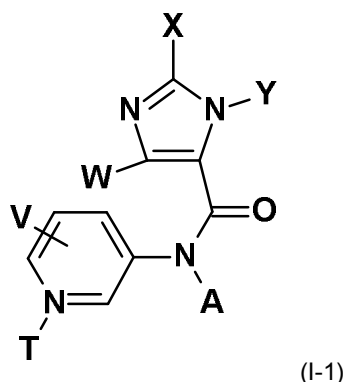
Una solución de 50,0 mg (0,146 mmol) de 2-yodo-*N*,1-dimetil-*N*-(piridin-3-il)-1*H*-imidazol-5-carboxamida (X-1-1) y 109 mg (0,292 mmol) de tributil(vinil)estannano en 3,0 ml de *N,N*-dimetilformamida se desgasificó con argón. Se añadió 1,0 mg (0,001 mmol) de dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio y la solución se agitó durante 18 horas a 170 °C. La preparación se concentró. El residuo se purificó en gel de sílice por MPLC con acetato de etilo/metanol como eluyente. La fracción deseada se purificó sobre RP18 por HPLC con acetonitrilo/agua como eluyente. Después de purificar, se obtuvieron 17,0 mg (33,9 % del teórico).

logP[a]: 0,46; logP[n]: 0,72;

RMN de ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz); δ = 3,41 (s, 3H), 3,96 (s, 3H), 5,22-5,23 (m, 2H), 6,54 (s, 1H), 6,68 (m, 1H), 7,43-7,46 (m, 1H), 7,88-7,89 (m, 1H), 8,47-8,48 (m, 1H), 8,52 (m, 1H) ppm.

Tabla 1

Compuestos de la fórmula (I-1)

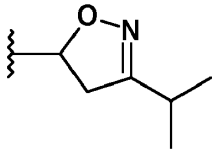
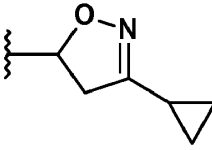
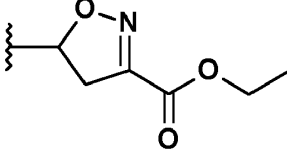
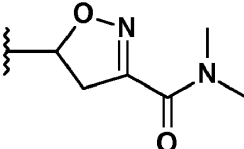
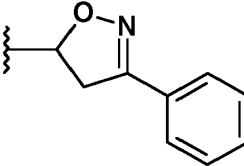
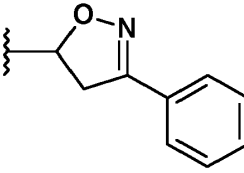
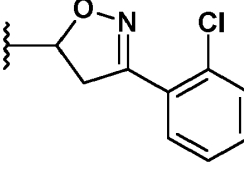


en la que T representa un par de electrones libres y los demás sustituyentes, que tienen los significados indicados en la tabla:

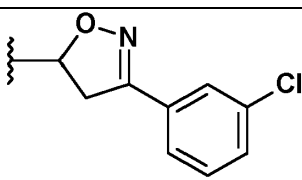
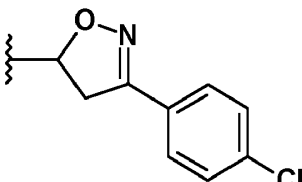
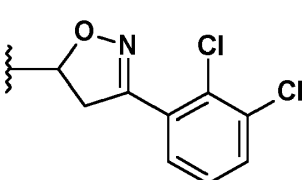
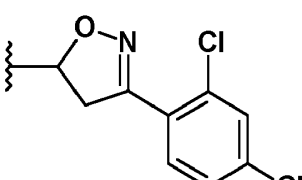
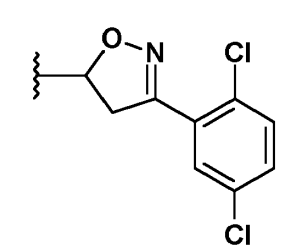
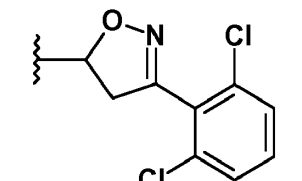
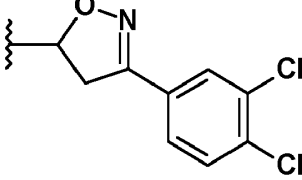
Tabla 2

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-1		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-2		H	CH ₃	CH ₃	H

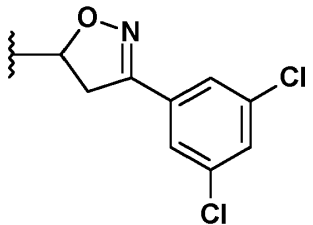
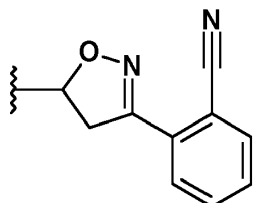
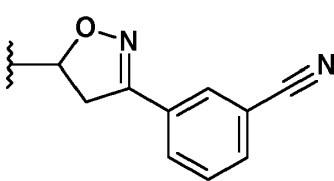
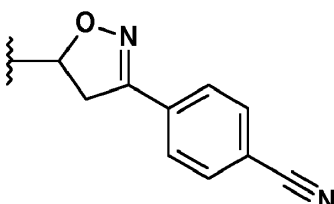
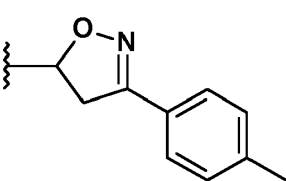
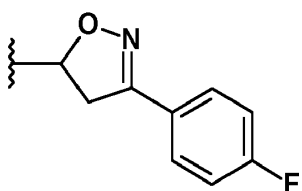
(continuación)

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-3		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-4		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-5		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-6		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-7		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-8		H	CH ₃	etilo	H
I-1-9		H	CH ₃	CH ₃	H

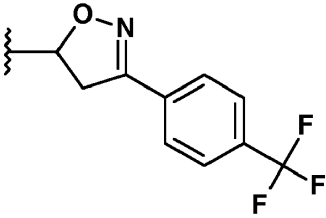
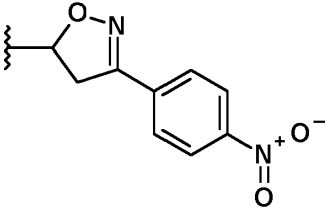
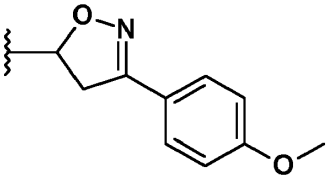
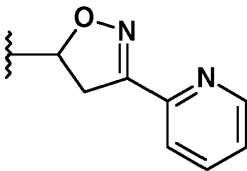
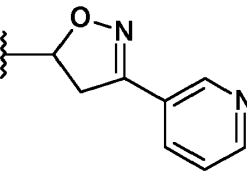
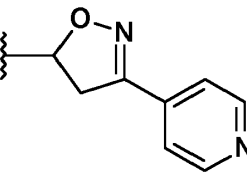
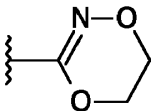
(continuación)

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-10		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-11		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-12		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-13		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-14		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-15		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-16		H	CH ₃	CH ₃	H

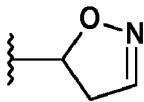
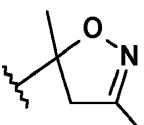
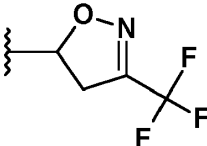
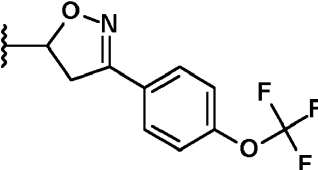
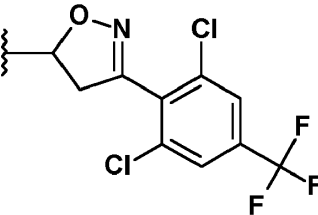
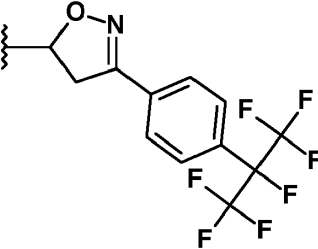
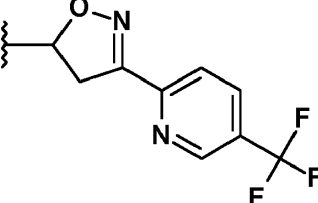
(continuación)

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-17		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-18		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-19		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-20		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-21		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-22		H	CH ₃	CH ₃	H

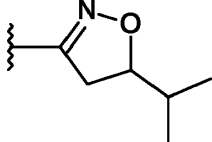
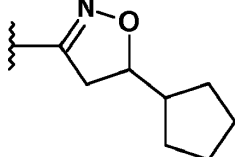
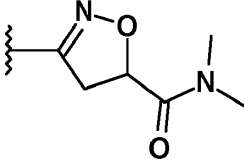
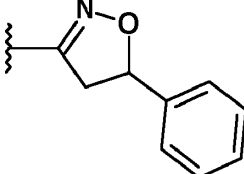
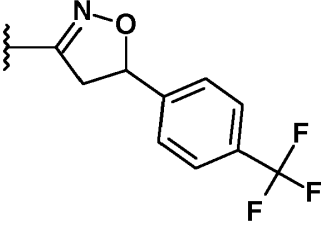
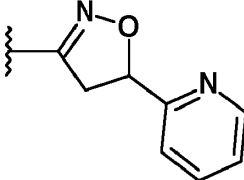
(continuación)

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-23		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-24		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-25		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-26		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-27		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-28		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-29		H	CH ₃	CH ₃	H

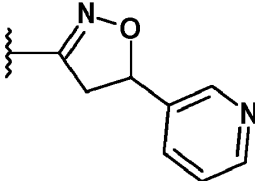
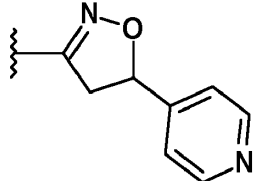
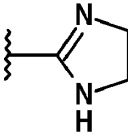
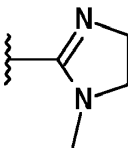
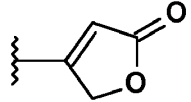
(continuación)

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-30		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-31		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-32		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-33		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-34		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-35		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-36		H	CH ₃	CH ₃	H

(continuación)

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-37		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-38		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-39		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-40		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-41		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-42		H	CH ₃	CH ₃	H

(continuación)

Ejemplo n.º	X	W	Y	A	V
I-1-43		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-44		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-45		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-46		H	CH ₃	CH ₃	H
I-1-47		H	CH ₃	CH ₃	H

Datos analíticos de los compuestos indicados en la tabla 1

Los datos de RMN de ¹H de ejemplos seleccionados están escritos en forma de listas de picos de RMN de ¹H. El valor de δ en ppm y la intensidad de las señales se enumeran para cada pico de señal entre paréntesis. Los pares de valor de δ -intensidad de señal para diferentes picos de señales se enumeran con separación entre sí por punto y coma.

5

La lista de picos de un ejemplo tiene, por ende, la forma:

δ_1 (intensidad₁); δ_2 (intensidad₂);.....; δ_i (intensidad_i);.....; δ_n (intensidad_n)

La intensidad de señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones actuales de intensidades de señales. De señales amplias, se pueden mostrar varios picos o el medio de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

10

Para la calibración del desplazamiento químico de los espectros de RMN de ¹H, se han usado tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente, en particular en el caso de espectros medidos en DMSO. En consecuencia, el pico de tetrametilsilano se puede producir, pero no necesariamente, en listas de picos de RMN.

15

Las listas de picos de RMN de ¹H son similares a impresiones convencionales de RMN de ¹H y, por ende, contienen usualmente todos los picos que se enumeran en la interpretación clásica de RMN.

Adicionalmente, pueden mostrar como señales de disolventes de impresiones clásicas de RMN de ^1H , estereoisómeros de los compuestos objeto que también son objeto de la invención, y/o picos de impurezas.

5 Para mostrar las señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o agua, los picos habituales de disolventes, por ejemplo, nuestras listas de picos de RMN de ^1H muestran los picos de disolventes habituales, por ejemplo, picos de DMSO en DMSO- D^6 y el pico de agua que usualmente tienen en promedio una elevada intensidad.

