



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 341 974**

51 Int. Cl.:
C07D 231/38 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
C07D 231/44 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05750617 .2**
96 Fecha de presentación : **14.06.2005**
97 Número de publicación de la solicitud: **1765787**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **28.03.2007**

54 Título: **Derivados de 1-arilpirazol como agentes pesticidas.**

30 Prioridad: **26.06.2004 EP 04015066**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
30.06.2010

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
30.06.2010

73 Titular/es: **MERIAL LIMITED**
3239 Satellite Blvd.
Duluth, Georgia 30096-4640, US

72 Inventor/es: **Chou, David, Teh-Wei;**
Knauf, Werner;
Maier, Michael;
Lochhaas, Friederike y
Seeger, Karl

74 Agente: **Ponti Sales, Adelaida**

ES 2 341 974 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

Derivados de 1-arilpirazol como agentes pesticidas.

5 La presente invención se refiere a nuevos derivados de 5-(oximinoalquil y hidrazonoalquil-amino) pirazol, procedimientos para su preparación, a composiciones de los mismos, y a su utilización para el control de plagas (incluyendo artrópodos y helmintos).

10 El control de insectos, arácnidos y helmintos con compuestos 1-arilpirazol se ha descrito, por ejemplo, en los números de publicación de patente WO 87/03781, EP 0295117 y US 4695308.

La patente US 4.740.231 describe 1-aril-5-alkoximino alquilamino-pirazoles que actúan como herbicidas y reguladores del crecimiento vegetal. Los componentes descritos en el mismo también tienen actividad insecticida.

15 La patente US 5.916.618 revela derivados N-fenilpirazol que poseen propiedades artropodocidas, nematocidas de plantas, antihelmíntico y anti protozoarias.

20 Sin embargo, como los pesticidas modernos deben satisfacer una amplia gama de demandas, por ejemplo, respecto al nivel, duración y espectro de acción, espectro de uso, toxicidad, combinación con otras sustancias activas, combinación con auxiliares de formulación o de síntesis, y dado que la aparición de resistencias es posible, el desarrollo de dichas sustancias no puede considerarse como concluido, y constantemente hay una gran demanda de nuevos compuestos que tendrán ventaja sobre los compuestos conocidos, al menos en lo que a algunos aspectos se refiere.

25 Es un objeto de la presente invención proporcionar nuevos pesticidas que pueden ser utilizados en animales domésticos de compañía.

Es ventajoso aplicar pesticidas a los animales en forma oral a fin de evitar la posible contaminación de los seres humanos o el medio ambiente circundante.

30 Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que pueden utilizarse en una dosis más baja que los pesticidas existentes.

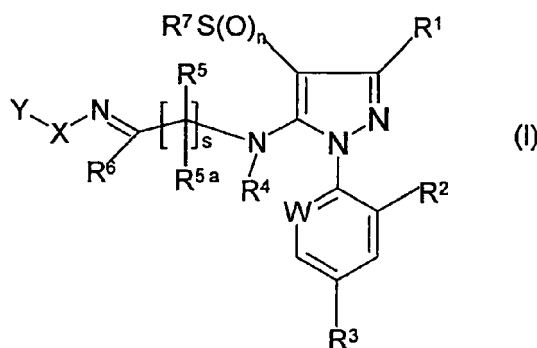
Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que son sustancialmente no eméticos.

35 Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que son más seguros para el usuario y el medio ambiente.

Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que proporcionan el control de plagas eficaz durante un largo período con una aplicación única por vía oral.

40 Estos objetos se cumplen en su totalidad o en parte mediante la presente invención.

45 La presente invención proporciona un compuesto que es un derivado 5-(oximinoalquil- y hidrazonoalquil-amino) pirazol de fórmula (I):



en donde:

R¹ es CN, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, halógeno, CSNH₂ o C(=N-V)-S(O)_r-Q;

65 R² es halógeno;

W es N o C-halógeno;

ES 2 341 974 T3

R³ es CF₃, OCF₃ o SF₅;

R⁴ es H, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, CO₂-(C₁-C₆)-haloalquilo, CO₂-(C₃-C₆)-alquenoilo, CO₂-(C₂-C₆)-alquinoilo, CO₂-(CH₂)_mR⁸, (CH₂)_qR⁸, COR⁹, (CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R¹¹, O(C₁-C₆)-alquilo, (C₂-C₆)-alquenoilo, (C₂-C₆)-alquinoilo o CO-(C₁-C₆)-alquilo, cuyos últimos cuatro grupos mencionados son no sustituidos o sustituidos por uno o más R¹² radicales, o (C₃-C₆)-cicloalquilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno, (C₁-C₆)-alquilo y (C₁-C₆)-haloalquilo;

R⁵ y R^{5a} son cada uno independientemente hidrógeno, (C₁-C₄)-alquilo o (CH₂)_qR⁸;

R⁶ es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alquenoilo, (C₂-C₆)-alquinoilo o (CH₂)_qR⁸;

R⁷ es (C₁-C₃)-alquilo o (C₁-C₃)-haloalquilo;

R⁸ es fenil no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi, CN, NO₂, OH, S(O)_pR¹³ y NR¹⁴R¹⁵;

R⁹ y R^{9a} son cada uno independientemente H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-cicloalquilo, (C₃-C₆)-cicloalquil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁸ o (CH₂)_qR¹⁰;

R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno, (C₁-C₄)-alquilo, (C₁-C₄)-haloalquilo, (C₁-C₄)-alcoxi, (C₁-C₄)-haloalcoxi, NO₂, CN, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, S(O)_pR¹³, OH y oxo, R¹¹ es (C₃-C₆)-cicloalquilo, (C₂-C₆)-alquenoilo, (C₂-C₆)-haloalquenoil, (C₂-C₆)-alquinoilo, (C₂-C₆)-haloalquinoil, (CH₂)_qR⁸ o R¹⁰, o es (C₁-C₆)-alquilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste de R¹²;

R¹² es halógeno, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi, (C₃-C₆)-alquinoiloxi, (C₃-C₆)-haloalquinoiloxi, (C₃-C₆)-alquinoiloxi, (C₃-C₆)-haloalquinoiloxi, (C₃-C₇)-cicloalquilo, S(O)_pR¹⁶, CN, NO₂, OH, COR¹³, NR⁹R¹⁴, NR⁹COR¹⁴, NR⁹SO₂R¹⁶, CONR⁹R¹⁴, SO₂NR⁹R¹⁴, o (CH₂)_qR⁸, o (CH₂)_qR¹⁰, ONR⁹R^{9a} o CO₂R¹³;

R¹³ es (C₁-C₆)-alquilo o (C₁-C₆)-haloalquilo;

R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-alquenoilo, (C₃-C₆)-haloalquenoil, (C₃-C₆)-alquinoilo, (C₃-C₆)-cicloalquilo o (C₃-C₆)-cicloalquilo-(C₁-C₆)-alquilo, o

R¹⁴ y R¹⁵ junto con el átomo N adjunto forma un anillo de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, siendo el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₁-C₆)-alcoxi y oxo;

R¹⁶ es (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-alquenoilo, (C₃-C₆)-haloalquenoilo, (C₃-C₆)-alquinoilo, (C₃-C₆)-cicloalquilo o (CH₂)_qR⁸;

V es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alquenoilo, (C₂-C₆)-alquinoilo, (CH₂)_qR⁸, COR¹³, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, S(O)_pR¹³ o S(O)_p-(CH₂)_qR⁸;

Q es (C₁-C₆)-alquilo o CH₂R⁸;

X es O o NR¹⁷;

Y es el CO-Z^a, CHO, SO₂Z^a, COCO-Z^a, CO₂Z, Z-CS^a o Z^b, o

R¹⁷, Y y el átomo de N juntos forman un anillo de cinco o seis miembros saturado que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste de halógeno, (C₁-C₆)-alquilo y (C₁-C₆)-haloalquilo;

Z es (C₃-C₆)-alquenoilo, (C₃-C₆)-alquinoilo, R⁸, R¹⁰ o (C₁-C₇)-alquilo cuyo último grupo mencionado no está sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste de R¹⁸, o (C₃-C₆)-cicloalquilo no sustituido o sustituido con uno o más (C₁-C₆)-alquilo o radicales halógeno;

Z^a es Z o NR¹⁹R²⁰;

Z^b es Z o H;

R¹⁷ es H, (C₂-C₆)-alquenoilo, (C₂-C₆)-alquinoilo, R⁸ o (C₁-C₆)-alquilo, cuyo último grupo mencionado está no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste de R¹⁸, o (C₃-C₆)-cicloalquilo cuyo último grupo mencionado está no sustituido o sustituido con uno o más (C₁-C₆)-alquilo o radicales halógeno;

ES 2 341 974 T3

R^{18} es halógeno, (C_1-C_6) -alcoxi, (C_1-C_6) -haloalcoxi, (C_3-C_6) -alquinoxilo, (C_3-C_6) -alquinoxilo, (C_3-C_6) -cicloalquilo, $S(O)_p R^{16}$, CN, NO_2 , OH, $NR^9 R^{14}$, $R^8 O^8$, o $CO_2 R^{13}$, R^{19} y R^{20} son cada uno independientemente H, (C_1-C_6) -alquilo, (C_1-C_6) -haloalquilo, (C_3-C_6) -cicloalquilo, (C_3-C_6) -isopropil- (C_1-C_6) -alquilo o $(CH_2)_q R^8$;

5 s es 1, 2 ó 3;

m y q son cada uno independientemente 0 ó 1;

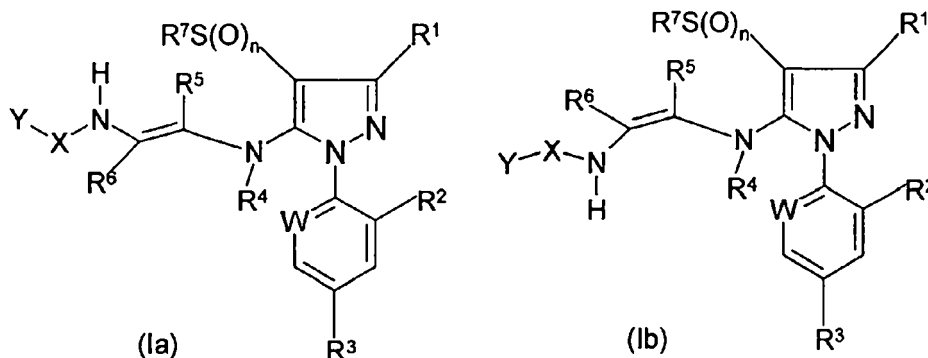
10 n, p y r son cada uno independientemente 0, 1 ó 2, y

cada heterociclilo en los radicales antes mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 o 3 átomos hetero en el anillo seleccionado del grupo formado por N, O y S;

15 o una sal pesticidamente aceptable del mismo.

Estos compuestos poseen valiosas propiedades pesticidas.

20 La invención también abarca cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico, y mezclas de los mismos. Por ejemplo, la fracción $=N-X-Y$ en la fórmula (I) pueden existir como isómeros Z o E, o como una mezcla de ambos isómeros. Además, cuando R^{5a} es H y s es 1, entonces el tautómero imina-enamina forma como la fórmula (Ia) o (Ib):



40 o una mezcla de las mismas también puede existir, y estas formas también se incluyen en la invención.

45 Con el término “sales pesticidamente aceptables” se entienden las sales de los aniones o cationes de las cuales son conocidas y aceptadas en la técnica para la formación de sales para su uso como pesticida. Sales convenientes con bases, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo ácido carboxílico, incluyen metal alcalino (por ejemplo, sodio y potasio), metal de tierra alcalina (por ejemplo, calcio y magnesio), sales amonio y amina (por ejemplo, dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y dioctilmetilamina). Sales de adición de ácido convenientes, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo amino, entre otras: sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos como el ácido acético.