Los picos de estereoisómeros de los compuestos objeto y/o picos de impurezas tienen usualmente en promedio una menor intensidad que los picos de compuestos objeto (por ejemplo, con una pureza > 90 %).

10 Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del proceso de preparación específico. Por ende, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación por medio de "huellas de subproductos".

15 Un experto, quien calcula los picos de los compuestos objeto con métodos conocidos (MestreC, ACD-simulation, pero también con valores esperados evaluados empíricamente) puede aislar los picos de los compuestos objeto de ser necesario opcionalmente usando filtros adicionales de intensidad. Este aislamiento será similar a la recolección relevante de picos en la interpretación convencional de RMN de ^1H .

Otros detalles de las listas de picos de RMN de ^1H pueden hallarse en la Base de Datos de la Descripción de Búsqueda Número 564025.

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ^1H ; δ (ppm)
I-1-1	0,76	0,27	Ejemplo I-1-1: RMN de ^1H (400,0 MHz, DMSO- d^6): δ =8,502 (2,2); 8,496 (2,2); 8,473 (1,5); 8,469 (1,6); 8,461 (1,7); 8,458 (1,7); 7,862 (0,8); 7,859 (1,0); 7,856 (0,9); 7,852 (0,9); 7,842 (1,0); 7,838 (1,1); 7,836 (1,1); 7,832 (0,9); 7,453 (1,2); 7,441 (1,2); 7,432 (1,1); 7,421 (1,1); 6,190 (2,7); 5,757 (3,5); 5,709 (1,1); 5,691 (1,3); 5,682 (1,3); 5,664 (1,1); 3,803 (16,0); 3,683 (0,3); 3,658 (0,6); 3,639 (0,6); 3,615 (0,8); 3,597 (0,8); 3,376 (15,1); 3,356 (0,4); 3,324 (8,9); 3,270 (0,7); 3,243 (0,8); 3,241 (0,7); 3,228 (0,6); 3,226 (0,6); 3,198 (0,7); 2,510 (5,5); 2,506 (11,4); 2,501 (15,0); 2,497 (10,6); 2,492 (5,0); 1,989 (0,7); 1,936 (10,1); 1,174 (0,3); 0,000 (3,5)
I-1-2	1,09	0,71	Ejemplo I-1-2: RMN de ^1H (400,0 MHz, DMSO- d^6): δ =8,502 (2,6); 8,496 (2,7); 8,473 (1,7); 8,470 (1,9); 8,461 (1,8); 8,458 (1,9); 7,863 (0,9); 7,857 (1,1); 7,853 (1,0); 7,842 (1,0); 7,837 (1,3); 7,833 (1,1); 7,453 (1,4); 7,441 (1,4); 7,432 (1,4); 7,420 (1,3); 6,191 (3,1); 5,756 (1,1); 5,707 (1,2); 5,688 (1,3); 5,680 (1,4); 5,661 (1,2); 3,803 (16,0); 3,789 (0,5); 3,683 (0,5); 3,670 (0,9); 3,651 (0,8); 3,627 (1,1); 3,609 (1,0); 3,376 (15,4); 3,356 (0,6); 3,321 (10,5); 3,269 (1,0); 3,241 (1,1); 3,226 (0,9); 3,199 (0,9); 2,505 (18,0); 2,501 (24,2); 2,497 (18,4); 2,356 (0,9); 2,337 (2,9); 2,318 (3,0); 2,300 (1,1); 1,090 (4,3); 1,071 (8,6); 1,053 (4,1); 0,000 (2,2)
I-1-3	1,34	1,08	Ejemplo I-1-3: RMN de ^1H (400,0 MHz, DMSO- d^6): δ =8,503 (2,3); 8,497 (2,4); 8,475 (1,6); 8,471 (1,8); 8,463 (1,8); 8,459 (1,8); 7,864 (0,9); 7,860 (1,1); 7,857 (1,0); 7,854 (0,9); 7,843 (1,0); 7,840 (1,2); 7,837 (1,2); 7,833 (1,0); 7,455 (1,2); 7,443 (1,3); 7,434 (1,2); 7,422 (1,1); 6,195 (2,9); 5,757 (1,2); 5,706 (1,1); 5,687 (1,3); 5,679 (1,3); 5,660 (1,2); 3,802 (16,0); 3,684 (1,0); 3,665 (0,9); 3,641 (1,1); 3,623 (1,1); 3,376 (15,1); 3,321 (10,4); 3,271 (1,0); 3,243 (1,1); 3,228 (0,9); 3,201 (0,9); 2,706 (0,3); 2,689 (0,9); 2,671 (1,3); 2,654 (0,9); 2,637 (0,4); 2,510 (7,9); 2,506 (16,4); 2,501 (21,6); 2,497 (15,6); 1,989 (0,6); 1,111 (15,5); 1,094 (15,0); 0,000 (3,7)
I-1-4	1,15	0,85	Ejemplo I-1-4: RMN de ^1H (400,0 MHz, DMSO- d^6): δ =8,499 (2,9); 8,493 (2,9); 8,472 (2,0); 8,460 (2,0); 7,856 (1,3); 7,835 (1,4); 7,453 (1,6); 7,441 (1,5); 7,432 (1,5); 7,421 (1,3); 6,186 (3,5); 5,757 (1,7); 5,691 (1,2); 5,673 (1,4); 5,664 (1,4); 5,646 (1,3); 3,792 (16,0); 3,462 (1,1); 3,444 (1,1); 3,420 (1,4); 3,402 (1,4); 3,375 (15,8); 3,322 (13,7); 3,107 (1,6); 3,081 (1,4); 3,065 (1,2); 3,039 (1,1); 2,502 (35,6); 1,990 (0,4); 1,825 (0,3); 1,813 (0,7); 1,804 (0,8); 1,792 (1,3); 1,780 (0,8); 1,771 (0,7); 1,759 (0,4); 0,882 (0,4); 0,869 (2,2); 0,862 (2,6); 0,848 (2,3); 0,842 (2,5); 0,828 (0,6); 0,814 (0,4); 0,801 (0,5); 0,789 (0,6); 0,764 (1,6); 0,752 (2,1); 0,746 (1,9); 0,732 (1,5); 0,722 (0,5); 0,709 (0,4); 0,001 (5,1); 0,000 (5,2)

ES 2 858 093 T3

(continuación)

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ¹ H; δ (ppm)
I-1-6	0,97	0,77	Ejemplo I-1-6: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,515 (2,2); 8,509 (2,2); 8,479 (1,6); 8,467 (1,6); 7,875 (0,9); 7,872 (1,1); 7,868 (0,9); 7,854 (1,0); 7,852 (1,2); 7,848 (1,0); 7,462 (1,2); 7,450 (1,2); 7,4 41 (1,2); 7,429 (1,1); 6,243 (2,6); 5,948 (1,0); 5,929 (1,2); 5,920 (1,2); 5,902 (1,1); 3,928 (1,1); 3,910 (1,1); 3,885 (1,3); 3,867 (1,4); 3,846 (15,2); 3,570 (1,2); 3 ,542 (1,3); 3,527 (1,0); 3,499 (0,9); 3,389 (14,1); 3,341 (39,6); 3,076 (0,5); 3,0 64 (16,0); 3,051 (0,4); 2,936 (13,8); 2,549 (10,6); 2,548 (10,4); 2,513 (17,9); 2, 509 (23,5); 2,506 (18,0); 2,082 (0,7); 1,243 (0,5)
I-1-7	1,72	1,45	Ejemplo I-1-7: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,511 (2,5); 8,505 (2,5); 8,464 (1,8); 8,461 (1,9); 8,452 (1,9); 8,449 (1,8); 7,868 (1,0); 7,864 (1,2); 7,862 (1,1); 7,858 (1,0); 7,847 (1,1); 7,844 (1,2); 7,8 41 (1,2); 7,837 (1,0); 7,712 (1,9); 7,707 (2,4); 7,699 (2,2); 7,688 (2,4); 7,471 (4, 9); 7,466 (4,9); 7,458 (2,9); 7,454 (2,8); 7,447 (1,9); 7,435 (1,5); 7,427 (1,3); 7, 4 15 (1,2); 6,202 (3,0); 5,995 (1,1); 5,977 (1,3); 5,967 (1,3); 5,950 (1,2); 5,753 (5,2); 4,109 (1,0); 4,091 (1,1); 4,067 (1,3); 4,049 (1,3); 3,871 (16,0); 3,740 (1,2) ; 3,713 (1,4); 3,698 (1,1); 3,671 (1,0); 3,385 (15,0); 3,320 (16,0); 2,506 (20,5); 2,502 (27,3); 2,497 (20,7); 1,988 (0,4); 1,236 (1,2); 0,008 (1,3); 0,000 (28,3); - 0,008 (1,2)
I-1-8	1,92	1,74	Ejemplo I-1-8: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,484 (1,4); 8,481 (1,5); 8,470 (3,2); 8,465 (2,2); 7,850 (0,8); 7,846 (1,0); 7,844 (1,0); 7,840 (0,8); 7,830 (0,9); 7,826 (1,1); 7,824 (1,1); 7,820 (0,9); 7,7 08 (1,7); 7,703 (2,1); 7,694 (1,9); 7,692 (1,8); 7,684 (2,2); 7,470 (4,4); 7,465 (4, 4); 7,457 (3,6); 7,452 (2,6); 7,446 (1,7); 7,441 (1,1); 7,438 (1,3); 7,426 (1,1); 6, 144 (2,9); 5,985 (1,0); 5,968 (1,1); 5,958 (1,2); 5,940 (1,0); 5,756 (2,1); 4,097 (0,9); 4,079 (0,9); 4,055 (1,2); 4,037 (1,3); 4,021 (0,4); 3,887 (0,9); 3,867 (16,0) ; 3,852 (2,8); 3,834 (0,9); 3,733 (1,1); 3,705 (1,2); 3,690 (1,1); 3,663 (0,9); 3,32 3 (7,6); 2,506 (20,7); 2,502 (27,4); 2,497 (20,0); 1,989 (1,4); 1,193 (0,4); 1,175 (0,8); 1,157 (0,4); 1,127 (3,1); 1,110 (6,9); 1,092 (3,0); 0,008 (0,4); 0,000 (10,0); -0,008 (0,5)
I-1-9	1,95	1,69	Ejemplo I-1-9: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,522 (2,2); 8,517 (2,3); 8,477 (1,6); 8,473 (1,8); 8,465 (1,8); 8,461 (1,7); 7,880 (0,9); 7,876 (1,1); 7,873 (1,0); 7,870 (0,9); 7,859 (1,0); 7,856 (1,1); 7,8 53 (1,2); 7,849 (1,0); 7,642 (1,3); 7,637 (1,4); 7,623 (1,7); 7,618 (1,7); 7,590 (1, 2); 7,587 (1,4); 7,570 (1,9); 7,567 (2,1); 7,512 (0,8); 7,508 (0,9); 7,494 (1,6); 7, 4 89 (1,5); 7,474 (1,1); 7,469 (1,0); 7,459 (1,3); 7,457 (1,2); 7,450 (1,6); 7,447 (2,5); 7,439 (1,3); 7,437 (1,2); 7,431 (1,8); 7,428 (2,4); 7,413 (0,7); 7,409 (0,6); 6,236 (2,6); 6,018 (1,1); 5,999 (1,3); 5,991 (1,3); 5,971 (1,1); 5,758 (4,1); 4,19 4 (1,1); 4,174 (1,1); 4,151 (1,3); 4,132 (1,3); 3,877 (16,0); 3,805 (1,2); 3,778 (1, 4); 3,763 (1,2); 3,736 (1,0); 3,390 (14,8); 3,324 (6,6); 2,511 (8,0); 2,507 (16,8); 2,502 (22,2); 2,498 (16,0); 2,493 (7,7); 1,989 (0,6); 1,175 (0,3); 0,000 (5,2)
I-1-10	2,10	1,88	Ejemplo I-1-10: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,517 (2,4); 8,511 (2,4); 8,472 (1,6); 8,469 (1,6); 8,460 (1,7); 7,873 (1,1); 7,853 (1,2); 7,737 (2,8); 7,694 (1,4); 7,675 (1,7); 7,566 (0,9); 7,545 (1,8); 7,5 19 (2,0); 7,500 (2,4); 7,480 (1,0); 7,456 (1,3); 7,444 (1,3); 7,436 (1,2); 7,424 (1, 2); 6,212 (2,9); 6,040 (1,0); 6,023 (1,2); 6,013 (1,2); 5,995 (1,1); 4,109 (1,0); 4, 091 (1,0); 4,066 (1,2); 4,049 (1,3); 3,873 (16,0); 3,761 (1,2); 3,733 (1,3); 3,718 (1,0); 3,691 (0,9); 3,391 (15,2); 3,338 (97,1); 2,548 (18,4); 2,513 (41,7); 2,509 (53,9); 2,505 (38,8); 2,081 (2,5); 1,306 (0,4); 1,265 (0,5); 1,256 (0,4); 1,242 (1, 1)
I-1-11	2,12	1,97	Ejemplo I-1-11: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,509 (2,3); 8,502 (2,4); 8,464 (1,7); 8,461 (1,8); 8,452 (1,8); 8,449 (1,7); 8,316 (0,3); 7,869 (0,9); 7,865 (1,0); 7,862 (1,0); 7,859 (0,9); 7,848 (1,0); 7,8 45 (1,1); 7,842 (1,1); 7,838 (1,0); 7,736 (0,5); 7,730 (3,8); 7,725 (1,3); 7,713 (1, 4); 7,708 (4,8); 7,703 (0,7); 7,547 (0,6); 7,541 (5,0); 7,536 (1,5); 7,524 (1,3); 7, 5 19 (3,9); 7,513 (0,5); 7,448 (1,3); 7,436 (1,3); 7,427 (1,2); 7,416 (1,1); 6,202 (2,7); 6,015 (1,0); 5,998 (1,2); 5,988 (1,3); 5,970 (1,1); 4,092 (1,0); 4,074 (1,0); 4,050 (1,2); 4,032 (1,2); 3,864 (16,0); 3,738 (1,1); 3,711 (1,3); 3,696 (1,1); 3,6 68 (0,9); 3,382 (14,9); 3,319 (39,9); 2,675 (0,5); 2,670 (0,6); 2,666 (0,4); 2,524 (1,4); 2,519 (2,2); 2,510 (38,0); 2,506 (79,4); 2,501 (105,8); 2,497 (75,8); 2,49 2 (36,6); 2,332 (0,4); 2,328 (0,6); 2,323 (0,5); 1,351 (0,4); 1,233 (0,7); 0,000 (1 0,2); -0,009 (0,4)

ES 2 858 093 T3

(continuación)

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ¹ H; δ (ppm)
I-1-12	2,25	2,07	Ejemplo I-1-12: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,520 (2,7); 8,515 (2,6); 8,478 (1,9); 8,474 (1,9); 8,466 (2,0); 7,880 (1,2); 7,877 (1,3); 7,860 (1,2); 7,856 (1,4); 7,784 (1,8); 7,781 (1,7); 7,764 (2,1); 7,7 61 (1,9); 7,597 (1,7); 7,593 (1,5); 7,577 (2,3); 7,573 (2,0); 7,478 (1,9); 7,459 (4, 2); 7,448 (1,6); 7,439 (2,6); 7,428 (1,3); 6,243 (2,9); 6,045 (1,1); 6,025 (1,4); 6, 018 (1,4); 5,999 (1,2); 4,178 (1,1); 4,159 (1,1); 4,136 (1,4); 4,117 (1,3); 3,875 (16,0); 3,807 (1,3); 3,779 (1,4); 3,764 (1,2); 3,737 (1,0); 3,390 (15,2); 3,337 (58 ,0); 3,333 (70,4); 3,327 (121,4); 2,855 (0,3); 2,712 (0,7); 2,671 (0,7); 2,667 (0, 6); 2,541 (164,9); 2,506 (98,0); 2,502 (115,2); 2,498 (81,2); 2,368 (0,7); 2,329 (0,7); 1,235 (0,4); 0,000 (4,3)
I-1-13	2,41	2,23	Ejemplo I-1-13: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,517 (2,4); 8,511 (2,5); 8,474 (1,7); 8,471 (1,7); 8,463 (1,8); 8,459 (1,7); 7,877 (0,9); 7,873 (1,1); 7,871 (1,0); 7,867 (0,9); 7,857 (1,0); 7,853 (1,2); 7,8 50 (1,2); 7,847 (1,0); 7,772 (3,2); 7,767 (3,3); 7,677 (2,6); 7,656 (3,5); 7,542 (2, 0); 7,537 (1,9); 7,521 (1,5); 7,515 (1,5); 7,457 (1,3); 7,445 (1,4); 7,436 (1,3); 7, 425 (1,2); 6,232 (2,8); 6,026 (1,1); 6,008 (1,3); 5,999 (1,3); 5,980 (1,2); 4,181 (1,1); 4,162 (1,1); 4,138 (1,3); 4,120 (1,3); 4,056 (0,5); 4,038 (1,5); 4,020 (1,5); 4,002 (0,5); 3,870 (16,0); 3,802 (1,3); 3,774 (1,4); 3,759 (1,2); 3,732 (1,0); 3,3 87 (14,9); 3,319 (15,9); 2,670 (0,4); 2,524 (1,0); 2,506 (54,4); 2,501 (70,9); 2,4 97 (51,0); 2,328 (0,4); 1,989 (6,5); 1,192 (1,7); 1,175 (3,3); 1,157 (1,6); 0,000 (8,0)
I-1-14	2,32	2,13	Ejemplo I-1-14: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=12,546 (0,4); 8,518 (1,8); 8,513 (1,9); 8,474 (1,4); 8,463 (1,4); 7,879 (0, 8); 7,875 (1,1); 7,869 (0,9); 7,858 (0,9); 7,852 (1,2); 7,849 (1,0); 7,701 (2,8); 7, 695 (3,2); 7,632 (1,6); 7,610 (4,0); 7,585 (2,4); 7,578 (2,2); 7,563 (1,4); 7,557 (1,0); 7,532 (0,3); 7,459 (1,2); 7,447 (1,2); 7,438 (1,2); 7,426 (1,1); 6,242 (2,6); 6,038 (1,1); 6,019 (1,2); 6,011 (1,3); 5,992 (1,1); 4,192 (1,1); 4,173 (1,1); 4,14 9 (1,3); 4,130 (1,3); 3,873 (16,0); 3,817 (1,2); 3,790 (1,3); 3,775 (1,1); 3,747 (1, 0); 3,390 (14,9); 3,337 (29,2); 3,332 (48,1); 2,712 (0,4); 2,542 (97,8); 2,507 (3 1,5); 2,503 (42,3); 2,498 (31,9); 2,368 (0,4); 0,000 (1,8)
I-1-15	2,10	1,87	Ejemplo I-1-15: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,532 (2,3); 8,526 (2,3); 8,484 (1,6); 8,481 (1,8); 8,472 (1,7); 8,469 (1,8); 7,887 (0,8); 7,884 (1,0); 7,881 (1,0); 7,877 (0,9); 7,867 (1,0); 7,863 (1,1); 7,8 61 (1,1); 7,857 (1,0); 7,624 (2,6); 7,621 (3,1); 7,602 (6,3); 7,553 (2,8); 7,535 (1, 8); 7,530 (1,5); 7,513 (1,1); 7,464 (1,2); 7,452 (1,2); 7,445 (1,2); 7,444 (1,2); 7, 432 (1,1); 6,283 (2,6); 6,090 (1,1); 6,067 (1,3); 6,062 (1,4); 6,040 (1,1); 5,758 (8,7); 4,123 (1,1); 4,100 (1,1); 4,079 (1,3); 4,057 (1,5); 4,039 (0,7); 4,021 (0,7); 3,889 (16,0); 3,602 (1,2); 3,574 (1,4); 3,559 (1,2); 3,531 (1,0); 3,397 (14,9); 3, 324 (5,8); 2,520 (0,4); 2,512 (6,5); 2,507 (13,9); 2,503 (18,7); 2,498 (13,5); 2,4 94 (6,5); 1,990 (2,9); 1,193 (0,8); 1,175 (1,5); 1,157 (0,7); 0,000 (4,9)
I-1-16	2,48	2,27	Ejemplo I-1-16: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,509 (2,4); 8,503 (2,5); 8,466 (1,7); 8,462 (1,6); 8,454 (1,8); 8,451 (1,6); 7,924 (3,0); 7,920 (2,9); 7,870 (0,9); 7,866 (1,1); 7,860 (0,8); 7,849 (1,0); 7,8 46 (1,2); 7,745 (1,1); 7,724 (4,3); 7,711 (2,6); 7,707 (2,3); 7,690 (0,7); 7,686 (0, 7); 7,450 (1,3); 7,438 (1,3); 7,429 (1,2); 7,418 (1,2); 6,207 (2,8); 6,051 (1,0); 6, 034 (1,2); 6,024 (1,2); 6,006 (1,0); 4,106 (1,0); 4,088 (1,0); 4,063 (1,2); 4,045 (1,2); 3,864 (16,0); 3,753 (1,1); 3,726 (1,3); 3,711 (1,0); 3,683 (0,9); 3,384 (15,1); 3,330 (47,9); 3,326 (39,3); 2,671 (0,4); 2,541 (47,8); 2,507 (48,7); 2,502 (6 1,9); 2,498 (43,4); 2,329 (0,4); 0,000 (2,5)
I-1-17	2,61	2,39	Ejemplo I-1-17: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,510 (2,7); 8,503 (2,8); 8,467 (1,8); 8,464 (1,9); 8,455 (2,0); 8,452 (1,9); 7,871 (1,0); 7,867 (1,2); 7,851 (1,1); 7,847 (1,4); 7,841 (1,0); 7,745 (2,9); 7,7 41 (3,8); 7,734 (9,3); 7,730 (4,9); 7,451 (1,4); 7,439 (1,5); 7,431 (1,4); 7,419 (1,3); 6,210 (3,0); 6,068 (1,1); 6,050 (1,3); 6,040 (1,3); 6,023 (1,1); 4,105 (1,0); 4, 087 (1,0); 4,062 (1,2); 4,044 (1,2); 3,863 (16,0); 3,756 (1,2); 3,729 (1,4); 3,714 (1,1); 3,686 (1,0); 3,384 (15,5); 3,332 (105,8); 3,327 (82,7); 2,712 (0,6); 2,672 (0,5); 2,542 (145,6); 2,525 (2,1); 2,507 (76,4); 2,502 (99,5); 2,498 (73,0); 2,36 8 (0,7); 2,329 (0,6); 1,236 (0,4); 0,000 (4,2)
I-1-18	1,55	1,34	Ejemplo I-1-18: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,524 (2,6); 8,518 (2,8); 8,472 (1,9); 8,468 (1,9); 8,460 (2,1); 8,457 (1,9); 7,968 (2,0); 7,949 (2,1); 7,875 (1,1); 7,871 (1,3); 7,865 (1,1); 7,854 (1,3); 7,8 51 (1,6); 7,848 (1,7); 7,844 (1,6); 7,823 (4,1); 7,808 (1,9); 7,788 (0,6); 7,785 (0, 5); 7,681 (1,1); 7,676 (1,0); 7,662 (1,5); 7,645 (0,8); 7,640 (0,7); 7,454 (1,4); 7, 442 (1,4); 7,434 (1,4); 7,422 (1,2); 6,231 (2,9); 6,090 (1,1); 6,071

ES 2 858 093 T3

(continuación)