55 En la presente memoria, incluidas las reivindicaciones que acompañan, los sustituyentes anteriormente citados tienen el siguiente significado:

Átomo de halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

60 El término “halo” antes del nombre de un radical significa que este radical está parcial o completamente halogenado, es decir, sustituidos por F, Cl, Br o I, en cualquier combinación, preferentemente por F o Cl.

Los grupos alquilo y porciones de los mismos (a menos que se indique lo contrario) pueden ser de cadena recta o ramificada.

65 La expresión “ (C_1-C_6) -alquilo” ha de entenderse en el sentido de un radical hidrocarburo no ramificado o ramificado que tiene 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de carbono, como, por ejemplo un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2 metilpropilo o terc-butil.

ES 2 341 974 T3

Los radicales alquilo y también en grupos de compuestos, a menos que se indique lo contrario, preferentemente tienen de 1 a 4 átomos de carbono.

“(C₁-C₆)Haloalquilo” significa un grupo alquilo mencionado en la expresión “(C₁-C₆)alquilo” en el que uno o más átomos de hidrógeno se sustituyen por el mismo número de átomos de halógeno iguales o diferentes, tales como monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ o CH₂CH₂Cl.

“(C₁-C₆)Alcoxi”, significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbono tiene el significado dado en la expresión “(C₁-C₆)alquilo”. “Haloalcoxi” es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ o OCH₂CH₂Cl.

“(C₂-C₆)Alqueno” se entiende una cadena de carbono no cíclica no ramificada o ramificada con un número de átomos de carbono que corresponde a este rango establecido y que contiene al menos un doble enlace que puede ser ubicado en cualquier posición del respectivo radical insaturado. “(C₂-C₆)alqueno” en consecuencia denota, por ejemplo, el grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propeno, 2-butenil, pentenil, 2-metilpentenil o hexenil.

“(C₂-C₆)Alquino” significa una cadena de carbono no cíclica no ramificada o ramificada con un número de átomos de carbono que corresponde a este rango establecido y que contiene un enlace triple, que puede localizarse en cualquier posición del respectivo radical insaturado. “(C₂-C₆)Alquino” en consecuencia denota, por ejemplo, el grupo propargil, 1-metil-2-propino, 2-butinilo o 3-butinilo.

Grupos cicloalquilo preferentemente tienen de tres a siete átomos de carbono en el anillo y están opcionalmente sustituidos por halógeno o alquilo.

“(C₃-C₆)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquilo”, significa un grupo (C₁-C₆)-alquilo que se sustituye por un anillo (C₃-C₆)-cicloalquilo.

En los compuestos de fórmula (I) se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales:

Un ejemplo de alquilo sustituido por cicloalquilo es ciclopropilmetilo;

un ejemplo de alquilo sustituido por alcoxi es metoximetilo (CH₂OCH₃), y un ejemplo de alquilo sustituido por alquiltio es metiltiometil (CH₂SCH₃).

Un grupo “heterociclilo” puede ser saturado, no saturado o heteroaromático, sino que preferentemente contiene uno o más, en particular, 1, 2 o 3, heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferiblemente seleccionado del grupo formado por N, O y S, es preferentemente un radical heterociclilo alifático que tiene de 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático con 5 a 7 átomos de anillo. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical heteroaromático o un anillo (heteroarilo), como, por ejemplo, un sistema aromático mono, bi- o policíclicos en el que al menos un anillo contiene uno o más átomos hetero, por ejemplo, piridilo, pirimidinil, piridazinil, pirazinil, triazinil, tienil, tiazolil, tiadiazolil, oxazolil, isoxazolil, furil, pirrolilo, pirazolilo, imidazolil y triazolil, o es un radical parcial o totalmente hidrogenado como oxiranil, oxetanil, oxolanil (=tetrahydrofuril), oxanil, pirrolidil, piperidil, piperazinil, dioxolanil, oxazolinil, isoxazolinil, oxazolidinil, isoxazolidinil y morfolinil. El grupo “heterociclilo” puede ser no sustituido o sustituido, preferentemente por uno o más radicales (preferentemente 1, 2 ó 3 radicales) seleccionados del grupo formado por halógeno, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, alcocarbonilo, alquilcarbonil, formilo, carbamoil, mono- y dialquilaminocarbonil, amino sustituido como acilamino, mono- y dialquilsulfonil, haloalquilsulfonil, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonil, alquilo y haloalquilo, y además también oxo. El grupo oxo también puede estar presente en aquellos átomos de anillo hetero, donde varios números de oxidación son posibles, por ejemplo en el caso de N y S.

El término plagas significa plagas de artrópodos (incluidos insectos y arácnidos) y helmintos (incluidos nematodos).

En las siguientes definiciones preferidas por lo general se debe entender que, cuando los símbolos no están expresamente definidos son como se definieron antes en la descripción.

Preferiblemente R¹ es CN o CSNH₂ (más preferiblemente R¹ es CN).

Preferiblemente R² es Cl.

Preferiblemente W es C-Cl o N (más preferiblemente W es C-Cl).

Preferiblemente R³ es CF₃ o OCF₃ (más preferiblemente R³ es CF₃).

Preferiblemente R⁴ es H, (C₃-C₆)-alquino, (C₃-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, CO₂-(C₁-C₃)-alquilo, CO₂-(C₃-C₆)-alqueno, CO₂-(C₃-C₆)-alquino, CO₂-(CH₂)_mR⁸, (CH₂)_qR⁸, COR⁹, (CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R¹¹, o (C₁-C₆)-alquilo, (C₃-C₆)-alqueno o CO-C_(1-C₆)-alquilo, cuyos tres últimos grupos mencionados son no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales R¹².

ES 2 341 974 T3

Más preferentemente R^4 es (C_1-C_3) -alquilo (más preferiblemente R^4 es metilo).

Preferiblemente R^5 y R^{5a} son cada uno independientemente H o (C_1-C_3) -alquilo (más preferiblemente R y R^{5a} son cada uno H).

5 Preferiblemente R^6 es H o (C_1-C_3) -alquilo (más preferiblemente R^6 es H).

Preferiblemente R^7 es CF_3 , $CFCl_2$ o CF_2Cl (más preferiblemente R^7 es CF_3).

10 Preferiblemente X es O o NH (más preferiblemente X es O).

Preferiblemente Y es Z, COZ^a , CSZ^a o CO_2Z (más preferentemente Y es Z).

15 Preferiblemente s es 1 ó 2.

Una clase preferida de compuestos de fórmula (I) para su uso en la invención es aquella en que:

20 R^1 es CN o $CSNH_2$;

R^2 es Cl;

W es C-Cl o N;

25 R^3 es CF_3 o OCF_3 ;

R^4 es H, (C_3-C_6) -alquínilo, (C_3-C_6) -haloalquínilo, (C_3-C_7) -cicloalquilo, $CO_2-(C_1-C_3)$ -alquilo, $CO_2-(C_3-C_6)$ -alquénilo, $CO_2-(C_3-C_6)$ -alquínilo, $CO_2-(CH_2)_mR^8$, $(CH_2)_qR^8$, COR^9 , $(CH_2)_qR^{10}$ o SO_2R^{11} , O (C_1-C_6) -alquilo, (C_3-C_6) -alquénilo o $CO-C_1-C_6$ -alquilo, cuyos tres últimos grupos mencionados son no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales R^{12} ; R^5 y R^{5a} son cada uno independientemente H o (C_1-C_3) -alquilo;

30 R^6 es H o (C_1-C_3) -alquilo;

R^7 es CF_3 ;

35 X es O o NH;

Y es Z, COZ^a , CSZ^a o CO_2Z , y

40 s es 1 ó 2.

Una clase más preferida de los compuestos de fórmula (I) para su uso en la invención es aquella en que:

45 R^1 es CN;

R^2 es Cl;

W es C-Cl;

50 R^3 es CF_3 ;

R^4 es metilo;

55 R^5 y R^{5a} son cada uno H;

R^6 es H;

R^7 es CF_3 ;

60 X es O;

Y es Z, y

65 s es 1.

ES 2 341 974 T3

Una clase adicionalmente preferida de los compuestos de fórmula (I) es aquella donde:

R¹ es CN;

5 R² es Cl;

W es C-Cl;

10 R³ y R⁷ son cada uno CF₃;

R⁴ es metilo;

R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H;

15 X es O;

Y es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₇)-cicloalquil-(C₁-C₆)-alquilo, bencilo, fenilo o (C₃-C₆)-alque-

20 s es 1 ó 2.

Una clase más preferida de los compuestos de fórmula (I) es aquella donde:

25 R¹ es CN;

R² es Cl;

W es C-Cl;

30 R³ y R⁷ son cada uno CF₃;

R⁴ es metilo;

35 R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H;

X es NR¹⁷;

40 R¹⁷ es H;

Y es piridilo sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno y C_(1-C₆)-haloalquilo, o fenilo sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo y NO₂, o (C₁-C₆)-alquilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno y CO₂R¹³ donde R¹³ es (C₁-C₆)-alquilo, o R¹⁷, Y y el átomo de N adjunto forman un anillo N-

45 morfolinilo o N-piperidinilo, y

s es 1 ó 2.

50 Una clase más preferida de los compuestos de fórmula (I) es aquella donde:

R¹ es CN;

R² es Cl;

55 W es C-Cl;

R³ y R⁷ son cada uno CF₃;

60 R⁴ es metilo;

R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H;

X es NR¹⁷;

65 R¹⁷ es H o (C₁-C₆)-alquilo;

ES 2 341 974 T3

Y es CO-Z en el que Z es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₁-C₆)-alcoxi y OH, o es (C₁-C₇)-alquilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo formado por halógeno, CN, (C₁-C₆)-alcoxi y OR⁸ donde R⁸ es fenilo sustituido por uno o más radicales halógeno, o es piridilo, furanil o tienilo cuyos tres últimos grupos mencionados son no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales halógeno, o

es CHO o CO₂Z donde Z es (C₁-C₆)-alquilo no sustituido o sustituido por R⁸, donde R⁸ es fenilo no sustituido o sustituido con uno o más radicales (C₁-C₆)-alcoxi, o

es el CO₂Z donde Z es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales halógeno, o

es CSNR¹⁹R²⁰ donde R¹⁹ es H y R²⁰ es H, (C₁-C₆)-alquilo o (CH₂)₆R⁸ donde R⁸ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales halógeno, o es COCONR¹⁹R²⁰ donde R¹⁹ y R²⁰ son cada uno H, o

es CONR¹⁹R²⁰ donde R¹⁹ es H y R²⁰ es H o fenilo, o

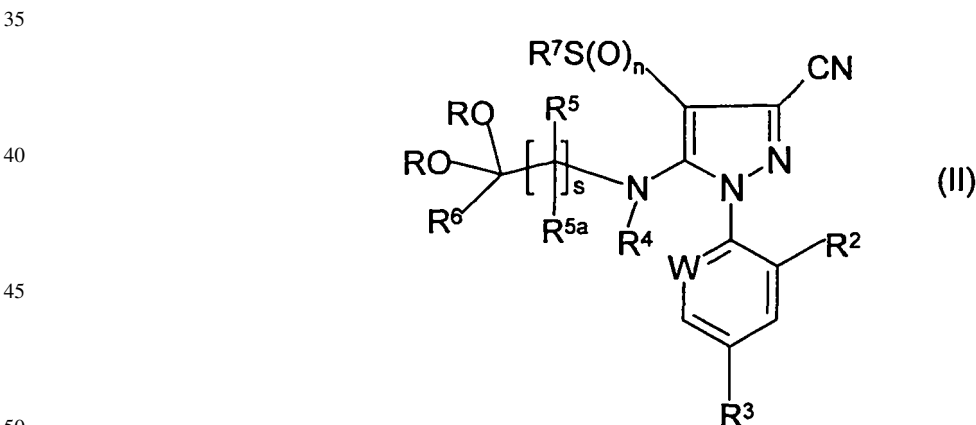
es (C₃-C₆)-cicloalquil-CH₂ o SO₂-(C₁-C₆)-alquilo, y

s es 1 ó 2 (con mayor preferencia s es 2).