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ¹ H; δ (ppm)
			(1,3); 6,063 (1,4); 6,044 (1,2); 4,225 (1,0); 4,207 (1,0); 4,183 (1,3); 4,165 (1,2); 3,889 (16,0); 3,853 (1,2); 3,825 (1,4); 3,810 (1,1); 3,783 (1,0); 3,391 (15,2); 3,341 (98,8); 3,339 (110,3); 2,713 (0,5); 2,542 (117,1); 2,507 (42,5); 2,503 (52,4); 2,499 (39,4); 2,369 (0,6); 2,330 (0,3); 0,000 (1,3)
I-1-20	1,62	1,42	Ejemplo I-1-20: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,508 (2,4); 8,503 (2,6); 8,461 (1,9); 8,449 (1,9); 7,944 (2,6); 7,923 (6,1); 7,891 (5,9); 7,869 (3,5); 7,843 (1,4); 7,447 (1,3); 7,435 (1,4); 7,427 (1,3); 7,415 (1,2); 6,208 (3,1); 6,081 (1,1); 6,064 (1,2); 6,054 (1,3); 6,036 (1,1); 4,126 (1,0); 4,108 (1,0); 4,084 (1,3); 4,066 (1,3); 3,872 (16,0); 3,780 (1,2); 3,752 (1,3); 3,737 (1,1); 3,710 (1,0); 3,383 (15,3); 3,330 (80,5); 2,711 (0,6); 2,672 (0,4); 2,542 (133,5); 2,506 (53,8); 2,502 (71,5); 2,499 (58,3); 2,368 (0,6); 2,330 (0,4); 0,000 (1,8)
I-1-21	1,95	1,75	Ejemplo I-1-21: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,517 (2,5); 8,511 (2,6); 8,470 (1,7); 8,467 (1,7); 8,458 (1,8); 8,455 (1,7); 7,869 (1,2); 7,849 (1,3); 7,603 (3,6); 7,582 (4,2); 7,454 (1,4); 7,442 (1,4); 7,433 (1,3); 7,421 (1,2); 7,284 (3,6); 7,264 (3,2); 6,203 (3,1); 5,969 (1,1); 5,952 (1,2); 5,942 (1,2); 5,924 (1,1); 4,087 (1,0); 4,069 (1,0); 4,045 (1,3); 4,027 (1,2); 3,870 (16,0); 3,715 (1,2); 3,688 (1,3); 3,673 (1,1); 3,646 (0,9); 3,389 (15,3); 3,345 (52,6); 2,548 (19,9); 2,513 (17,8); 2,509 (23,2); 2,505 (17,1); 2,346 (11,6); 2,081 (0,8); 1,241 (0,5)
I-1-22	1,82	1,55	Ejemplo I-1-22: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,509 (2,4); 8,503 (2,5); 8,464 (1,8); 8,461 (1,9); 8,452 (1,9); 8,449 (1,8); 7,869 (0,9); 7,865 (1,1); 7,859 (0,9); 7,848 (1,1); 7,845 (1,2); 7,838 (1,0); 7,777 (1,9); 7,763 (2,3); 7,755 (2,3); 7,746 (1,1); 7,741 (2,1); 7,448 (1,3); 7,436 (1,4); 7,428 (1,3); 7,416 (1,2); 7,325 (2,2); 7,303 (4,0); 7,281 (1,9); 6,198 (2,8); 5,997 (1,0); 5,979 (1,2); 5,970 (1,3); 5,952 (1,1); 4,098 (1,0); 4,081 (1,0); 4,056 (1,2); 4,038 (1,3); 3,864 (16,0); 3,737 (1,1); 3,710 (1,3); 3,695 (1,1); 3,668 (0,9); 3,383 (14,9); 3,320 (107,2); 2,861 (3,0); 2,675 (1,1); 2,670 (1,5); 2,580 (1,6); 2,567 (1,7); 2,506 (204,3); 2,501 (267,8); 2,497 (194,5); 2,328 (1,5); 2,323 (1,2); 1,237 (0,5); 0,146 (0,9); 0,008 (9,5); 0,000 (210,5); -0,008 (10,0); -0,150 (0,9)
I-1-23	2,37	2,18	Ejemplo I-1-23: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,512 (2,4); 8,506 (2,5); 8,465 (1,7); 8,462 (1,8); 8,453 (1,8); 8,450 (1,8); 7,931 (2,3); 7,910 (3,6); 7,872 (1,0); 7,869 (1,2); 7,866 (1,2); 7,862 (1,1); 7,852 (1,2); 7,848 (1,4); 7,846 (1,6); 7,837 (3,9); 7,816 (2,5); 7,448 (1,3); 7,437 (1,3); 7,429 (1,3); 7,417 (1,2); 6,210 (2,7); 6,073 (1,0); 6,056 (1,2); 6,046 (1,3); 6,028 (1,1); 5,756 (2,8); 4,145 (1,0); 4,127 (0,9); 4,102 (1,2); 4,084 (1,2); 4,048 (0,4); 3,877 (16,0); 3,796 (1,1); 3,768 (1,2); 3,753 (1,0); 3,726 (0,9); 3,407 (0,3); 3,402 (0,6); 3,385 (14,9); 3,321 (21,2); 2,671 (0,4); 2,666 (0,3); 2,506 (57,8); 2,502 (76,8); 2,497 (56,7); 2,333 (0,3); 2,329 (0,4); 2,324 (0,3); 1,989 (0,4); 1,235 (0,6); 0,008 (1,0); 0,000 (25,2); -0,008 (1,3)
I-1-24	1,84	1,64	Ejemplo I-1-24: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,512 (2,6); 8,506 (2,6); 8,465 (2,0); 8,462 (2,1); 8,453 (2,0); 8,450 (1,9); 8,309 (4,1); 8,287 (4,7); 7,981 (4,5); 7,959 (4,0); 7,872 (1,0); 7,869 (1,2); 7,863 (1,0); 7,852 (1,1); 7,848 (1,3); 7,846 (1,3); 7,842 (1,0); 7,448 (1,4); 7,436 (1,4); 7,428 (1,3); 7,417 (1,2); 6,216 (2,9); 6,111 (1,1); 6,094 (1,2); 6,084 (1,3); 6,066 (1,1); 5,756 (5,5); 4,162 (1,0); 4,144 (1,0); 4,119 (1,2); 4,102 (1,2); 3,881 (16,0); 3,821 (1,2); 3,793 (1,3); 3,778 (1,1); 3,750 (0,9); 3,684 (0,8); 3,386 (15,2); 3,356 (0,9); 3,322 (9,8); 2,671 (0,3); 2,506 (44,8); 2,502 (58,2); 2,498 (42,7); 2,329 (0,3); 1,989 (0,9); 1,235 (1,0); 1,175 (0,5); 0,867 (0,4); 0,008 (0,8); 0,000 (18,6)
I-1-25	1,74	1,46	Ejemplo I-1-25: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,509 (2,4); 8,503 (2,4); 8,475 (0,5); 8,463 (1,9); 8,451 (2,0); 8,316 (0,9); 7,902 (0,6); 7,878 (0,6); 7,864 (1,2); 7,842 (1,3); 7,821 (0,4); 7,645 (3,6); 7,623 (4,0); 7,447 (1,3); 7,435 (1,4); 7,428 (1,4); 7,416 (1,4); 7,074 (0,4); 7,018 (4,0); 6,996 (3,7); 6,191 (2,7); 5,938 (1,0); 5,919 (1,3); 5,910 (1,1); 5,892 (1,1); 4,071 (0,9); 4,054 (1,0); 4,029 (1,3); 4,011 (1,3); 3,895 (0,4); 3,859 (14,5); 3,832 (1,6); 3,824 (2,4); 3,798 (16,0); 3,765 (0,9); 3,735 (0,4); 3,695 (1,2); 3,683 (1,0); 3,668 (1,3); 3,653 (1,1); 3,625 (1,0); 3,582 (0,5); 3,430 (0,5); 3,382 (13,8); 3,351 (1,7); 3,320 (343,6); 3,260 (0,5); 3,249 (0,4); 2,670 (4,0); 2,506 (570,9); 2,501 (740,0); 2,497 (536,7); 2,364 (0,4); 2,328 (4,1); 2,299 (0,4); 1,791 (0,4); 1,324 (0,4); 1,299 (0,4); 1,259 (0,7); 1,235 (1,9); 1,170 (0,6); 1,161 (0,5); 0,866 (0,5); 0,146 (1,7);

ES 2 858 093 T3

(continuación)

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ¹ H; δ (ppm)
			0,008 (19,8); 0,000 (426,3); -0,008 (21,2); -0,150 (2,0); -3,205 (0,4)
I-1-26	1,27	1,01	Ejemplo I-1-26: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,670 (1,6); 8,658 (1,5); 8,518 (2,4); 8,512 (2,4); 8,470 (1,6); 8,460 (1,7); 7,923 (0,6); 7,904 (3,4); 7,883 (1,4); 7,873 (1,2); 7,869 (1,0); 7,853 (1,2); 7,4 95 (0,7); 7,491 (0,8); 7,479 (1,4); 7,457 (1,4); 7,445 (1,3); 7,437 (1,2); 7,425 (1, 2); 6,213 (2,8); 6,055 (1,0); 6,037 (1,2); 6,027 (1,2); 6,009 (1,1); 4,194 (1,1); 4, 177 (1,1); 4,151 (1,3); 4,133 (1,3); 3,884 (16,0); 3,763 (1,2); 3,735 (1,3); 3,719 (1,1); 3,691 (0,9); 3,390 (15,0); 3,337 (97,5); 2,549 (7,6); 2,513 (40,4); 2,509 (53,0); 2,505 (38,6); 2,082 (0,7); 1,306 (0,3); 1,266 (0,4); 1,256 (0,3); 1,242 (1, 1)
I-1-27	1,09	0,64	Ejemplo I-1-27: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,887 (2,2); 8,882 (2,2); 8,662 (1,4); 8,658 (1,5); 8,650 (1,5); 8,647 (1,5); 8,513 (2,3); 8,507 (2,3); 8,466 (1,7); 8,463 (1,8); 8,454 (1,7); 8,451 (1,7); 8,1 12 (0,9); 8,107 (1,4); 8,103 (0,9); 8,092 (0,9); 8,087 (1,5); 8,083 (0,9); 7,872 (0, 9); 7,868 (1,1); 7,866 (1,1); 7,862 (0,9); 7,852 (1,0); 7,848 (1,2); 7,846 (1,2); 7, 842 (1,0); 7,512 (1,2); 7,500 (1,2); 7,492 (1,2); 7,480 (1,1); 7,449 (1,4); 7,437 (1,4); 7,429 (1,3); 7,417 (1,2); 6,211 (2,7); 6,048 (1,1); 6,030 (1,3); 6,020 (1,3); 6,003 (1,1); 5,757 (0,7); 4,142 (1,0); 4,124 (1,0); 4,099 (1,3); 4,082 (1,2); 3,87 5 (16,0); 3,843 (0,4); 3,788 (1,2); 3,761 (1,3); 3,746 (1,1); 3,718 (1,0); 3,688 (0, 6); 3,386 (15,2); 3,358 (0,8); 3,323 (6,9); 2,524 (0,6); 2,506 (36,2); 2,502 (48,3); 2,497 (35,1); 0,008 (1,2); 0,000 (40,0); -0,008 (1,7)
I-1-28	1,11	0,54	Ejemplo I-1-28: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,687 (3,3); 8,672 (3,4); 8,517 (2,2); 8,511 (2,3); 8,472 (1,6); 8,469 (1,6); 8,460 (1,7); 8,457 (1,6); 7,873 (1,0); 7,853 (1,1); 7,660 (3,8); 7,657 (2,4); 7,6 45 (3,7); 7,455 (1,2); 7,444 (1,3); 7,435 (1,2); 7,423 (1,2); 6,221 (2,6); 6,099 (1, 0); 6,082 (1,1); 6,072 (1,2); 6,054 (1,1); 4,120 (1,0); 4,102 (1,0); 4,077 (1,2); 4, 059 (1,2); 3,881 (16,0); 3,769 (1,1); 3,741 (1,3); 3,726 (1,0); 3,698 (0,9); 3,690 (0,3); 3,391 (15,0); 3,363 (0,7); 3,338 (67,4); 2,572 (0,5); 2,548 (18,4); 2,531 (0,6); 2,513 (34,5); 2,509 (45,7); 2,505 (33,1); 2,081 (1,2); 1,265 (0,4); 1,242 (0, 9)
I-1-30	0,57	0,10	Ejemplo I-1-30: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5024 (2,1); 8,4963 (2,2); 8,4715 (1,5); 8,4680 (1,7); 8,4597 (1,6); 8,4562 (1,6); 7,8633 (0,8); 7,8596 (1,0); 7,8570 (1,0); 7,8533 (0,9); 7,8430 (0,9); 7,839 2 (1,0); 7,8367 (1,1); 7,8329 (0,9); 7,4936 (2,5); 7,4511 (1,2); 7,4391 (1,2); 7,4 308 (1,1); 7,4189 (1,0); 6,1915 (2,6); 5,6996 (0,9); 5,6815 (1,0); 5,6717 (1,1); 5,6537 (1,0); 3,8226 (16,0); 3,7210 (0,6); 3,7164 (0,6); 3,7029 (0,6); 3,6982 (0,6); 3,6770 (0,7); 3,6722 (0,7); 3,6590 (0,7); 3,6542 (0,7); 3,3773 (15,1); 3,320 8 (29,9); 3,2962 (0,8); 3,2919 (0,8); 3,2684 (0,8); 3,2640 (0,8); 3,2521 (0,7); 3. 2479 (0,7); 3,2243 (0,6); 3,2200 (0,6); 2,5232 (1,0); 2,5099 (18,8); 2,5056 (37. 8); 2,5011 (50,4); 2,4966 (37,8); 2,4923 (19,4); 1,2358 (0,5); 0,0079 (1,2); -0,0002 (31,9); -0,0084 (1,4)
I-1-31	0,96	0,53	Ejemplo I-1-31: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,4846 (2,2); 8,4785 (2,2); 8,4642 (1,5); 8,4608 (1,7); 8,4524 (1,6); 8,4489 (1,6); 7,8491 (0,8); 7,8454 (1,0); 7,8429 (1,0); 7,8391 (0,9); 7,8288 (0,9); 7,825 2 (1,0); 7,8226 (1,1); 7,8188 (0,9); 7,4494 (1,2); 7,4382 (1,2); 7,4291 (1,1); 7,4 173 (1,0); 6,2085 (3,0); 5,7556 (0,5); 3,7988 (16,0); 3,7780 (1,3); 3,7338 (1,4) ; 3,3739 (15,3); 3,3218 (106,3); 3,0209 (1,5); 2,9766 (1,3); 2,6748 (0,5); 2,670 5 (0,7); 2,6661 (0,5); 2,5235 (2,3); 2,5101 (43,2); 2,5059 (87,3); 2,5014 (115,7); 2,4970 (85,6); 2,3326 (0,5); 2,3281 (0,7); 2,3236 (0,5); 1,9308 (10,4); 1,580 8 (12,6); 0,0079 (1,2); -0,0002 (31,7); -0,0083 (1,4)
I-1-32	1,59	1,45	Ejemplo I-1-32: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5090 (2,0); 8,5029 (2,0); 8,4774 (1,4); 8,4738 (1,6); 8,4655 (1,6); 8,4619 (1,6); 7,8761 (0,8); 7,8723 (0,9); 7,8697 (0,9); 7,8659 (0,8); 7,8558 (0,9); 7,852 0 (1,0); 7,8493 (1,0); 7,8455 (0,9); 7,4570 (1,1); 7,4451 (1,1); 7,4367 (1,0); 7,4 248 (1,0); 6,2717 (2,0); 6,2549 (1,0); 6,2367 (1,0); 6,2266 (1,0); 6,2085 (0,9); 5,7559 (1,2); 3,9506 (0,4); 3,9474 (0,5); 3,9325 (0,5); 3,9294 (0,5); 3,9067 (0. 6); 3,9037 (0,6); 3,8889 (0,6); 3,8858 (0,6); 3,8463 (16,0); 3,8276 (0,8); 3,704 7 (0,6); 3,7012 (0,6); 3,6764 (0,6); 3,6727 (0,6); 3,6610 (0,4); 3,6572 (0,4); 3,6 328 (0,4); 3,6292 (0,4); 3,3923 (1,1); 3,3842 (14,7); 3,3238 (68,5); 2,6749 (0,5); 2,6705 (0,7); 2,6659 (0,5); 2,5238 (1,9); 2,5104 (41,2); 2,5059 (86,2); 2,501 4 (116,2); 2,4969 (85,2); 2,4925 (42,2); 2,3326 (0,5); 2,3281