Los compuestos de fórmula general (I) pueden prepararse mediante la aplicación o adaptación de los procedimientos conocidos (es decir, los procedimientos usados hasta ahora o descritos en la literatura química).

En la siguiente descripción de los procesos cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no están expresamente definidos, se entiende que son "según la definición anterior" de conformidad con la primera definición de cada símbolo en la especificación.

De acuerdo con otra característica de los compuestos invención de la fórmula (I) donde R¹ es CN, y R², R³, R⁴, R⁵, R^{5a}, R⁶, R⁷, W, X, Y, n y s son como se definió anteriormente, puede ser preparado por la reacción de un compuesto de fórmula (II):



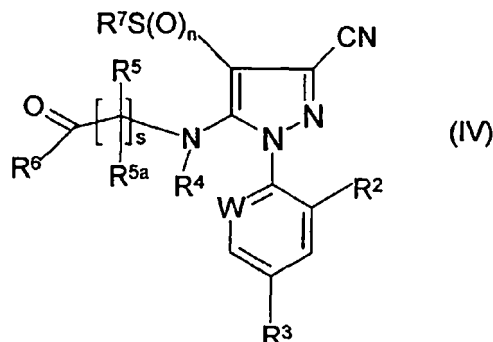
donde R es (C₁-C₆)-alquilo, y los demás valores son los definidos anteriormente, con un compuesto de fórmula (III):



donde X e Y son tal como se define anteriormente, o una sal de ácido del mismo, tales como la sal de clorhidrato. La reacción se realiza generalmente en presencia de un ácido fuerte, como un ácido mineral, por ejemplo el ácido clorhídrico, en un solvente como un alcohol, por ejemplo metanol o dioxano, a una temperatura de entre 0°C hasta la temperatura de reflujo del solvente.

ES 2 341 974 T3

De acuerdo con otra característica de los compuestos de la invención de fórmula (I) donde R¹ es CN, y los demás valores son los definidos anteriormente, también pueden ser preparados por la reacción de un compuesto de fórmula (IV):



en donde los diversos valores son los definidos anteriormente, con un compuesto de fórmula (III) o una sal ácida del mismo, como la sal de clorhidrato. La reacción se realiza generalmente en un solvente como un alcohol por ejemplo metanol, o dioxano, a una temperatura de entre 0°C hasta la temperatura de reflujo del solvente. Cuando se emplea una sal ácida del compuesto de fórmula (III) también está presente una base en la reacción. La base es en general un carbonato de metal alcalino como el carbonato de potasio o carbonato de sodio, o una base orgánica, como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etilidisopropilamina o piridina, o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU).

De acuerdo con una característica adicional de los compuestos de la invención de fórmula (I) donde R¹ es CSNH₂, y los demás valores son los definidos anteriormente, pueden ser preparados por la reacción del correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R¹ es CN, con un álcali o hidrosulfuro de metal alcalino-térreo, como litio, potasio, calcio o, preferentemente, hidrosulfuro de sodio, en un solvente inerte, por ejemplo N, N-dimetilformamida, piridina, dioxano, tetrahydrofurano, sulfolano, dimetilsulfóxido, metanol o etanol a una temperatura de -35°C a 50°C, preferentemente 0°C a 30°C. Opcionalmente, el hidrosulfuro se puede generar *in situ* por el tratamiento con H₂S, en presencia de una base orgánica, como un alcóxido de metal o trialkilamina o una base inorgánica, como un hidróxido alcalino o metal alcalino-térreo o un carbonato, como sodio, potasio o carbonato de amonio. El uso de un agente de complejación metálico, tales como un éter corona, puede resultar muy beneficiosa en la aceleración de la reacción. La reacción de la sal hidrosulfuro con el compuesto de fórmula (I) también puede llevarse a cabo en un sistema de disolvente en dos fases agua/orgánica con un catalizador de transferencia de fase tal como un éter corona o una sal tetraalkilamonio como el bromuro de tetra-n-o butilamonio benziltrimetilamonio cloruro. Los solventes orgánicos adecuados para su uso en un sistema de dos fases con el agua incluyen benceno, tolueno, cloruro de metileno, 1-clorobutano y éter de metilo butilo terciario.

Por otra parte, los compuestos de fórmula (I) donde R¹ es CSNH₂, también pueden ser preparados a partir del correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R¹ es CN, mediante un tratamiento con el reactivo Ph₂PS₂, como se describe en el Tet. Lett., 24 (20), 2059 (1983).

De acuerdo con otra característica de los compuestos de la invención de fórmula (I) donde R¹ es CSNH₂, y los demás valores son los definidos anteriormente, pueden ser preparados por la reacción del correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R¹ es CN, con un bis(trialkilsilil)sulfuro, preferiblemente bis (trimetilsilil)sulfuro, en presencia de una base generalmente un alcóxido metal alcalino como metóxido de sodio, en un solvente como N,N-dimetilformamida, a una temperatura de entre 0°C y 60°C. El procedimiento generalmente es descrito por Lin, Ku y Shiao en la Synthesis 1219 (1992).

De acuerdo con otra característica adicional de los compuestos de la invención de fórmula (I) donde R¹ es C(= N-H)-S-Q y Q, R², R³, R⁴, R⁵, R^{5a}, R⁶, R⁷, W, X, Y, n y s son como se definió anteriormente, pueden ser preparados por la reacción del correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R¹ es CSNH₂ con un agente alquilante de fórmula (V) o (VI):



en donde Q es como se definió anteriormente y L¹ es un grupo saliente, halógenos en general, y preferentemente cloro, bromo o yodo. La reacción se realiza generalmente en presencia de una base, por ejemplo un hidruro de metal alcalino como el hidruro de sodio, o un alcóxido de metales alcalinos como el potasio terc-butóxido, en un solvente inerte como tetrahydrofurano a una temperatura de 0 a 60°C. Alternativamente un carbonato de metal alcalino como

ES 2 341 974 T3

carbonato de potasio, o una base orgánica, como una trialkilamina, por ejemplo trietilamina o N,N-diisopropilamina puede ser utilizada, en un solvente inerte, como acetona, a una temperatura de entre 0°C y hasta la temperatura de reflujo del solvente. Cuando un compuesto de fórmula (VI) como trimetiloxonio tetrafluoroborato se utiliza como agente alquilante, la base es preferentemente un bicarbonato de metal alcalino como el bicarbonato de sodio, el solvente es por ejemplo, diclorometano, y la temperatura es de entre 0°C hasta la temperatura de reflujo del disolvente.

De acuerdo con otra característica de los compuestos de la presente invención de fórmula (I) donde R¹ es C(=N-V)-S-Q, V es como se definió anteriormente con la exclusión de H, y Q, R², R³, R⁴, R⁵, R^{5a}, R⁶, R⁷, W, X, Y, n y s son como se define en la fórmula (I), pueden ser preparados por la alquilación, acilación o sulfonylación del correspondiente compuesto de fórmula (I) donde V es H, con un compuesto de fórmula (VII):



en donde V es como se define anteriormente con la exclusión de H y L² es un grupo saliente. Para alquilaciones, donde V es (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alquenoilo, (C₂-C₆)-alquinoilo o (CH₂)_qR⁸, L² es preferentemente halógeno, alquilsulfonyloxi o arilsulfonyloxi (más preferiblemente cloro, bromo, yodo, metilsulfonyloxi o p-toluenesulfonyloxi). Una base está opcionalmente presente en la reacción que se realiza generalmente en un disolvente inerte como tetrahidrofurano, dioxano, acetonitrilo, tolueno, éter dietílico, diclorometano, dimetilsulfóxido o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de entre -30°C y 200°C, preferentemente a 20°C a 100°C. La base es en general un hidróxido de metal alcalino como el hidróxido de potasio, un hidruro de metal alcalino como el hidruro de sodio, un carbonato de un metal alcalino como el carbonato de potasio o carbonato de sodio, un alcóxido metal alcalino como el metóxido de sodio, carbonato de un metal alcalino-térreo, tal como carbonato de calcio o una base orgánica, como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etilidiisopropilamina o piridina, o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU).

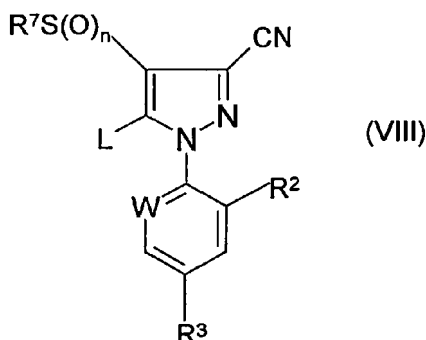
Para acilaciones, donde V es COR¹³ o CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, (VII) es preferentemente un haluro de ácido donde L² es preferentemente cloro o bromo (más preferiblemente de cloro). Una base es opcionalmente presente en la reacción, que generalmente se realiza utilizando bases similares, disolventes y temperaturas empleadas para las alquilaciones.

Para sulfonylaciones, donde V es el SO₂R¹³ o SO₂-(CH₂)_qR⁸; (VII) es preferentemente un haluro de sulfonylo donde L² es preferentemente cloro o bromo (más preferiblemente de cloro). Una base está opcionalmente presente en la reacción, que generalmente se realiza con bases, disolventes y temperaturas similares a las empleadas para las alquilaciones.

De acuerdo con otra característica de los compuestos de la invención de la fórmula (I) donde R¹ es CN, n es 1 ó 2, y los demás valores son los definidos anteriormente, se pueden preparar por oxidación de un compuesto correspondiente en el que n es 0 ó 1. La oxidación se realiza generalmente mediante un perácido como el ácido 3-cloroperbenzoico en un solvente como el diclorometano o 1,2-dicloroetano, a una temperatura de entre 0°C y la temperatura de reflujo del solvente.

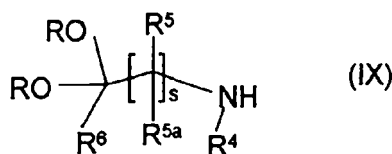
Intermediarios de fórmula (IV) en que los distintos valores son los definidos anteriormente, pueden ser preparados por la reacción de un compuesto de fórmula (II) según lo definido anteriormente, con un ácido, por lo general un ácido mineral, por ejemplo, ácido clorhídrico, o con un trialkilsilil yoduro, por ejemplo yoduro de trimetilsilil en un solvente inerte como diclorometano, a una temperatura de entre 0°C y la temperatura de reflujo.

Intermediarios de fórmula (II) donde los distintos valores son según la definición anterior, pueden ser preparados por la reacción de un compuesto de fórmula (VIII):



ES 2 341 974 T3

donde L es un grupo saliente, generalmente halógeno y preferentemente Br, y los demás valores son los definidos anteriormente, con un compuesto de fórmula (IX):



donde R es (C₁-C₆)-alquilo, y los demás valores son los definidos anteriormente. La reacción se realiza generalmente en presencia de una base, preferentemente, un fosfato de metal alcalino como el fosfato de potasio, en un solvente inerte como el acetonitrilo, a una temperatura de entre 20°C y 100°C.