ES 2 858 093 T3

(continuación)

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ¹ H; δ (ppm)
			(0,7); 2,3237 (0,5); -0,0002 (8,6); -0,0084 (0,3)
I-1-33	2,42	2,28	Ejemplo I-1-33: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5098 (2,5); 8,5037 (2,6); 8,4641 (1,9); 8,4607 (1,9); 8,4522 (1,9); 8,4489 (1,8); 7,9997 (1,1); 7,9791 (1,2); 7,8698 (1,0); 7,8660 (1,3); 7,8599 (1,1); 7,844 8 (5,1); 7,8226 (4,4); 7,4693 (3,0); 7,4486 (4,1); 7,4363 (1,6); 7,4279 (1,4); 7,4 160 (1,3); 7,2918 (1,0); 7,2713 (0,9); 6,2018 (2,9); 6,0307 (1,0); 6,0131 (1,2); 6,0031 (1,3); 5,9855 (1,1); 5,7555 (4,6); 4,1139 (1,0); 4,0962 (1,0); 4,0713 (1. 3); 4,0541 (1,3); 3,8683 (16,0); 3,7580 (1,2); 3,7305 (1,4); 3,7157 (1,1); 3,687 9 (1,0); 3,3835 (15,2); 3,3556 (0,7); 3,3201 (34,7); 2,6704 (1,1); 2,5647 (0,6); 2,5057 (142,4); 2,5014 (180,8); 2,4970 (130,8); 2,3325 (0,8); 2,3285 (1,0); 1. 8884 (0,3); 1,2351 (1,4); 0,1460 (0,7); 0,0078 (7,2); -0,0002 (162,5); -0,0084 (7,3); -0,1495 (0,7)
I-1-34	2,75	2,66	Ejemplo I-1-34: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5295 (2,1); 8,5237 (2,1); 8,4799 (1,6); 8,4681 (1,6); 8,1025 (8,8); 8,0205 (0,4); 7,8883 (1,0); 7,8844 (1,2); 7,8822 (1,2); 7,8784 (1,0); 7,8678 (1,1); 7,864 2 (1,3); 7,8618 (1,3); 7,8580 (1,0); 7,4653 (1,3); 7,4532 (1,3); 7,4455 (1,2); 7,4 332 (1,2); 6,2844 (2,8); 6,1327 (1,1); 6,1105 (1,4); 6,1054 (1,4); 6,0828 (1,2); 5,7552 (9,1); 4,1455 (1,1); 4,1232 (1,1); 4,1018 (1,3); 4,0797 (1,2); 3,8894 (16. 0); 3,8126 (0,4); 3,6378 (1,2); 3,6098 (1,4); 3,5939 (1,2); 3,5661 (1,0); 3,3966 (15,2); 3,3832 (0,6); 3,3730 (0,3); 3,3189 (70,7); 2,6747 (0,7); 2,6707 (0,9); 2. 5648 (1,6); 2,5059 (114,3); 2,5015 (148,5); 2,4971 (109,2); 2,3283 (0,9); 2,32 40 (0,7); 1,9884 (1,3); 1,2353 (1,0); 1,1927 (0,4); 1,1749 (0,7); 1,1569 (0,4); 0. 1460 (0,6); 0,0076 (5,7); -0,0002 (136,0); -0,0083 (6,2); -0,1497 (0,6)
I-1-35	3,08	3,01	Ejemplo I-1-35: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5134 (2,5); 8,5074 (2,6); 8,4652 (1,7); 8,4624 (1,8); 8,4535 (1,8); 8,4505 (1,8); 8,1604 (1,2); 8,1396 (1,3); 7,9707 (3,2); 7,9496 (4,0); 7,8733 (1,0); 7,869 4 (1,2); 7,8639 (1,0); 7,8530 (1,1); 7,8493 (1,3); 7,8474 (1,3); 7,8435 (1,0); 7,7 824 (3,3); 7,7618 (3,6); 7,7430 (0,9); 7,4489 (1,4); 7,4371 (1,4); 7,4286 (1,3); 7,4167 (1,2); 6,2070 (3,0); 6,0763 (1,1); 6,0590 (1,2); 6,0489 (1,3); 6,0315 (1,1); 5,7569 (6,6); 4,1450 (1,1); 4,1275 (1,0); 4,1026 (1,3); 4,0853 (1,2); 3,8799 (16,0); 3,8158 (0,4); 3,7931 (1,2); 3,7655 (1,3); 3,7509 (1,1); 3,7233 (0,9); 3,3 869 (15,9); 3,3313 (2,0); 3,2528 (0,3); 2,5674 (0,4); 2,5079 (29,0); 2,5036 (37. 0); 2,4994 (27,2); 1,9896 (1,1); 1,3531 (0,4); 1,2355 (1,5); 1,1935 (0,3); 1,175 8 (0,6); -0,0002 (4,7)
I-1-36	1,97	1,84	Ejemplo I-1-36: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=9,0712 (2,1); 8,5110 (2,5); 8,5051 (2,6); 8,4665 (1,7); 8,4631 (1,9); 8,4547 (1,8); 8,4512 (1,8); 8,3020 (1,1); 8,2967 (1,1); 8,2809 (1,3); 8,2757 (1,3); 8,123 1 (2,0); 8,1022 (1,6); 7,8737 (0,9); 7,8700 (1,1); 7,8677 (1,1); 7,8638 (1,0); 7,8 534 (1,0); 7,8497 (1,2); 7,8471 (1,2); 7,8436 (1,0); 7,4511 (1,3); 7,4394 (1,3); 7,4310 (1,2); 7,4189 (1,2); 6,2175 (2,8); 6,1318 (1,1); 6,1143 (1,2); 6,1040 (1. 3); 6,0863 (1,1); 5,7558 (4,0); 4,2131 (1,0); 4,1954 (1,0); 4,1693 (1,2); 4,1518 (1,2); 3,8862 (16,0); 3,8693 (0,5); 3,7968 (1,2); 3,7687 (1,3); 3,7530 (1,1); 3,7 252 (0,9); 3,3849 (15,4); 3,3233 (45,5); 2,8911 (1,6); 2,7319 (1,4); 2,6712 (0,3); 2,5244 (1,2); 2,5109 (22,1); 2,5067 (43,2); 2,5023 (56,1); 2,4979 (41,1); 2,3 290 (0,3); 1,9890 (0,5); 1,2352 (0,4); -0,0002 (6,6)
I-1-37	1,85	1,65	Ejemplo I-1-37: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5112 (2,2); 8,5050 (2,3); 8,4742 (1,6); 8,4707 (1,6); 8,4623 (1,7); 8,4589 (1,6); 7,8746 (0,8); 7,8707 (1,0); 7,8653 (0,8); 7,8543 (0,9); 7,8502 (1,1); 7,844 8 (0,8); 7,4556 (1,2); 7,4437 (1,2); 7,4353 (1,1); 7,4234 (1,1); 6,4396 (2,3); 4,4 177 (0,5); 4,4012 (0,5); 4,3956 (0,7); 4,3907 (0,6); 4,3792 (0,7); 4,3746 (0,7); 4,3688 (0,6); 4,3521 (0,5); 3,9858 (16,0); 3,3995 (15,6); 3,3729 (1,1); 3,3563 (1,6); 3,3318 (103,9); 3,1030 (1,2); 3,0809 (1,1); 3,0592 (0,9); 3,0371 (0,9); 2,7 118 (0,4); 2,6714 (0,3); 2,5415 (108,0); 2,5248 (1,0); 2,5108 (21,8); 2,5067 (4 4,1); 2,5023 (58,0); 2,4979 (41,8); 2,3679 (0,5); 2,3291 (0,3); 1,8302 (0,5); 1,8 138 (1,0); 1,7968 (1,0); 1,7803 (0,6); 0,9111 (6,4); 0,8944 (6,2); 0,8668 (6,5); 0,8499 (6,2); -0,0003 (1,2)
I-1-38	2,21	2,09	Ejemplo I-1-38: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5090 (2,3); 8,5029 (2,4); 8,4735 (1,7); 8,4700 (1,7); 8,4617 (1,8); 8,4581 (1,7); 7,8735 (0,8); 7,8697 (1,0); 7,8673 (0,9); 7,8635 (0,8); 7,8532 (1,0); 7,849 4 (1,1); 7,8469 (1,0); 7,8432 (0,8); 7,4554 (1,3); 7,4434 (1,3); 7,4349 (1,2); 7,4 231 (1,2); 6,4375 (2,3); 4,5125 (0,5);

ES 2 858 093 T3

(continuación)

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ¹ H; δ (ppm)
			4,4918 (0,9); 4,4864 (0,6); 4,4 716 (0,7); 4,4659 (0,9); 4,4455 (0,5); 3,9869 (16,0); 3,4583 (1,0); 3,4319 (1,1); 3,4149 (1 .5); 3,3991 (15,2); 3,3888 (1,6); 3,3338 (79,5); 3,0563 (1,2); 3,0349 (1,1); 3,01 29 (1,0); 2,9916 (0,9); 2,6712 (0,4); 2,5415 (35,6); 2,5246 (0,9); 2,5110 (23,5) ; 2,5067 (48,8); 2,5022 (64,6); 2,4977 (45,8); 2,4934 (21,5); 2,3290 (0,4); 2,08 56 (0,5); 2,0653 (1,0); 2,0455 (1,1); 2,0256 (0,6); 1,7497 (0,3); 1,7383 (0,5); 1. 7199 (0,7); 1,7057 (0,7); 1,6942 (0,6); 1,6748 (0,5); 1,6664 (0,4); 1,5862 (1,0) ; 1,5763 (1,0); 1,5688 (0,8); 1,5625 (0,8); 1,5432 (0,6); 1,5252 (0,8); 1,5057 (1. 0); 1,4923 (0,8); 1,4867 (0,9); 1,4738 (0,5); 1,4627 (0,4); 1,3340 (0,4); 1,3172 (0,5); 1,3042 (0,5); 1,2995 (0,4); 1,2857 (0,4); 1,2352 (0,8); 1,2159 (0,5); 1,20 45 (0,4); 1,1853 (0,4); -0,0003 (1,1)
I-1-39	1,12	0,78	Ejemplo I-1-39: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5214 (2,4); 8,5151 (2,4); 8,4764 (1,6); 8,4734 (1,6); 8,4646 (1,6); 8,4616 (1,6); 7,8621 (1,1); 7,8463 (0,9); 7,8416 (1,1); 7,8379 (0,9); 7,4529 (1,3); 7,441 0 (1,3); 7,4325 (1,2); 7,4206 (1,1); 6,4768 (2,1); 5,5535 (1,0); 5,5360 (1,2); 5,5 253 (1,2); 5,5077 (1,1); 3,9804 (15,8); 3,9461 (1,3); 3,7893 (1,0); 3,7718 (1,0) ; 3,7460 (1,4); 3,7287 (1,4); 3,5457 (1,3); 3,5173 (1,4); 3,5024 (1,0); 3,4742 (0. 9); 3,4059 (14,9); 3,3416 (54,5); 3,0908 (16,0); 2,8640 (15,2); 2,5425 (64,2); 2,5255 (0,5); 2,5070 (19,2); 2,5028 (25,0); 2,4986 (18,2); -0,0002 (0,3)
I-1-41	2,60	2,49	Ejemplo I-1-41: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5209 (2,4); 8,5146 (2,4); 8,4718 (1,6); 8,4686 (1,7); 8,4600 (1,7); 8,4567 (1,7); 7,8827 (0,8); 7,8788 (1,0); 7,8737 (0,8); 7,8622 (0,9); 7,8584 (1,2); 7,853 1 (0,9); 7,7617 (2,6); 7,7410 (3,5); 7,6259 (3,3); 7,6055 (2,5); 7,4542 (1,3); 7,4 423 (1,3); 7,4339 (1,2); 7,4220 (1,2); 6,4630 (2,2); 5,8385 (0,8); 5,8183 (1,0); 5,8110 (1,0); 5,7909 (0,9); 4,0523 (16,0); 3,9715 (1,0); 3,9435 (1,2); 3,9276 (1,3); 3,8999 (1,1); 3,4086 (14,8); 3,3847 (1,4); 3,3646 (1,6); 3,3436 (69,1); 3,32 11 (1,5); 2,5443 (68,2); 2,5274 (0,5); 2,5092 (19,8); 2,5049 (26,1); 2,5005 (18. 9); -0,0002 (0,5)
I-1-42	1,46	1,09	Ejemplo I-1-42: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5746 (1,3); 8,5642 (1,3); 8,5244 (2,2); 8,5181 (2,2); 8,4765 (1,6); 8,4730 (1,6); 8,4646 (1,7); 8,4612 (1,6); 7,8817 (0,8); 7,8778 (1,0); 7,8724 (0,8); 7,860 2 (1,5); 7,8558 (1,7); 7,8408 (1,5); 7,8365 (1,5); 7,8216 (0,9); 7,8172 (0,8); 7,5 230 (1,8); 7,5034 (1,6); 7,4569 (1,2); 7,4450 (1,2); 7,4366 (1,1); 7,4247 (1,1); 7,3846 (0,9); 7,3727 (1,0); 7,3660 (1,0); 7,3538 (0,9); 6,4632 (2,1); 5,7688 (1. 0); 5,7507 (1,2); 5,7412 (1,1); 5,7231 (1,0); 4,0305 (16,0); 3,8523 (0,8); 3,824 7 (0,7); 3,8090 (1,6); 3,7816 (1,4); 3,7431 (1,6); 3,7249 (1,6); 3,6998 (0,8); 3,6 816 (0,7); 3,4088 (14,6); 3,3423 (32,4); 2,5432 (61,8); 2,5262 (0,4); 2,5126 (8. 5); 2,5083 (17,5); 2,5039 (23,0); 2,4994 (16,4); 2,4952 (7,8); -0,0002 (0,5)
I-1-43	1,35	0,56	Ejemplo I-1-43: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,6124 (2,2); 8,6071 (2,2); 8,5597 (1,5); 8,5558 (1,6); 8,5478 (1,6); 8,5439 (1,6); 8,5221 (2,4); 8,5159 (2,4); 8,4744 (1,7); 8,4710 (1,8); 8,4626 (1,9); 8,459 1 (1,8); 7,8855 (0,8); 7,8796 (1,0); 7,8756 (0,8); 7,8650 (0,9); 7,8592 (1,1); 7,8 552 (0,9); 7,8367 (0,8); 7,8322 (1,2); 7,8274 (0,8); 7,8168 (0,9); 7,8122 (1,3); 7,8077 (0,8); 7,4568 (1,3); 7,4448 (1,3); 7,4363 (1,3); 7,4304 (1,4); 7,4244 (1. 3); 7,4184 (1,3); 7,4107 (1,1); 7,3987 (1,1); 6,4691 (2,2); 5,7744 (1,0); 5,7528 (1,2); 5,7473 (1,2); 5,7254 (1,0); 4,0487 (16,0); 4,0196 (0,4); 3,9355 (1,1); 3,9 078 (1,2); 3,8918 (1,4); 3,8642 (1,2); 3,4903 (0,5); 3,4431 (1,4); 3,4214 (1,6); 3,4095 (15,2); 3,3996 (1,7); 3,3778 (1,4); 3,3677 (0,6); 3,3401 (79,4); 2,7127 (0,4); 2,5427 (96,9); 2,5261 (0,7); 2,5120 (13,7); 2,5078 (28,1); 2,5034 (37,0); 2,4989 (26,3); 2,4947 (12,5); 2,3690 (0,4); -0,0002 (0,9)
I-1-44	1,34	0,45	Ejemplo I-1-44: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5778 (3,9); 8,5738 (2,4); 8,5666 (2,4); 8,5627 (4,0); 8,5316 (0,5); 8,5256 (0,5); 8,5148 (2,4); 8,5087 (2,6); 8,4983 (0,5); 8,4948 (0,4); 8,4679 (1,7); 8,464 4 (1,8); 8,4561 (1,8); 8,4526 (1,8); 7,8771 (1,0); 7,8735 (1,0); 7,8709 (1,0); 7,8 670 (1,0); 7,8567 (1,1); 7,8529 (1,1); 7,8505 (1,1); 7,8467 (0,9); 7,4494 (1,5); 7,4377 (1,4); 7,4292 (1,2); 7,4173 (1,1); 7,3968 (3,6); 7,3818 (3,5); 6,4576 (2. 2); 5,7689 (0,9); 5,7499 (1,1); 5,7412 (1,0); 5,7219 (1,0); 4,0424 (16,0); 4,024 5 (0,4); 3,9673 (1,2); 3,9631 (1,1); 3,9465 (3,0); 3,9395 (1,3); 3,9238 (1,4); 3,8 959 (1,2); 3,4174 (1,2); 3,4041 (17,7); 3,3675 (1,9); 3,3395 (106,0); 3,3244 (2. 8); 3,3048 (1,4); 2,7127 (0,5); 2,5427 (120,6); 2,5256 (0,9); 2,5122 (17,4); 2,5 079 (36,4); 2,5034 (48,4); 2,4989 (34,5); 2,4947 (16,4); 2,3691

(continuación)

Ej. n.º	logP [n]	logP [a]	RMN de ¹ H; δ (ppm)
			(0,5); -0,0002 (1,1)
I-1-46	0,74	-	Ejemplo I-1-46: RMN de ¹ H (400,0 MHz, DMSO-d ⁶): δ=8,5047 (2,3); 8,4989 (2,3); 8,4760 (1,7); 8,4728 (1,6); 8,4641 (1,7); 8,4609 (1,6); 7,8608 (0,9); 7,8570 (1,1); 7,8404 (1,0); 7,8366 (1,2); 7,8306 (0,9); 7,454 4 (1,2); 7,4425 (1,2); 7,4341 (1,1); 7,4221 (1,1); 6,4226 (2,3); 3,9477 (16,0); 3. 7669 (1,8); 3,7417 (3,8); 3,7168 (2,2); 3,3958 (15,2); 3,3365 (2,4); 3,3195 (32. 1); 3,3120 (5,0); 3,2972 (0,4); 3,2868 (1,8); 2,8512 (16,0); 2,6699 (0,8); 2,505 3 (104,9); 2,5011 (131,3); 2,4967 (93,4); 2,3278 (0,8); -0,0002 (62,0); -0,0083 (2,5)

Ejemplos biológicos**Boophilus microplus - ensayo de inyección**

Disolvente: dimetilsulfóxido

5 Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de disolvente y se diluye el concentrado con disolvente hasta la concentración deseada.

Se inyecta 1 µl de la solución de principio activo en el abdomen de 5 garrapatas hembras adultas empapadas (*Boophilus microplus*). Los animales se pasan a cubas y se conservan en un ambiente climatizado.

10 El control de la acción se realiza después de 7 días respecto de la deposición de huevos fértiles. Los huevos, cuya fertilidad no puede verse externamente, se conservan hasta la eclosión de las larvas después de aproximadamente 42 días en el armario climatizado. Una acción del 100 % significa que ninguna garrapata puso huevos fértiles, 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

En este ensayo, los siguientes ejemplos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 95 % con una cantidad de aplicación de 20 µg/animal: I-1-19

15 En este ensayo, los siguientes ejemplos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 80 % con una cantidad de aplicación de 20 µg/animal: I-1-7, I-1-28

Meloidogyne incognita - ensayo

Disolvente: 125,0 partes en peso de acetona

Para obtener una preparación de principio activo adecuada, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con la cantidad indicada de disolvente y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

20 Se llenan recipientes con arena, solución de principio activo, una suspensión de larvas de huevos de *Meloidogyne incognita* y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plántulas se desarrollan. En las raíces, se desarrollan las agallas.

25 Después de 14 días se determina la acción nematocida por medio de la formación de agallas en %. En este caso, 100 % significa que no se hallaron agallas; 0 % significa que la cantidad de agallas en las plantas tratadas equivale al control no tratado.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 20 ppm: I-1-29

Myzus persicae - ensayo de pulverización

30 Disolvente: 78 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

35 Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta obtener la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo, se diluye con agua con contenido de emulsionante.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que estaban infestados con todos los estadios del piojo del durazno verde (*Myzus persicae*), se pulverizan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 5 días, se determina la acción en %. En este caso, 100 % significa que se mataron todos los piojos de las hojas; 0 % significa que no se mató a ningún piojo de las hojas.

5 En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-1, I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-9, I-1-10, I-1-11, I-1-12, I-1-13, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-19, I-1-21, I-1-22, I-1-29, I-1-35, I-1-36

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-2, I-1-4, I-1-7, I-1-14, I-1-18, I-1-20, I-1-23, I-1-24, I-1-26, I-1-27, I-1-28, I-1-30, I-1-31, I-1-32, I-1-33, I-1-34, I-1-40, I-1-47

Myzus persicae - ensayo oral

10 Disolvente: 100 partes en peso de acetona

Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua hasta obtener la concentración deseada.