Las colecciones de compuestos de la fórmula (I), que pueden ser sintetizados por el proceso antes mencionado también se pueden preparar en forma paralela, y esto puede llevarse a cabo manualmente o de forma semiautomática o completamente automática. En este caso, es posible, por ejemplo, automatizar el proceso de la reacción, la elaboración o la purificación de los productos o de los intermediarios. En total, este se debe entender en el sentido de un procedimiento que se describe, por ejemplo, en S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volumen 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

Una serie de aparatos disponibles en el mercado como los que ofrece, por ejemplo, Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, se puede utilizar para el procedimiento paralelo de la reacción y la elaboración. Para la purificación en paralelo de los compuestos de la fórmula (I), o de productos intermedios obtenidos durante la preparación, podrán utilizarse, entre otros, los aparatos de cromatografía, por ejemplo los de la ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Los aparatos mencionados conducen a un procedimiento modular en el cual las etapas de proceso individuales son automáticas, pero operaciones manuales deben realizarse entre las etapas del proceso. Esto puede evitarse mediante el empleo de sistemas de automatización semi-integrados o completamente integrados donde los módulos de automatización en cuestión son operados por, por ejemplo, robots. Estos sistemas de automatización se pueden obtener, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA.

Además de lo que se ha descrito aquí, los compuestos de la fórmula (I) pueden ser preparados en parte o totalmente mediante procedimientos soportados por fases sólidas. Con este fin, las etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada para ajustarse al procedimiento en cuestión están unidas a una resina sintética. Procedimientos de síntesis soportados por fase sólida son descritas ampliamente en la literatura especializada, por ejemplo Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

El uso de procedimientos síntesis soportados por fase sólida permite una serie de protocolos que son conocidos a partir de la literatura y que, a su vez, se pueden realizar manualmente o de forma automatizada. Por ejemplo, el "Procedimiento de bolsitas de té" (Houghten, US 4.631.211; Houghten *et al.*, Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5136), en el cual se emplean los productos de IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA, puede ser semiautomático. La automatización de síntesis paralela soportados por fase sólida se lleva a cabo con éxito, por ejemplo, mediante aparatos de Tecnologías de Argonaut, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, US o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

La preparación de los procesos descritos en este documento produce compuestos de fórmula (I) en forma de colecciones de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención también se refiere a las bibliotecas que comprenden por lo menos dos compuestos de la fórmula (I).

Ciertos compuestos de fórmula (IV) son nuevos y como tal forman parte adicional de la invención. Ciertos compuestos de fórmula (IV), en particular, cuando R⁷ es CF₃ y R⁶ es H también poseen actividad pesticida muy útil, por ejemplo en el control sistémico de *Ctenocephalides felis* (pulga del gato) y actividad de contacto contra *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata del perro Brown).

Un aspecto de la invención se refiere a compuestos de fórmula (IV) en la que:

R² es Cl;

W es C-Cl;

R³ y R⁷ son cada uno CF₃;

R⁴ es metilo, y

R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H, n es 0 ó 1, y s es 2 ó 3.

ES 2 341 974 T3

Ciertos compuestos de fórmula (II) son nuevos y como tal forman parte adicional de la invención.

Compuestos de fórmula (III), (V) y (VI) son conocidos o pueden ser preparados por procedimientos conocidos.

5 Los siguientes ejemplos no limitativos, ilustran la preparación de los compuestos de fórmula (I).

Ejemplos químicos

Espectros de RMN se ejecutaron en deuterocloroformo a menos que se indique otra cosa.

10

En los ejemplos que siguen, las cantidades (también porcentajes) son en base peso, a menos que se indique otra cosa. Las proporciones de los solventes son en base volumen.

15 Ejemplo 1

1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-N-[2-(2-t-butoxicarbonilhidrazono)etil]-N-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol

20 Una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-N-(2,2-dimetoxietil)-N-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (100 mg, 0,2 mmol), t-butilo carbazato 48 mg, 0,4 mmol) y ácido clorhídrico concentrado (5 gotas) en 1,4-dioxano (10 ml) se calentó a 85°C durante 3,5 horas. La mezcla resultante se vierte luego en acetato de etilo (20 ml) y bicarbonato de sodio saturado (20 ml). Las capas se separaron y la fase orgánica se lavó (agua y salmuera), se secó (sulfato de sodio), y se concentró. Purificación por cromatografía a través de gel de sílice eluyendo con acetato de etilo-heptano (4:1 a 1:1) dio el compuesto del título como un sólido blanquecino (Compuesto 3-38, 27,6 mg, 22%, mp 90°C), 19F-RMN: -63,8, -78,9.

25

Ejemplo 2

30

1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-N-(2-etoxiiminoetil)-N-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol

35 Para una mezcla de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-N-(2,2-dimetoxietil)-5-N-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,1 g, 0,2 mmol) y clorhidrato de O-etoxiamina (0,02 g, 0,2 mmol) en metanol (10 mL) se agitó a 20°C durante 1,5 horas, a continuación, durante 4,5 horas a 50°C y 34,5 horas a temperatura reflujo. Porciones de ácido clorhídrico 2N (total 0,35 ml) y ácido clorhídrico concentrado (en total 0,2 ml) se añadieron durante el transcurso de la reacción. Se enfrió y se vertió en agua y acetato de etilo. Las capas se separaron y la capa orgánica se lavó con bicarbonato de sodio saturado y cloruro sódico saturada, se secó (sulfato de sodio), y se concentró. La purificación por cromatografía de gel de sílice eluyendo con acetato de etilo-heptano (9:1 a 4:1) dio el compuesto del título como una mezcla E/Z (compuesto 1-2, 44,7 mg, 0,081 mmol, 40% de rendimiento), 19 F-NMR: -63,77, -63,79, -78,76, -78,83.

40

Los siguientes ejemplos intermedios ilustran la preparación de productos de intermediarios utilizados en la síntesis de los ejemplos anteriores.

45

Ejemplo Intermedio 1

1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-N-(2,2-dimetoxietil)-5-N-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol

50 A una solución de 5-bromo-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfonilpirazol (5,0 g, 9,7 mmol) en acetonitrilo (50 ml) a 20°C se añadió fosfato de potasio (26,1 mmol) y acetal metilamino-acetaldehído dimetil (2,02 g, 16,4 mmol) en atmósfera de nitrógeno. La mezcla resultante se calentó a 50°C durante 6 horas, se enfrió y se vertió en acetato de etilo y de cloruro de amonio saturado. Las capas se separaron y la fase orgánica se lavó (agua y salmuera), se secó (sulfato de sodio) y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía de elución con heptano/acetato de etilo (9:1 - 3:1) para dar el compuesto del título como un sólido blanquecino (2,47 g, 4,45 mmol, 46%), 19F-RMN: -63,7-78,7.

55

Ejemplo Intermedio 2

60 *1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-N-formilmetil-N-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol*

Iodotrimetilsilano (0,156 g, 0,8 mmol) se añadió a una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-N-(2,2-dimetoxietil)-5-N-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (0,35 g, 0,6 mmol) en diclorometano (15 ml), en atmósfera de nitrógeno a 20°C. Después de agitar durante 15 minutos, la mezcla se vertió en una solución medio saturada de bicarbonato de sodio. Las capas se separaron y la fase orgánica se lavó con solución de bisulfito de sodio (10 ml). La mezcla acuosa combinada se extrajo con cloruro de metileno (10 ml), y las capas orgánicas combinadas, secas (sulfato de sodio), y concentras dan el compuesto del título como un aceite de naranja (0,296 g, 0,58 mmol, 92,1%), 19F-RMN: -64,2, -79,1, -79,5.

65

ES 2 341 974 T3

Los siguientes compuestos preferidos que se muestran en las Tablas 1 a 3 también forman parte de la presente invención, y fueron o pueden ser preparados de acuerdo con, o por analogía con los ejemplos antes mencionados 1 a 2 o los procedimientos generales anteriormente descritos. Cuando los subíndices se omiten se presuponen, por ejemplo CH₂ significa CH₂.

En las Tablas Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa n-propilo, i-Pr significa isopropilo, t-Bu significa butilo terciario, OMe significa metoxi, OEt significa etoxi, Ph significa fenilo, CO-(4-Cl Ph) significa 4-clorobenzóilo, y COO-CH₂-(4-OMe Ph) significa (4-metoxibenziloxycarbonil). Los valores de los espectros de RMN-19F desviados se dan en ppm.

Los números compuestos están dados sólo con fines de referencia.

TABLA I

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados: R¹ es CN, R² es Cl; W es C-Cl, R³ y R⁷ son cada uno CF₃, R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H, y X es O

Cdp No.	R ⁴	n	s	Y	mp o RMN-19F
1 - 1	Me	2	1	Me	
1 - 2	Me	2	1	Et	-63,77, -63,78, -78,76, -78,83
1 - 3	Me	2	1	CH ₂ Ph	-64,12, -64,15, -79,32, -79,39
1 - 4	Me	2	1	Ph	-64,20, -64,25, -79,23, -79,31
1 - 5	Me	2	1	t-Bu	-64,19, -79,35
1 - 6	Me	2	1	alilo	-64,19, -79,36
1 - 7	Me	2	1	H	-64,19, -79,22
1 - 8	Me	1	1	Me	

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	n	s	Y	mp o RMN-19F
1 - 9	Me	1	1	Et	
1 - 10	Me	1	1	CH ₂ Ph	
1 - 11	Me	1	1	Ph	
1 - 12	Me	1	1	t-Bu	
1 - 13	Me	1	1	alilo	
1 - 14	Me	1	1	H	
1 - 15	Me	0	1	Me	
1 - 16	Me	0	1	Et	
1 - 17	Me	0	1	CH ₂ Ph	
1 - 18	Me	0	1	Ph	
1 - 19	Me	0	1	t-Bu	
1 - 20	Me	0	1	alilo	
1 - 21	Me	0	1	H	
1 - 22	Me	2	2	Me	
1 - 23	Me	2	2	Et	
1 - 24	Me	2	2	CH ₂ Ph	-63,71, -63,74, -78,62, -78,64
1 - 25	Me	2	2	Ph	
1 - 26	Me	2	2	t-Bu	
1 - 27	Me	2	2	alilo	-63,76, -78,60, -78,63
1 - 28	Me	2	2	H	
1 - 29	Me	0	1	CH ₂ ciclopropilo	
1 - 30	Me	1	1	CH ₂ ciclopropilo	
1 - 31	Me	2	1	CH ₂ ciclopropilo	
1 - 32	Me	0	1	CH ₂ ciclopropilo	
1 - 33	Me	1	1	CH ₂ ciclopropilo	
1 - 34	Me	2	1	CH ₂ ciclopropilo	

ES 2 341 974 T3

TABLA 2

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados: R¹ es CN, R² es Cl; W es C-Cl, R³ y R⁷ son cada uno CF₃, R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H, y X es NR¹⁷

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65

Cdp No.	R ⁴	n	s	R ¹⁷	Y	mp o RMN-19F
2 - 1	Me	2	1	H	3-Cl-5-CF ₃ -2-piridilo	176 °C
2 - 2	Me	2	1	H	CH ₂ COOEt	-63,75, -78,84
2 - 3	Me	2	1	H	3-NO ₂ Ph	94 °C
2 - 4	Me	2	1	H	3,5-Cl ₂ Ph	164 °C
2 - 5	Me	2	1	H	3-F Ph	-64,27, -79,37, -113,22, -113,24, -113,25, -113,27, -113,28, -113,31
2 - 6	Me	2	1	H	Ph 4-Cl	-64,22, -79,35
2 - 7	Me	2	1	H	2-CF ₃ Ph	132 °C
2 - 8	Me	2	1	H	Ph 2-Cl	124 °C
2 - 9	Me	2	1	H	4-Br Ph	80-83 °C
2 - 10	Me	2	1	H	3,4-Cl ₂ Ph	80-86 °C
2 - 11	Me	2	1		N-morfolinilo (a)	-64,17, -79,35
2 - 12	Me	2	1	H	4-Me Ph	164 °C
2 - 13	Me	2	1	H	i-Bu	-64,16, -79,40

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	n	s	R ¹⁷	Y	mp o RMN-19F
5 14	- Me	2	1	H	Ph 3-Cl	151 °C
10 15	- Me	2	1		N-piperidinilo (b)	-64,18, -79,39
15 16	- Me	2	1	H	CH ₂ CF ₃	100 °C
20 17	- Me	2	1	H	3-CF ₃ Ph	155 °C
25 18	- Me	2	1	H	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃ Ph	153 °C
30 19	- Me	2	1	H	2,5-Cl ₂ Ph	161 °C
35 20	- Me	2	1	H	2,3,5,6-F ₄ Ph	114 °C
40 21	- Me	2	1	H	2-Ph F	162 °C
45 22	- Me	2	1	H	2,3,4,5,6-F ₅ Ph	37 °C
50 23	- Me	2	1	H	2,4-Cl ₂ Ph	90 °C
55 24	- Me	1	1	H	3-Cl-5-CF ₃ -2- piridilo	
60 25	- Me	1	1	H	CH ₂ COOEt	
65 26	- Me	1	1	H	3-NO ₂ Ph	
70 27	- Me	1	1	H	3,5-Cl ₂ Ph	

65

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	n	s	R ¹⁷	Y	mp o RMN-19F
5 28	- Me	1	1	H	3-F Ph	
10 29	- Me	1	1	H	Ph 4-Cl	
15 30	- Me	1	1	H	2-CF ₃ Ph	
20 31	- Me	1	1	H	Ph 2-Cl	
25 32	- Me	1	1	H	4-Br Ph	
30 33	- Me	1	1	H	3,4-Cl ₂ Ph	
35 34	- Me	1	1		N-morfolinil (a)	
40 35	- Me	1	1	H	4-Me Ph	
45 36	- Me	1	1	H	i-Bu	
50 37	- Me	1	1	H	Ph 3-Cl	
55 38	- Me	1	1		N-piperidinil (b)	
60 39	- Me	1	1	H	CH ₂ CF ₃	
65 40	- Me	1	1	H	3-CF ₃ Ph	
70 41	- Me	1	1	H	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃ Ph	

65

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	n	s	R ¹⁷	Y	mp o RMN-19F
5 2 42	- Me	1	1	H	2,5-Cl ₂ Ph	
10 2 43	- Me	1	1	H	2,3,5,6-F ₄ Ph	
15 2 44	- Me	1	1	H	2-Ph F	
20 2-45	Me	1	1	H	2,3,4,5,6-F ₅ Ph	
20 2 46	- Me	1	1	H	2,4-Cl ₂ Ph	
25 2 47	- Me	0	1	H	3-Cl-5-CF ₃ -2- piridilo	
30 2 48	- Me	0	1	H	CH ₂ COOEt	
35 2 49	- Me	0	1	H	3-NO ₂ Ph	
40 2 50	- Me	0	1	H	3,5-Cl ₂ Ph	
40 2 51	- Me	0	1	H	3-F Ph	
45 2 52	- Me	0	1	H	Ph 4-Cl	
50 2 53	- Me	0	1	H	2-CF ₃ Ph	
55 2 54	- Me	0	1	H	Ph 2-Cl	
55 2 55	- Me	0	1	H	4-Br Ph	
60 2	- Me	0	1	H	3,4-Cl ₂ Ph	

65

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	n	s	R ¹⁷	Y	mp o RMN-19F
56						
2 57	- Me	0	1		N-morfolinilo (a)	
2 58	- Me	0	1	H	4-Me Ph	
2 59	- Me	0	1	H	i-Bu	
2 60	- Me	0	1	H	Ph 3-Cl	
2 61	- Me	0	1		N-piperidinilo (b)	
2 62	- Me	0	1	H	CH ₂ CF ₃	
2 63	- Me	0	1	H	3-CF ₃ Ph	
2 64	- Me	0	1	H	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃ Ph	
2 65	- Me	0	1	H	2,5-Cl ₂ Ph	
2 66	- Me	0	1	H	2,3,5,6-F ₄ Ph	
2 67	- Me	0	1	H	2-Ph F	
2 68	- Me	0	1	H	2,3,4,5,6-F ₅ Ph	
2 69	- Me	0	1	H	2,4-Cl ₂ Ph	
2	- Me	2	2	H	3-Cl-5-CF ₃ -2-	

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	n	s	R ¹⁷	Y	mp o RMN-19F
70					piridil	
2 71	- Me	2	2	H	CH ₂ COOEt	
2 72	- Me	2	2	H	3-NO ₂ Ph	
2 73	- Me	2	2	H	3,5-Cl ₂ Ph	
2 74	- Me	2	2	H	3-F Ph	
2 75	- Me	2	2	H	Ph 4-Cl	
2 76	- Me	2	2	H	2-CF ₃ Ph	
2 77	- Me	2	2	H	Ph 2-Cl	
2 78	- Me	2	2	H	4-Br Ph	
2 79	- Me	2	2	H	3,4-Cl ₂ Ph	
2 80	- Me	2	2		N-morfolinilo (a)	
2 81	- Me	2	2	H	4-Me Ph	
2 82	- Me	2	2	H	i-Bu	
2 83	- Me	2	2	H	Ph 3-Cl	
2	- Me	2	2		N-piperidinilo (b)	

65

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	n	s	R ¹⁷	Y	mp o RMN-19F
84						
2 85	- Me	2	2	H	CH ₂ CF ₃	-64,24, -72,83, -72,86, -72,89, -79,25
2 86	- Me	2	2	H	3-CF ₃ Ph	
2 87	- Me	2	2	H	2,6-Cl ₂ -4-CF ₃ Ph	
2 88	- Me	2	2	H	2,5-Cl ₂ Ph	
2 89	- Me	2	2	H	2,3,5,6-F ₄ Ph	
2 90	- Me	2	2	H	2-Ph F	
2 91	- Me	2	2	H	2,3,4,5,6-F ₅ Ph	
2 92	- Me	2	2	H	2,4-Cl ₂ Ph	
Nota: (a) NR ¹⁷ -Y es N-morfolinilo (b) NR ¹⁷ -Y es N-piperidinilo						

TABLA 3

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados: R¹ es CN, R² es Cl; W es C-Cl, R³ y R⁷ son cada uno CF₃, R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H, y X es NR¹⁷

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 - 1	Me	H	2	1	CO-(4-CF ₃ Ph)	114 °C

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 - 2	Me	H	2	1	CO-CH ₂ O- (4-F Ph)	76 °C
3 - 3	Me	H	2	1	CO- (6-Cl-3-piridilo)	112 °C
3 - 4	Me	H	2	1	SO ₂ -Me	73 °C
3 - 5	Me	H	2	1	CO- (4-Ph OMe)	203 °C
3 - 6	Me	H	2	1	CO-H	186 °C
3 - 7	Me	H	2	1	CO-n-Pr	165 °C
3 - 8	Me	Me	2	1	CS-NH ₂	186 °C
3 - 9	Me	Me	2	1	CS-NHMe	156 °C
3 - 10	Me	H	2	1	CO- (4-piridilo)	205 °C
3 - 11	Me	H	2	1	CO-n-C ₇ H ₁₅	-64,18, -79,33, -79,47
3 - 12	Me	H	2	1	CO-CH ₂ CN	84 °C
3 - 13	Me	H	2	1	CO- (2-furanilo)	210 °C
3 - 14	Me	H	2	1	CO- (Ph 4-OEt)	104 °C
3 - 15	Me	H	2	1	CO- (Ph 2-Cl)	98 °C
3 - 16	Me	H	2	1	CO- (2-OH Ph)	120 °C
3 - 17	Me	H	2	1	CO- (4-t-Bu Ph)	170 °C
3 - 18	Me	H	2	1	CO- (4-Br Ph)	107 °C
3 - 19	Me	H	2	1	CO-Ph	195 °C
3 - 20	Me	H	2	1	COO-CH ₂ - (4-Ph OMe)	80-84 °C
3 - 21	Me	H	2	1	COO-CH ₂ Ph	75-77 °C
3 - 22	Me	H	2	1	CO-n-Bu	160 °C
3 - 23	Me	H	2	1	CO-CH ₂ CH ₂ OMe	-63,74, -78,79, -78,88

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 - 24	Me	H	2	1	CO-CH ₂ OMe	87 °C
3 - 25	Me	H	2	1	CO-(2-tienilo)	198 °C
3 - 26	Me	H	2	1	COCONH ₂	146 °C
3 - 27	Me	H	2	1	CO-(4-Cl Ph)	100 °C
3 - 28	Me	H	2	1	CS-NHEt	191 °C
3 - 29	Me	H	2	1	CS-NH-(4-Cl Ph)	173 °C
3 - 30	Me	H	2	1	CS-NHPh	185 °C
3 - 31	Me	H	2	1	CS-NH ₂	208 °C
3 - 32	Me	H	2	1	CS-NHMe	-64,13, -79,25
3 - 33	Me	H	2	1	CO-NHPh	206 °C
3 - 34	Me	H	2	1	CO-NH ₂	99 °C dec
3 - 35	Me	H	2	1	COO-Me	-63,80, -78,93.
3 - 36	Me	H	2	1	COO-Et	170 °C
3 - 37	Me	H	2	1	COMe	160 °C
3 - 38	Me	H	2	1	COO-t-Bu	90 °C
3 - 39	Me	H	1	1	CO-(4-CF ₃ Ph)	
3 - 40	Me	H	1	1	CO-CH ₂ O-(4-F Ph)	
3 - 41	Me	H	1	1	CO-(6-Cl-3-piridil)	
3 - 42	Me	H	1	1	CO-Me	
3 - 43	Me	H	1	1	CO-(4-Ph OMe)	
3 - 44	Me	H	1	1	CO-H	
3 - 45	Me	H	1	1	CO-n-Pr	
3 - 46	Me	Me	1	1	CS-NH ₂	

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 - 47	Me	Me	1	1	CS-NHMe	
3 - 48	Me	H	1	1	CO-(4-piridilo)	
3 - 49	Me	H	1	1	CO-n-C ₇ H ₁₅	
3 - 50	Me	H	1	1	CO-CH ₂ CN	
3 - 51	Me	H	1	1	CO-(2-furaniolo)	
3 - 52	Me	H	1	1	CO-(4-OEt Ph)	
3 - 53	Me	H	1	1	CO-(2-Cl Ph)	
3 - 54	Me	H	1	1	CO-(2-OH Ph)	
3 - 55	Me	H	1	1	CO-(4-t-Bu Ph)	
3 - 56	Me	H	1	1	CO-(4-Br Ph)	
3 - 57	Me	H	1	1	CO-Ph	
3 - 58	Me	H	1	1	COO-CH ₂ -(4-OMe Ph)	
3 - 59	Me	H	1	1	COO-CH ₂ Ph	
3 - 60	Me	H	1	1	CO-n-Bu	
3 - 61	Me	H	1	1	CO-CH ₂ CH ₂ OMe	
3 - 62	Me	H	1	1	CO-CH ₂ OMe	
3 - 63	Me	H	1	1	CO-(2-tienilo)	
3 - 64	Me	H	1	1	COCONH ₂	
3 - 65	Me	H	1	1	CO-(4-Cl Ph)	
3 - 66	Me	H	1	1	CS-NHEt	
3 - 67	Me	H	1	1	CS-NH-(4-Cl Ph)	
3 - 68	Me	H	1	1	CS-NHPh	
3 - 69	Me	H	1	1	CS-NH ₂	
3 - 70	Me	H	1	1	CS-NHMe	