15 50 µl de la preparación de principio activo se pasan a placas de microtitulación y se llenan con 150 µl de medio de insectos IPL41 (33 % + 15 % de azúcar) hasta un volumen final de 200 µl. A continuación se cierran las placas con parafilm, se pincha a través de una población mixta de piojo del durazno verde (*Myzus persicae*), que se halla en una segunda placa de microtitulación y se puede absorber la solución.

Después de 5 días, se determina la acción en %. En este caso, 100 % significa que se mataron todos los piojos de las hojas; 0 % significa que no se mató a ningún piojo de las hojas.

20 En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 4 ppm: I-1-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-8, I-1-9, I-1-10, I-1-11, I-1-12, I-1-13, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-20, I-1-21, I-1-22, I-1-23, I-1-24, I-1-25, I-1-26, I-1-27, I-1-28, I-1-29, I-1-32, I-1-34, I-1-36, I-1-47

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 4 ppm: I-1-30, I-1-31, I-1-35, I-1-40

25 **Tetranychus urticae - ensayo de pulverización, resistente a OP**

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

30 Para obtener una preparación de principio activo adecuada, se disuelve una parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para obtener más concentraciones de ensayo, se diluye con agua con contenido de emulsionante.

Discos de hojas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que están infestados por todos los estadios de la araña roja común (*Tetranychus urticae*), se inyectan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

35 Después de 6 días se determina la acción en %. En este caso, 100 % significa que se exterminaron todas las arañas rojas; 0 % significa que no se exterminó ninguna araña roja.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-23, I-1-24

40 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: I-1-8

Ejemplos de deposición

Myzus persicae - ensayo de pulverización (MYZUPE)

45 Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para obtener una preparación de principio activo adecuada, se disuelve una parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para obtener más concentraciones de ensayo, se diluye con agua con contenido de emulsionante.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que están infestados por todos los estadios del piojo verde de la hoja del durazno (*Myzus persicae*), se inyectan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado se determina la acción en %. En este caso, 100 % significa que se exterminaron todos los piojos de las hojas; 0 % significa que no se exterminaron los piojos de las hojas.

- 5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia superior respecto del estado de la técnica: véase la Tabla.

Myzus persicae - ensayo oral (MYZUPE O)

Disolvente: 100 partes en peso de acetona

- 10 Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua hasta obtener la concentración deseada.

50 µl de la preparación de principio activo se pasan a placas de microtitulación y se completan con 150 µl de medio de insectos IPL41 (33 % + 15 % de azúcar) hasta un volumen final de 200 µl. A continuación se cierran las placas con parafilm, se pincha a través de una población mixta de piojo del durazno verde (*Myzus persicae*), que se halla en una segunda placa de microtitulación, y se puede absorber la solución.

- 15 Después del tiempo deseado, se determina la acción en %. En este caso, 100 % significa que se mataron todos los piojos de las hojas; 0 % significa que no se mató a ningún piojo de las hojas.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una eficacia superior respecto del estado de la técnica: véase la Tabla.

Myzus persicae - ensayo de pulverización (MYZUPE S)

- 20 Disolvente: 14 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

- 25 Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta obtener la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo, se diluye con agua con contenido de emulsionante. Con una necesaria adición de sales de amonio y/o estimuladores de la penetración, se añaden en cada caso en una concentración de 1000 ppm de la solución de preparación.

Plantas de pimiento (*Capsicum annuum*), que están muy infestadas por el piojo de la hoja del durazno verde (*Myzus persicae*), se tratan por pulverización con la preparación de principio activo en la concentración deseada.

- 30 Después del tiempo deseado, se determina el exterminio en %. En este caso, 100 % significa que todos los animales fueron exterminados; 0 % significa que ningún animal se exterminó.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una eficacia superior respecto del estado de la técnica: véase la Tabla.

Myzus persicae - ensayo de empapamiento (MYZUPE D)

- 35 Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 40 Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada, debiendo considerar también el volumen final en el que se empapa. Se debe tener en cuenta que en la tierra no supere una concentración de 40 ppm de emulsionante. Para preparar otras concentraciones de ensayo, se diluye con agua.

Plantas de col rizada (*Brassica oleracea*) en macetas con tierra, que están infestadas con todos los estadios del piojo del durazno verde (*Myzus persicae*), se riegan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

- 45 Después del tiempo deseado, se determina la acción en %. En este caso, 100 % significa que se mataron todos los piojos de las hojas; 0 % significa que no se mató a ningún piojo de las hojas.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una eficacia superior respecto del estado de la técnica: véase la Tabla.

Aphis gossypii - ensayo de pulverización (APHIGO S)

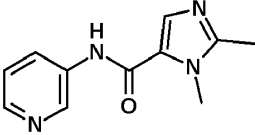
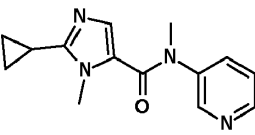
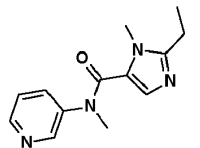
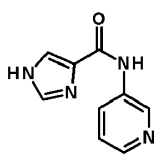
Disolvente: 14 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

- 5 Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta obtener la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo, se diluye con agua con contenido de emulsionante. Con una necesaria adición de sales de amonio y/o estimuladores de la penetración, se añaden en cada caso en una concentración de 1000 ppm de la solución de preparación.

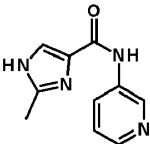
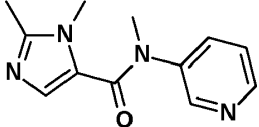
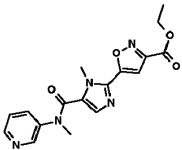
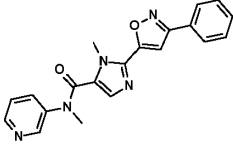
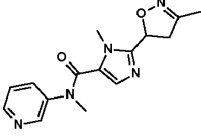
Plantas de algodón (*Gossypium hirsutum*), que están muy infestadas con el piojo de las hojas de algodón (*Aphis gossypii*), se pulverizan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

- 10 Después del tiempo deseado, se determina el exterminio en %. En este caso, 100 % significa que se mataron todos los piojos de las hojas; 0 % significa que no se mató a ningún piojo de las hojas.

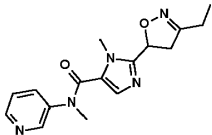
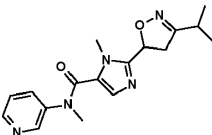
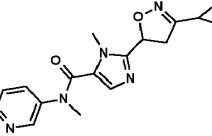
En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una eficacia superior respecto del estado de la técnica: véase la Tabla.

Sustancia	Estructura	Objeto	Concentración	% acción dat	
Estado de la técnica <i>Dragovic et al., Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, vol. 24, n.º 3, pág. 954-962 (tabla 2, comp. 20)</i>		MYZUPE	20 g p.a./ha	0	5 dat
			4 g p.a./ha	0	5 dat
		MYZUPE S	0,8 ppm	30	6 dat
			0,16 ppm	0	6 dat
		MYZUPE D	0,8 ppm	0	10 dat
			0,16 ppm	0	10 dat
Estado de la técnica de acuerdo con el documento WO 2011/009804		MYZUPE S	0,16 ppm	5	6 dat
		APHIGO S	0,8 ppm	30	6 dat
			0,16 ppm	10	6 dat
Estado de la técnica de acuerdo con el documento WO 2011/009804		MYZUPE S	0,16 ppm	0	6 dat
		MYZUPE D	0,16 ppm	0	10 dat
		APHIGO S	0,8 ppm	0	6 dat
			0,16 ppm	0	6 dat
Estado de la técnica WO 2011/009804 (Ej. 13)		MYZUPE O	4 ppm	0	5 dat
			0,8 ppm	0	5 dat
		MYZUPE	100 g/ha	0	6 dat
			20 g/ha	0	6 dat
			4 g/ha	0	6 dat

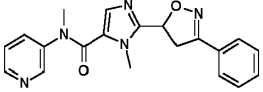
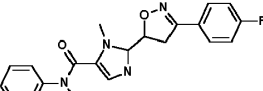
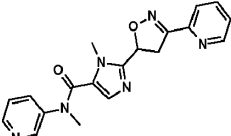
(continuación)

Sustancia	Estructura	Objeto	Concentración	% acción dat	
Estado de la técnica WO 2011/009804 (Ej. 14)		MYZUPE O	4 ppm	0	5 dat
			0,8 ppm	0	5 dat
		MYZUPE	100 g/ha	0	5 dat
			20 g/ha	0	5 dat
			4 g/ha	0	5 dat
Estado de la técnica de acuerdo con el documento WO 2011/009804		MYZUPE S	0,16 ppm	0	6 dat
		MYZUPE D	0,16 ppm	30	10 dat
		APHIGO S	0,8 ppm	0	6 dat
			0,16 ppm	0	6 dat
Comparativo		MYZUPE	500 g/ha	0	5 dat
			100 g/ha	0	5 dat
			20 g/ha	0	5 dat
			4 g/ha	0	5 dat
		MYZUPE O	4 ppm	0	5 dat
			0,8 ppm	0	5 dat
Comparativo		MYZUPE	20 g/ha	0	6 dat
			4 g/ha	0	6 dat
		MYZUPE S	0,8 ppm	0	6 dat
			0,16 ppm	0	6 dat
		MYZUPE D	0,8 ppm	0	10 dat
			0,16 ppm	0	10 dat
		APHIGO S	0,8 ppm	0	6 dat
			0,16 ppm	0	6 dat
Ejemplo n.º I-1-1 De acuerdo con la invención		MYZUPE	500 g/ha	100	5 dat
			100 g/ha	70	5 dat
			20 g/ha	70	5 dat
			4 g/ha	70	5 dat
		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
			0,8 ppm	100	5 dat
		MYZUPE S	0,8 ppm	95	6 dat
			0,16 ppm	100	6 dat
		MYZUPE D	0,8 ppm	100	10 dat
			0,16 ppm	100	10 dat

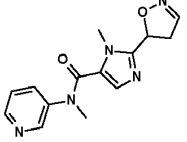
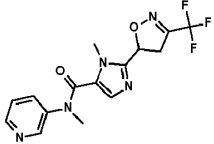
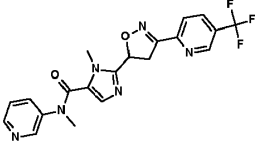
(continuación)

Sustancia	Estructura	Objeto	Concentración	% acción dat	
		APHIGO S	0,8 ppm	100	6 dat
			0,16 ppm	100	6 dat
Ejemplo n.º I-1-2		MYZUPE	500 g/ha	90	5 dat
De acuerdo con la invención		100 g p.a./ha	70	5 dat	
		20 g p.a./ha	90	5 dat	
		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
		0,8 ppm	100	5 dat	
		MYZUPE S	0,8 ppm	100	6 dat
		0,16 ppm	100	6 dat	
		MYZUPE D	0,8 ppm	100	10 dat
		0,16 ppm	98	10 dat	
		APHIGO S	0,8 ppm	98	6 dat
	0,16 ppm	98	6 dat		
Ejemplo n.º I-1-3		MYZUPE	500 g/ha	100	5 dat
De acuerdo con la invención		100 g/ha	90	5 dat	
		20 g/ha	70	5 dat	
		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
		0,8 ppm	100	5 dat	
		MYZUPE S	0,8 ppm	100	6 dat
		0,16 ppm	99	6 dat	
		MYZUPE D	0,8 ppm	100	10 dat
		0,16 ppm	95	10 dat	
		APHIGO S	0,8 ppm	100	6 dat
	0,16 ppm	70	6 dat		
Ejemplo n.º I-1-4		MYZUPE	500 g/ha	90	5 dat
De acuerdo con la invención		100 g/ha	90	5 dat	
		20 g/ha	100	5 dat	
		4 g/ha	70	5 dat	
		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
		0,8 ppm	100	5 dat	
		MYZUPE S	0,8 ppm	100	6 dat
		0,16 ppm	98	6 dat	

(continuación)