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 - 71	Me	H	1	1	CO-NHPh	
3 - 72	Me	H	1	1	CO-NH ₂	
3 - 73	Me	H	1	1	COO-Me	
3 - 74	Me	H	1	1	COO-Et	
3 - 75	Me	H	1	1	COMe	
3 - 76	Me	H	1	1	COO-t-Bu	
3 - 77	Me	H	0	1	CO-(4-CF ₃ Ph)	
3 - 78	Me	H	0	1	CO-CH ₂ O-(4-F Ph)	
3 - 79	Me	H	0	1	CO-(6-Cl-3-piridil)	
3 - 80	Me	H	0	1	CO-Me	
3 - 81	Me	H	0	1	CO-(4-OMe Ph)	
3 - 82	Me	H	0	1	CO-H	
3 - 83	Me	H	0	1	CO-n-Pr	
3 - 84	Me	Me	0	1	CS-NH ₂	
3 - 85	Me	Me	0	1	CS-NHMe	
3 - 86	Me	H	0	1	CO-(4-piridil)	
3 - 87	Me	H	0	1	CO-n-C ₇ H ₁₅	
3 - 88	Me	H	0	1	CO-CH ₂ CN	
3 - 89	Me	H	0	1	CO-(2-furanil)	
3 - 90	Me	H	0	1	CO-(4-OEt Ph)	
3 - 91	Me	H	0	1	CO-(2-Cl Ph)	
3 - 92	Me	H	0	1	CO-(2-OH Ph)	
3 - 93	Me	H	0	1	CO-(4-t-Bu Ph)	

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 - 94	Me	H	0	1	CO-(4-Br Ph)	
3 - 95	Me	H	0	1	CO-Ph	
3 - 96	Me	H	0	1	COO-CH ₂ -(4-OMe Ph)	
3 - 97	Me	H	0	1	COO-CH ₂ Ph	
3 - 98	Me	H	0	1	CO-n-Bu	
3 - 99	Me	H	0	1	CO-CH ₂ CH ₂ OMe	
3 - 100	Me	H	0	1	CO-CH ₂ OMe	
3 - 101	Me	H	0	1	CO-(2-tienilo)	
3 - 102	Me	H	0	1	COCONH ₂	
3 - 103	Me	H	0	1	CO-(4-Cl Ph)	
3 - 104	Me	H	0	1	CS-NH ₂ t	
3 - 105	Me	H	0	1	CS-NH-(4-Cl Ph)	
3 - 106	Me	H	0	1	CS-NHPh	
3 - 107	Me	H	0	1	CS-NH ₂	
3 - 108	Me	H	0	1	CS-NHMe	
3 - 109	Me	H	0	1	CO-NHPh	

65

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 110	- Me	H	0	1	CO-NH ₂	
3 111	- Me	H	0	1	COO-Me	
3 112	- Me	H	0	1	COO-Et	
3 -113	Me	H	0	1	COMe	
3 -114	Me	H	0	1	COO-t-Bu	
3 -115	Me	H	2	2	CO-(4-CF ₃ Ph)	-63,60, -63,75, -78,80
3 -116	Me	H	2	2	CO-CH ₂ O-(4-F Ph)	
3-117	Me	H	2	2	CO-(6-Cl-3-piridilo)	-63,71, -78,76
3 118	- Me	H	2	2	CO-Me	
3 -119	Me	H	2	2	CO-(4-OMe Ph)	-63,72, -78,75
3 -120	Me	H	2	2	CO-H	
3 -121	Me	H	2	2	CO-n-Pr	-63,72, -78,68
3 -122	Me	Me	2	2	CS-NH ₂	-63,66, -78,61, -78,62, -78,63, -78,65
3 123	- Me	Me	2	2	CS-NHMe	
3 -124	Me	H	2	2	CO-(4-piridilo)	
3 -125	Me	H	2	2	CO-n-C ₇ H ₁₅	
3 -126	Me	H	2	2	CO-CH ₂ CN	-63,72, -78,67
3 -127	Me	H	2	2	CO-(2-furanilo)	

65

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 -128	Me	H	2	2	CO-(4-OEt Ph)	-63,72, -78,74
3 -129	Me	H	2	2	CO-(2-Cl Ph)	-63,64, -63,72, -78,71, -78,73
3 -130	Me	H	2	2	CO-(2-OH Ph)	
3 -131	Me	H	2	2	CO-(4-t-Bu Ph)	-63,72, -78,72
3 -132	Me	H	2	2	CO-(4-Br Ph)	-63,71, -78,74
3 -133	Me	H	2	2	CO-Ph	-63,72, -78,74
3 -134	Me	H	2	2	COO-CH ₂ -(4-OMe Ph)	-63,70, -78,73
3 -135	Me	H	2	2	COO-CH ₂ Ph	-63,71, -78,75
3 -136	Me	H	2	2	CO-n-Bu	-63,73, -78,67
3 -137	Me	H	2	2	CO-CH ₂ CH ₂ OMe	-63,71, -63.73, -78,67, -78,72
3 -138	Me	H	2	2	CO-CH ₂ OMe	
3 -139	Me	H	2	2	CO-(2-tienilo)	-63,69, -78,63
3 -140	Me	H	2	2	COCONH ₂	
3 -141	Me	H	2	2	CO-(4-Cl Ph)	-63,72, -78,75
3 -142	Me	H	2	2	CS-NH ₂ t	
3 -143	Me	H	2	2	CS-NH-(4-ClPh)	
3 -144	Me	H	2	2	CS-NHPh	
3 -145	Me	H	2	2	CS-NH ₂	
3 -146	Me	H	2	2	CS-NHMe	
3 -147	Me	H	2	2	CO-NHPh	
3-148	Me	H	2	2	CO-NH ₂	-63,70, -78,63
3 -149	Me	H	2	2	COO-Me	-63,75, -78,76

ES 2 341 974 T3

Cdp No.	R ⁴	R ¹ ₇	n	s	Y	mp o 19 F-RMN
3 -150	Me	H	2	2	COO-Et	-63,74, -78,72
3 -151	Me	H	2	2	COMe	
3 -152	Me	H	2	2	COO-t-Bu	
3 -153	Me	H	2	2	SO ₂ Me	-63,70, -78,68
3 -154	Me	H	2	2	COO-(4-F Ph)	-63,73, -78,75, -121,73 a -121,79 (m)

De acuerdo con otra característica de la presente invención, se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un lugar que comprende la aplicación a las mismas de una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo en donde dicho procedimiento es *ex vivo*. Para este fin, dicho compuesto se utiliza normalmente en la forma de una composición pesticida (es decir, en asociación con diluyentes o portadores compatibles y/o agentes activadores de superficie adecuados para su uso en composiciones de pesticidas), como se describe por ejemplo en lo sucesivo.

El término “compuesto de la invención” utilizado en lo sucesivo, abarca un 5-(oximinoalquil- y hidrazonoalquil-amino)pirazol de fórmula (I) según la definición anterior y una sal de pesticidamente aceptable del mismo.

Un aspecto de la presente invención según lo definido anteriormente es un procedimiento *ex vivo* para el control de plagas en un lugar. El lugar incluye, por ejemplo, la plaga en sí, el lugar (planta, campo, bosque, huerto, cauce, suelo, producto vegetal, o similares), donde la plaga reside o se alimenta, o un lugar susceptible a la infestación futura por la plaga. El compuesto de la invención puede por lo tanto aplicarse directamente a la plaga, al lugar donde la plaga reside o se alimenta, o por el lugar susceptible a la infestación futura por la plaga.

Como se desprende de los anteriores usos como pesticida, la presente invención proporciona compuestos pesticidamente activos y procedimientos de utilización de dichos compuestos para el control de un número de especies de plagas que incluye: artrópodos, especialmente insectos y ácaros, o nematodos de las plantas. El compuesto de la invención por lo tanto podría ser ventajosamente empleado en usos prácticos, por ejemplo, en los cultivos agrícolas u hortícolas, en el sector forestal, en medicina veterinaria o zootecnia, o en la salud pública.

Los compuestos de la invención pueden ser utilizados por ejemplo en las siguientes aplicaciones y sobre las siguientes plagas:

Para el control de insectos del suelo, como gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de raíz, gusano de alambre, gorgojos de raíz, gusanos barrenadores del tallo, gusanos cortadores, áfidos de raíz o gusanos. También pueden utilizarse para proporcionar actividad frente a nematodos patógenos, como el de la agalla, quiste, daga, lesión, o tallo o nematodos bombilla, o contra los ácaros. Para el control de plagas del suelo, por ejemplo, gusano de la raíz del maíz, los compuestos son ventajosamente aplicados o incorporados a una tasa efectiva en el suelo en que se siembran o se plantan los cultivos o a las semillas o las raíces de las plantas en crecimiento.

En el área de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la suciedad u otras plagas de dípteros, como las moscas, moscas estables, moscas soldado, moscas de los cuernos, tábanos de las ovejas, tábanos de los caballos, mosquitos, polillas, moscas negras, o mosquitos.

En la protección de productos almacenados, por ejemplo cereales, incluido el grano o la harina, maní, alimentos para animales, madera o artículos para el hogar, por ejemplo, alfombras y textiles, compuestos de la invención son útiles contra los ataques de los artrópodos, los escarabajos sobre todo, incluyendo gorgojos, polillas y ácaros, por ejemplo *Ephestia* spp. (polillas de la harina), *Anthrenus* spp. (escarabajos de la alfombra), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos de granos) o ácaros spp. (ácaros).

En el control de cucarachas, hormigas o termitas o las plagas de artrópodos similares en instalaciones domésticas o industriales infestadas o en el control de larvas de mosquitos en los cursos de agua, pozos, embalses u otras aguas corrientes o estancadas.

ES 2 341 974 T3

Para el tratamiento de las cimientos, estructuras o el suelo en la prevención del ataque a la construcción por las termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp. *Heterotermes* spp., *Coptotermes* spp.

5 En la agricultura contra los adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y polillas), por ejemplo, *Heliothis* spp. como *Heliothis virescens* (gusano de la yema del tabaco), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), por ejemplo *Anthonomus* spp. por ejemplo *grandis* (picudo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata), *Diabrotica* spp. (gusanos de las raíces del maíz). Contra Heteroptera (Hemiptera y Homoptera), por ejemplo *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* ssp., *Nephotettix* spp. (saltamontes de las hojas de arroz), *Nilaparvata* spp.

10 Contra Diptera por ejemplo, *Musca* spp. Contra Thysanoptera como *Thrips tabaci*. Contra Orthoptera como *Locusta* y especies de *Schistocerca* spp., (langostas y grillos), por ejemplo *Gryllus* spp., y *Acheta* spp. por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides* y *Schistocerca gregaria*. Contra Collembola por ejemplo, *Periplaneta* spp. y *Blattella* spp. (cucarachas). Contra los artrópodos de interés agrícola, como Acari (ácaros), por ejemplo *Tetranychus* spp., y *Panonychus* spp.

20 Contra los nematodos que atacan las plantas o árboles de importancia para la agricultura, la silvicultura o la horticultura ya sea directamente o por propagación de enfermedades de las plantas causadas por bacterias, virus, micoplasmas u hongos. Por ejemplo los nematodos agalladores como *Meloidogyne* spp. (por ejemplo, *M. incognita*).