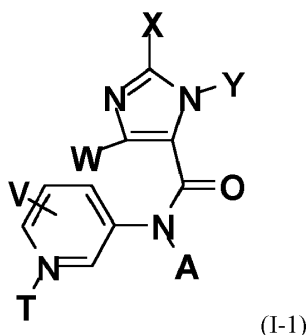
Sustancia	Estructura	Objeto	Concentración	% acción dat	
		MYZUPE D	0,8 ppm	100	10 dat
			0,16 ppm	95	10 dat
		APHIGO S	0,8 ppm	100	6 dat
			0,16 ppm	90	6 dat
Ejemplo n.º I-1-7		MYZUPE	500 g/ha	90	5 dat
De acuerdo con la invención		MYZUPE O	100 g/ha	90	5 dat
		4 ppm	100	5 dat	
MYZUPE S		0,8 ppm	100	5 dat	
		0,8 ppm	100	6 dat	
MYZUPE D		0,16 ppm	95	6 dat	
		0,8 ppm	90	10 dat	
APHIGO S		0,16 ppm	80	10 dat	
		0,8 ppm	100	6 dat	
0,16 ppm		50	6 dat		
Ejemplo n.º I-1-22		MYZUPE	500 g/ha	100	5 dat
De acuerdo con la invención		100 g/ha	100	5 dat	
		20 g/ha	100	5 dat	
MYZUPE O		4 g/ha	90	5 dat	
		4 ppm	100	5 dat	
MYZUPE S		0,8 ppm	90	5 dat	
		0,8 ppm	99	6 dat	
MYZUPE D		0,16 ppm	90	6 dat	
		0,8 ppm	95	10 dat	
0,16 ppm		90	10 dat		
Ejemplo n.º I-1-26		MYZUPE	500 g/ha	90	5 dat
De acuerdo con la invención		100 g/ha	90	5 dat	
		20 g/ha	90	5 dat	
MYZUPE O		4 ppm	100	5 dat	
		0,8 ppm	100	5 dat	
MYZUPE S		0,8 ppm	100	6 dat	
		0,16 ppm	100	6 dat	
MYZUPE D		0,8 ppm	98	10 dat	

(continuación)

Sustancia	Estructura	Objeto	Concentración	% acción dat		
			0,16 ppm	95	10 dat	
		APHIGO S	0,8 ppm	100	6 dat	
Ejemplo n.º I-1-30		MYZUPE	500 g/ha	90	5 dat	
De acuerdo con la invención				100 g/ha	70	5 dat
				20 g/ha	70	5 dat
		MYZUPE O	4 ppm	90	5 dat	
			0,8 ppm	100	5 dat	
		MYZUPE S	0,8 ppm	100	6 dat	
			0,16 ppm	95	6 dat	
		MYZUPE D	0,8 ppm	95	10 dat	
		0,16 ppm	95	10 dat		
	APHIGO S	0,8 ppm	80	6 dat		
Ejemplo n.º I-1-32		MYZUPE	500 g/ha	90	5 dat	
De acuerdo con la invención				4 ppm	100	5 dat
				0,8 ppm	100	5 dat
		MYZUPE S	0,8 ppm	96	6 dat	
			0,16 ppm	20	6 dat	
		MYZUPE D	0,8 ppm	99	10 dat	
			0,16 ppm	90	10 dat	
		APHIGO S	0,8 ppm	97	6 dat	
		0,16 ppm	90	6 dat		
Ejemplo n.º I-1-36		MYZUPE	500 g/ha	100	5 dat	
De acuerdo con la invención				100 g/ha	90	5 dat
				20 g/ha	90	5 dat
			4 g/ha	100	5 dat	
		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat	
			0,8 ppm	100	5 dat	
		MYZUPE S	0,8 ppm	99	6 dat	
			0,16 ppm	90	6 dat	
	MYZUPE D	0,8 ppm	80	10 dat		
	0,16 ppm	70	10 dat			
	APHIGO S	0,8 ppm	97	6 dat		

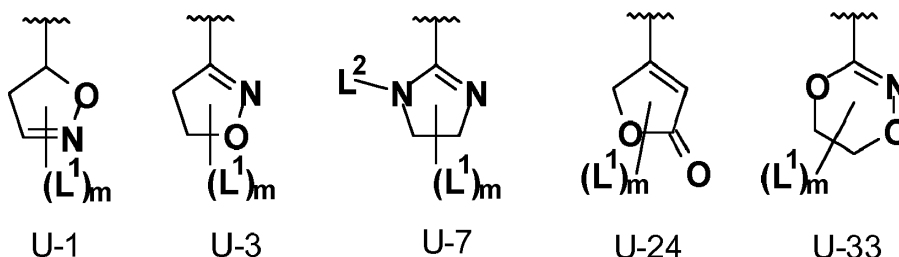
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (I-1)



en la que

- 5 V representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, metilo y ciano,
 W representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo y ciano,
 Y representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, etilo, propilo, alilo y propargilo opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con flúor, metoxi, etoxi y ciano,
 A representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, etilo, propilo, alilo, propargilo, ciclopropilo y ciclopropilmetilo
 10 opcionalmente sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con flúor, metoxi, etoxi y ciano,
 T representa un par de electrones,
 X representa un heterociclo de cinco o seis miembros parcialmente saturado U-1, U-3, U-7, U-24 o U-33,



- 15 L¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, C(O)N(R²)(R³), C(O)OR⁵, metilo, etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, isopentilo, 2,2-dimetilpropilo, hexilo, neo-hexilo, alilo, metalilo, 2-butenilo, propargilo y 2-butenilo opcionalmente sustituido de una a cinco veces independientemente entre sí con flúor, cloro y bromo, y una vez con metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, ciano, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo
 20 opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, pirrolidilo, N-metilpirrolidilo, piperidilo y N-metilpiperidilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo
 25 opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, fenilo, piridilo, pirimidilo, tienilo y tiazolilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano, bencilo, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo y pirazolilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos
 30 veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano,
 35 L² representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, isopentilo, 2,2-dimetilpropilo, hexilo, neo-hexilo, alilo, metalilo, 2-butenilo, propargilo y 2-butenilo
 40 opcionalmente sustituido de una a cinco veces independientemente entre sí con flúor, cloro y bromo, y una vez con metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, ciano, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, fenilo, piridilo, pirimidilo,

5 tienilo y tiazolilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano, bencilo, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo y pirazolilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano,

10 R^2 y R^3 independientemente entre sí representan un resto de la serie hidrógeno, metilo, etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, isopentilo, 2,2-dimetilpropilo, hexilo, neo-hexilo, alilo, metalilo, 2-butenilo, propargilo y 2-butenilo sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con flúor, cloro y bromo o una vez con metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o ciano, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, fenilo, piridilo, pirimidilo, tienilo y tiazolilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano, bencilo, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo y pirazolilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano,

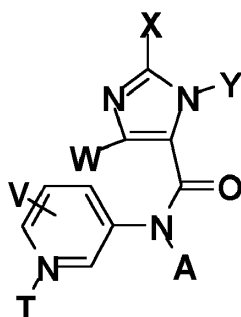
20 R^5 representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, etilo, propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, isopentilo, 2,2-dimetilpropilo, hexilo, neo-hexilo, alilo, metalilo, 2-butenilo, propargilo y 2-butenilo sustituido de una a tres veces independientemente entre sí con flúor, cloro y bromo o una vez con metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo o ciano, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo y ciclohexilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi y ciano, fenilo, piridilo, pirimidilo, tienilo y tiazolilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano, bencilo, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo y pirazolilmetilo opcionalmente sustituido de una a dos veces independientemente entre sí con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, metilsulfanilo, etilsulfanilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, difluorometilsulfanilo, difluorometilsulfinilo, difluorometilsulfonilo, trifluoroetilsulfanilo, trifluoroetilsulfinilo, trifluoroetilsulfonilo, nitro y ciano,

25 m representa un número de 1 a 4, en el que en el caso de $m \geq 2$ los restos L^1 pueden ser opcionalmente independientes entre sí,

n representa un número 0, 1 o 2,

50 y sus sales.

2. Compuestos según la reivindicación 1 de acuerdo con la fórmula (I-1)



(I-1),

en la que

V representa hidrógeno,

W representa hidrógeno,

Y representa metilo,

5 A representa metilo o etilo,

T representa un par de electrones,

X representa un heterociclo de cinco o seis miembros parcialmente saturado U-1, U-3, U-7, U-24 o U-33,

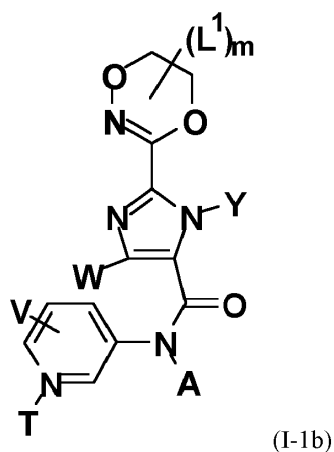
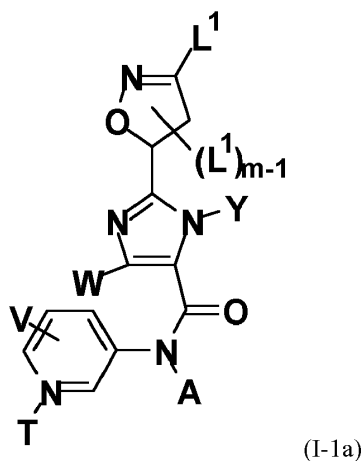
10 L¹ representa un resto de la serie hidrógeno, metilo, trifluorometilo, etilo, isopropilo, ciclopropilo, ciclopentilo, etoxicarbonilo, dimetilaminocarbonilo, fenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2,3-diclorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 4-cianofenilo, 4-metilfenilo, 4-fluorofenilo, 4-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropan-2-il)fenilo, 2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenilo, 4-nitrofenilo, 4-metoxifenilo, 2-piridinilo, 4-trifluoropiridin-2-ilo, 3-piridinilo y 4-piridinilo,

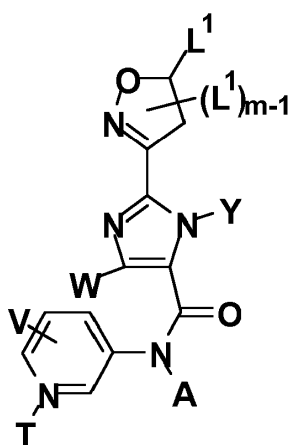
L² representa un resto de la serie hidrógeno y metilo,

15 m representa un número de 1 a 4,

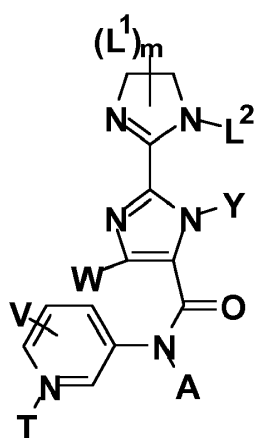
y sus sales.

3. Compuestos según una de las reivindicaciones 1 o 2 de acuerdo con una de las fórmulas (I-1a), (I-1b), (1-1d), (1-1f) y (I-1o)

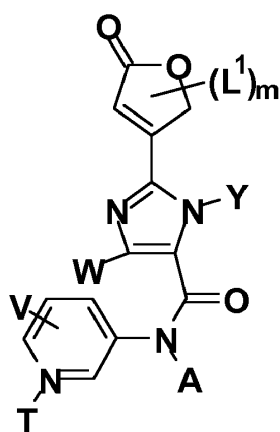




(I-1d)



(I-1f)



(I-1o).

5 4. Agente, con un contenido de al menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 y extensores habituales y/o sustancias tensioactivas en particular para combatir plagas animales.

5. Procedimiento para combatir plagas animales, en el que se deja actuar al menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 o un agente de acuerdo con la reivindicación 4 sobre plagas animales y/o su hábitat, en el que está excluido el tratamiento quirúrgico, terapéutico y diagnóstico del cuerpo humano o animal.

10 6. Uso de al menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 o de un agente de acuerdo con la reivindicación 4 para combatir plagas animales, en el que está excluido el tratamiento quirúrgico, terapéutico y diagnóstico del cuerpo humano o animal.

7. Uso de al menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 para la protección del material de propagación de plantas.

8. Formulación agroquímica que contiene al menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3 en contenidos biológicamente efectivos de entre el 0,00000001 y el 98 % en peso, con respecto al peso de la formulación agroquímica, así como extensores y/o sustancias tensioactivas.

5 9. Formulación agroquímica de acuerdo con la reivindicación 8 que contiene adicionalmente un principio activo agroquímico adicional.