25 En el campo de la medicina veterinaria y cría de ganado o en el mantenimiento de la salud pública en contra de los artrópodos, que son parásitos internos o externos a los vertebrados, en especial los vertebrados de sangre caliente, por ejemplo, animales domésticos, por ejemplo, bovinos, ovinos, caprinos, equinos, porcinos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo Acarina, incluyendo garrapatas (por ejemplo, las garrapatas de cuerpo blando como *Argasidae* spp. *Argas* por ejemplo spp. y *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Omithodoros moubata*); las garrapatas de cuerpo duro incluyendo *Ixodidae* spp., por ejemplo, *Boophilus* spp. por ejemplo, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp. por ejemplo, *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*, ácaros (por ejemplo, *Damalinea* spp.); pulgas (por ejemplo, *Ctenocephalides* spp. *Ctenocephalides felis* por ejemplo (pulga del gato) y *Ctenocephalides canis* (pulga del perro)); por ejemplo, piojos *Menopon* spp.; Diptera (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); Hemiptera.; Dictyoptera (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blattella* spp.); Hymenoptera; por ejemplo, contra las infecciones del tracto gastro-intestinal causada por los gusanos nematodos parásitos, por ejemplo de los miembros de la familia *Trichostrongylidae*.

35 En un aspecto preferido de la invención, los compuestos de fórmula (I) se utilizan para el control de parásitos de animales. Preferentemente, el animal a tratar es un animal doméstico de compañía, tal como un perro o un gato.

En otro aspecto de la invención, los compuestos de fórmula (I) o sus sales o composiciones se utilizan para la preparación de un medicamento de uso veterinario.

40 Otra característica de la invención pues, se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo, o de una composición del mismo, para el control de plagas, en donde dicho uso es *ex vivo*.

45 En uso práctico para el control de artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o helmintos, especialmente nematodos parásitos de plantas, un procedimiento, por ejemplo, comprende aplicar a las plantas o al medio en el que crecen una cantidad efectiva de un compuesto de la invención. Mediante este procedimiento, el compuesto de la invención se aplica generalmente al lugar en el que la infestación de nematodos o artrópodos se tiene que controlar con un índice efectivo en un intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg de la sustancia activa por hectárea y del sitio tratado. En condiciones ideales, en función de la plaga a controlar, un índice más bajo puede ofrecer una protección adecuada. Por otra parte, condiciones climáticas adversas, resistencia de los factores de plagas u otros pueden requerir que el ingrediente activo se utilice en mayor proporción. La velocidad óptima depende generalmente de una serie de factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se controla, el tipo o la etapa de crecimiento de la planta infestada, la distancia entre líneas o también el procedimiento de aplicación. Preferiblemente, un intervalo de índices efectivos del compuesto activo es de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha.

55 Cuando una plaga se transmite por el suelo, el compuesto activo generalmente en una composición formulada, se distribuye uniformemente sobre el área a tratar (es decir, por ejemplo tratamiento de difusión o banda) de cualquier forma conveniente y se aplica con índice de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g ai/ha, preferentemente entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 200 g ai/ha. Cuando se aplica como inmersión en la raíz de plántulas o riego por goteo en plantas, la solución o suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg ai/l, preferentemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ai/l. La aplicación se puede realizar, si se desea, al campo o área de cultivo en general o en las proximidades de la semilla o vegetal que deba protegerse de los ataques. El compuesto de la invención se puede lavar en el suelo por pulverización con agua sobre la zona o se puede dejar a la acción natural de las lluvias. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado puede, si se desea, distribuirse mecánicamente en el suelo, por ejemplo, mediante labranza, arado de disco, 65 o usando cadenas de arrastre. La aplicación puede ser anterior a la plantación, en la siembra, después de la plantación, pero antes de que la germinación haya tenido lugar, o después de la germinación.

ES 2 341 974 T3

El compuesto de la invención y los procedimientos de control de plagas con el mismo son de especial valor en la protección campos, forrajes, plantaciones, invernaderos, cultivos de huerto o viñedos, plantas ornamentales, o cereales de plantaciones o árboles de bosques, por ejemplo: (tal como trigo o arroz), algodón, hortalizas (tal como pimientos), cultivos de campo (tal como remolacha azucarera, soja o semillas oleaginosas), cultivos forrajeros o praderas (tal como maíz o sorgo), huertos o bosques (tal como frutas o cítricos con hueso), plantas ornamentales, flores u hortalizas, en invernadero o arbustos en jardines o parques, o árboles de bosques (tanto de hoja caduca como de hoja perenne) en bosques, plantaciones o viveros. También son útiles en la protección de madera (de pie, derribada, convertida, almacenada o estructural) de ataques, por ejemplo, de moscas de sierra o escarabajos o termitas. Tienen aplicaciones en la protección de productos almacenados, tal como granos, frutas, frutos secos, especias o tabaco, ya sea enteros, triturados o compuestos en productos, de ataques de polillas, escarabajos, ácaros o granos de gorgojo. También están protegidos productos de origen animal almacenados, tales como pieles, pelo, lana o plumas en forma natural o transformada (por ejemplo, como alfombras o textiles) de ataque de plagas de escarabajos o cascarudos, así como carne, pescado o granos de ataques de escarabajos, ácaros o moscas.

Además, el compuesto de la invención y los procedimientos de uso del mismo son de particular valor en el control de artrópodos o helmintos que son perjudiciales, o que se propagan o actúan como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, las mencionadas anteriormente, y más especialmente en el control de garrapatas, ácaros, piojos, pulgas, mosquitos, o moscas mordedoras, molestas o de miasis. Los compuestos de la invención son particularmente útiles en el control de artrópodos o helmintos que están presentes en animales domésticos huéspedes o que se alimentan en o sobre la piel o que chupan la sangre de los animales, para los cuales se puede administrar por vía oral, parenteral, por vía percutánea o por vía tópica.

Las composiciones que se describe a continuación para su aplicación en la producción de cultivos o sitios de crecimiento de cultivos o como tratamiento de semillas pueden, en general, emplearse alternativamente en la protección de productos almacenados, artículos para el hogar, bienes o áreas del medio ambiente en general. Los medios adecuados para la aplicación de los compuestos de la invención incluyen: a cultivos en crecimiento como aplicaciones foliares (por ejemplo, como un aerosol), polvo, gránulos, nebulizaciones o espumas o también como suspensiones encapsuladas o composiciones finamente divididas, tal como tratamientos de suelo o raíces mediante líquidos, polvos, granulados, humos o espumas; a semillas de cultivos a través de aplicación, tal como tratamiento de semillas, por ejemplo, mediante mezclas de líquidos o polvos; a animales infectados o expuestos a infestación por artrópodos o helmintos, por vía parenteral, oral o aplicación tópica de composiciones en las que el ingrediente activo presenta una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo mediante la incorporación en la alimentación adecuada o formulaciones farmacéuticas que se pueden ingerir por vía oral, cebos comestibles, depósitos de sal, suplementos dietéticos, formulaciones de vertido, aerosoles, baños, inmersiones, duchas, chorros de gas, polvo, grasas, champús, cremas, manchas de cera o sistemas de auto-tratamiento de ganado; para el medio ambiente en general o para determinados lugares donde las plagas pueden estar al acecho, incluyendo productos almacenados, madera, artículos para el hogar, o instalaciones domésticas o industriales, tal como aerosoles, nebulizaciones, polvos, humos, manchas de cera, lacas, gránulos o cebos, o en gotas en agua, pozos, embalses u otras corrientes o agua estancada.

Los compuestos de fórmula (I) son particularmente útiles para el control de parásitos de animales cuando se aplican por vía oral, y en otro aspecto preferido de la invención los compuestos de fórmula (I) se utilizan para el control de parásitos de animales mediante aplicación oral. Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales se pueden administrar antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de la fórmula (I) o sus sales pueden mezclarse con un portador y/o alimentos.

El compuesto de la fórmula (I) o sal del mismo es administrado por vía oral en una dosis a los animales generalmente un rango de dosis de 0,1 a 500 mg/kg del compuesto de la fórmula (I) o sal del mismo por kilogramo de peso corporal del animal (mg/kg).

La frecuencia de tratamiento del animal, preferentemente el animal doméstico a tratar mediante el compuesto de la fórmula (I) o una sal del mismo es generalmente de aproximadamente de una vez por semana a una vez al año, preferiblemente de una vez cada dos semanas a una vez cada tres meses.

Los compuestos de la invención pueden administrarse más ventajosamente con otro material parasiticidamente efectivo, tal como un endoparasiticida, y/o un ectoparasiticida, y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, estos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas tal como avermectinas o milbemicinas por ejemplo, ivermectina, piratel o un regulador de crecimiento de insectos, tal como lufenurón o metopreno.

En otro aspecto preferido de la invención, los compuestos de fórmula (I) se utilizan para proporcionar un largo período de control efectivo de parásitos de animales después de una aplicación única por vía oral.

Los compuestos de la fórmula (I) también pueden ser empleados para el control de organismos nocivos en los cultivos de plantas conocidas de ingeniería genética o ingeniería genética de plantas aún por desarrollar. Como regla general, las plantas transgénicas se distinguen por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo, por resistencias a determinados agentes de protección de cultivos, resistencias a enfermedades de las plantas o patógenos de enfermedades de las plantas, tales como insectos o microorganismos particulares, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al producto de la cosecha con respecto a la cantidad, calidad, ca-

ES 2 341 974 T3

racterísticas de almacenamiento, composición y componentes específicos. Así, se conocen plantas transgénicas donde el contenido de almidón es mayor, o la calidad del almidón se altera, o cuando el producto de la cosecha tiene una composición de ácidos grasos diferente.

5 Se prefiere el uso de cultivos transgénicos de importancia económica de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, yuca y maíz o cultivos adicionales de remolacha azucarera, algodón, soja, semillas oleaginosas, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de verduras.

10 Cuando se utiliza en cultivos transgénicos, en particular los que tienen resistencias a los insectos, los efectos se observan frecuentemente, además de los efectos contra organismos nocivos que deben observarse en otros cultivos, que son específicos para su aplicación en el cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo, un espectro ampliado o específicamente alterado de parásitos que pueden ser controlados, o índices de aplicación de alteración que pueden ser empleados para su aplicación.

15 La invención, por lo tanto, también se refiere a la utilización de compuestos de la fórmula (I) para el control de organismos nocivos en plantas de cultivos transgénicos.

20 De acuerdo con otra característica de la presente invención, se proporciona una composición pesticida que comprende uno o más compuestos de la invención según lo definido anteriormente, en asociación con, y preferentemente homogéneamente dispersos en uno o varios diluyentes o portadores compatibles pesticidamente aceptables y/o agentes tensioactivos [es decir, diluyentes o portadores y/o agentes tensioactivos del tipo generalmente aceptado en la técnica como adecuados para su uso en composiciones pesticidas y que sean compatibles con los compuestos de la invención].

25 En la práctica, los compuestos de la invención más frecuentemente forman parte de las composiciones. Estas composiciones se pueden emplear para el control de artrópodos, especialmente insectos, o nematodos y ácaros de plantas. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica adecuado para su aplicación a la plaga deseada en cualquier local o en interiores o zonas al aire libre. Estas composiciones contienen al menos un compuesto de la invención como el ingrediente activo en combinación o asociación con uno o varios componentes más compatibles que son, por ejemplo, portadores sólidos o líquidos o diluyentes, adyuvantes, agentes tensioactivos, o similares adecuados para el uso previsto y que son agrónomicamente o medicinalmente aceptables. Estas composiciones, que se pueden preparar mediante cualquier forma conocida en la técnica, también forman parte de esta invención.

35 Los compuestos de la invención, en sus formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

40 Los pesticidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

Componentes preferidos en las mezclas son:

45 *Insecticidas/acaricidas/nematocidas:*

1. *Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE)*

50 1.1 carbamatos (por ejemplo alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, azametifos, bendiocarb, benfurcarb, bufencarb, butacarb, butocarboxima, butoxicarboxima, carbaril, carbofurano, carbosulfán, cloetocarb, coumafos, cianofenfos, cianofos, dimetilano, etiofenarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocab, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamil, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimethacarb, XMC, xililcarb)

55 1.2 organofosfatos (por ejemplo acefato, azametifos, azinfos (-metil, -etil), bromofos-etilo, bromfenvinfos (-metilo), butatofos, cadusafos, carbofenotión, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metil/-etil), coumafos, diclorvos cianofenfos, cianofos, demetón-s-metilo, demetón-metilsulfona-s, dialifos, diazinón, diclofention, DDVP/dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfotonsulfona, EPN, etiión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fensulfotión, fentiión, flupirazofos, fonofos, formotión, fosmetilano, fostiazato, heptenofos, iodofenfos, iprobenfos, isazofos, isofenfos, isopropilo o-salicilato, isoxatión, malatión, mecarbam, metacrifos, metamidofos, metidatión, mevinfós, monocrotofos, naled, ometoato oxidemetón-metilo, paratión (-metil/-etil), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, fosfocarb, foxim, pirimifos (-metil/-etil), profenofós, propafos, propetamfos, protiofos, protoate, piraclofos, piridantión, piridatión, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclórforon, vamidotión)

65

ES 2 341 974 T3

2. Moduladores de canales de sodio/bloqueadores de canales de sodio dependientes del voltaje

2.1 piretroides (por ejemplo acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina-s-isómero ciclopentilo, bioetanometrina, biopermetrina, biorresmetrina, clovaportrina, cipermetrina cis, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrín, cipermetrina (alfa, beta, theta, zeta), cifenotrina, DDT deltametrina,, empentrina (1R-isómero), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imiprotina, cadertrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-trans-), fenotrina (1R-isómero trans), Praletrina, proflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, teralletrina, tetrametrina (1R-isómero), tralometrina, Transflutrina, Zxi 8901, piretrinas (piretroide))

2.2 oxadiazinas (por ejemplo indoxacarbo)

3. Agonistas/antagonistas de receptores de acetilcolina

3.1 cloronicotínicos/neonicotinoides (por ejemplo, acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid, tiametoxam)

3.2 nicotina, bensultap, cartap

4. Moduladores receptores de acetilcolina

4.1 espinosinas (por ejemplo espinosad)

5. Antagonistas del canal de cloruro GABA-controlados

5.1 organoclorados ciclodienos (por ejemplo, canfecloro, clordano, endosulfán, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro)

5.2 fiproles (por ejemplo acetoprol, Etiprol, fipronil, vaniliprol)

35

6. Activadores del canal de cloruro

6.1 mectinas (por ejemplo, abamectina, avermectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemectina, milbemicina)

40

7. Miméticos de hormona juvenil

(por ejemplo diofenolano, epofenonana, fenoxicarb, hidropreno, quinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno)

45

8. Agonistas/disruptores de ecdisona

8.1 diacilhidracinas (por ejemplo cromafenocida, halofenocida, metoxifenocida, tebufenozide)

50

9. Inhibidores de biosíntesis de quitina

9.1 benzoilureas (por ejemplo bistriflurón, clofluazurón, diflubenzurón, fluazurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón, triflumurón)

55

9.2 buprofecina

9.3 ciromacina

60

10. Inhibidores de fosforilación oxidativa, disruptores TP A

10.1 diafentiurón

65

10.2 organoestánicos (por ejemplo azociclotina, cihexatina, fenbutaestán-óxido)

ES 2 341 974 T3

11. *Desacopladores de fosforilación oxidativa que actúan mediante la interrupción del gradiente H-protón*

11.1 pirroles (por ejemplo clorfenapira)

5 11.2 dinitrofenoles (por ejemplo binapacirl, dinobutón, dinocap, DNOC)

12. *Inhibidores de transporte de electrones del sitio-I*

10 12.1 METIs (por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad)

12.2 hidrametilnona

15 12.3 dicofol

13. *Inhibidores de transporte de electrones de sitio-II*

20 13.1 rotenona

14. *Inhibidores de transporte de electrones de sitio-III*

25 14.1 acequinocilo, fluacripirima

15. *Disruptores microbianos de la membrana intestinal del insecto*

30 cepas de *Bacillus thuringiensis*

16. *Inhibidores de la síntesis de grasa*

35 16.1 Ácidos tetrónicos (por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno)

40 16.2 Ácidos tetrámicos [por ejemplo, 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-4-il etil carbonato (alias: ácido carbónico, 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-4-il etil éster, CAS Reg. No.: 382608-10-8) y ácido carbónico, cis-3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-4-il etil éster (CAS Reg. No.: 203313-25-1)]

17. *Carboxamidas*

45 (Por ejemplo flonicamida)

18. *Agonistas octopaminérgicos*

50 (Por ejemplo amitraz)

19. *Inhibidores de ATPase estimulada con magnesio*

55 (Por ejemplo propargita)

20. *Ftalamidas*

60 (Por ejemplo N²-[1,1-dimetil-2-(metilsulfonilo)etil]-3-yodo-N¹-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1,2-bencenodicarboxamida (CAS Reg. No.: 272451-65-7), flubendiamida)

21. *Análogos de nereistoxina*

65 (Por ejemplo oxalato de hidrógeno tiociclám, tiosultap-sodio)

ES 2 341 974 T3

22. *Productos biológicos, hormonas o feromonas*

(Por ejemplo azadiractina, *Bacillus* spec., *Beauveria* spec., codlemona, *Metarrhizium* spec., *Paecilomyces* spec., turingiensina, *Verticillium* spec.)

5

23. *Compuestos activos con mecanismos de acción desconocidos o inespecíficos*

23.1 fumigantes (por ejemplo, fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfuro)

10

23.2 antialimentadores selectivos (por ejemplo, criolita, flonicamida, pimetrocina)

23.3 Inhibidores de crecimiento de ácaros (por ejemplo clofentecina, etoxazol, hexitiazox)

15

23.4 amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezina, quinometionato, clordimeformo, clorobencilato, cloropicrina, clotiazobeno, ciclopreno, ciflumetofeno, diciclanilo, fenoxacrim, fentripanil, flubencimina, flufenimer, flutencina, gossyplure, hidrametilnona, japoniluro, metoxadiazona, petróleo, piperonilo butóxido, potasio oleato, pirafuprola, piridalilo, piriprolo, sulfluramida, tetradifón, tetrasul, triaraten, verbutin,

20

y también el compuesto 3-metilfenil propilcarbamato (tsumacido Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinilo)-8-(2,2,2-trifluoroetil)-8-azabicyclo[3.2.1]octano-3-carbonitrilo (CAS Reg. N° 185982-80-3) y el correspondiente isómero 3-endo (CAS Reg. N° 185984-60-5) (véase WO 96/37494, WO 98/25923), y las preparaciones que comprenden extractos de plantas insecticidamente activos, nematodos, hongos o virus.

25

Ejemplos de socios de mezcla de fungicidas adecuados se pueden seleccionar en la lista siguiente:

Inhibición de síntesis de ácidos nucleicos:

30

benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, chiralaxilo, clocilación, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metala-xil-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico

Inhibición de mitosis y división celular:

35

benomilo, carbendazima, dietofencarb, fuberidazol, pencicurón, tiofanato-metil tiabendazol, zoxamida

Inhibición de la respiración:

40

CI: diflumetorim

CII: boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida

45

CIII: azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, trifloxistrobina,

Desacopladores:

50

dinocap, fluazinam

Inhibición de la producción de ATP:

55

acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam

Inhibición de la biosíntesis de proteínas y AA:

60

andopríma, blastocidina-S, ciprodinil, casugamicina, hidrato de clorhidrato de casugamicina, mepanipiríma, piri-metanil,

65

Inhibición de la transducción de señales:

fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifeno

ES 2 341 974 T3

Inhibición de la síntesis de lípidos y membranas:

clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina pirazofos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotilano tolclofós-metilo, bifenilo iodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

5

Inhibición de biosíntesis de ergosterol:

fenhexamida, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, sulfato de propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, Nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimofo, dodemofo acetato, fenpropimorfo, tridemofo, fenpropidina, espiroxamina naftifina, piributicarb, terbinafina,

15

Inhibición de síntesis de la pared celular:

bentiavalicarbo, bialafos, dimetomorfo, flumorfo, iprovalicarbo, polioxinas, polioxorima, validamicina A

20

Inhibición de biosíntesis de melanina:

carpropamida, diclocimeta, fenoxanilo, ftaluro, piroquilón, triciclazol,

25

Inductor de defensa huésped:

acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil

30

Multisitio:

captafol, captan, clorotalonilo, preparados de cobre, tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, cobre-oxina y mezcla de Burdeos, diclofuanida, ditianona, dodina, dodina de base libre, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatiemo, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, zinc metiram, propineb, azufre y preparados de azufre tales como polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanida, zineb, ziram,

40

Desconocido:

Metilsulfato de amibromdol, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, cloropicrina, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, diclorano, difenzoquat, difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, fluopicloruro, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinoleína, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropil, octilina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, ácido fosforoso y sus sales, piperalina, propanosina-sodio, proquinazida, pirrolnitrina, quintoceno, tecloftalam, tecnaceno, triazóxido, triclámida, zarilamida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonilo)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolecarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)piridina]-2,3-dimetilisoxazolidina-3-ilo, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, metil 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-metil-1H imidazol-5-carboxilato, 3,4,5-tricloro-2,6-piridinedicarbonitrilo, metil 2-[[[ciclopropilo(4-metoxifenil)imino]]tio]metil]-alfa(metoximetileno)-bencenoacetato, 4-cloro-alfa-propiniloxi-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propiniloxi)fenil]]etil-bencenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]]oxi]]-3-metoxifenil etil-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidina-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazol[1,5-pirimidina], 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazol[1,5-pirimidina]-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazol[1,5-pirimidina]-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridina-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridina-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-((Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino[6]-(difluorometoxy)metil]-2,3-difluorofenil)-2-fenilacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexilo)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[[1-[3(1Fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etilideno]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxi)-N-metil-Alfa bencenoacetamida, N-(2-[3-cloro-5-(trifluorometil)]piridina-2-il etílico)-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 1-[[4-metoxifenoxi]metil]-2,2-dimetilpropilo-1H-imidazol-1-ácido carboxílico, O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]]-1H-imidazol-1-ácido carboxílico-2,2-dimetilpropil, 2-(2-[(6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidina-4-il oxil)fenil])-2-(metoxi)-N-metilacetamida.

65

ES 2 341 974 T3

Los componentes citados anteriormente para combinaciones son sustancias activas conocidas, muchas de las cuales se describen en Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual 13a edición, British Crop Protection Council, Farnham 2003.

5 Las dosis de uso eficaz de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de amplios límites, particularmente dependiendo de la naturaleza de la plaga a eliminar o el grado de infestación, por ejemplo, de cultivos con estas plagas. En general, las composiciones según la invención usualmente contienen aproximadamente un 0,05 a aproximadamente un 95% (en peso) de uno o más ingredientes activos según la invención, aproximadamente del 1 a aproximadamente el 95% de uno o más portadores sólidos o líquidos y, opcionalmente, aproximadamente del 10 0,1 a aproximadamente el 50% de uno o más de otros componentes compatibles, tales como agentes tensioactivos o similares.

En la presente cuenta, el término "portador" se refiere a un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, a semillas o al suelo. 15 Este portador es, por lo tanto, generalmente inerte y debe ser aceptables (por ejemplo, agrónomicamente aceptable, particularmente para la planta tratada).

El portador puede ser un sólido, por ejemplo, arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo, sales de amonio), minerales naturales del suelo, tales como caolines, arcillas, talco, yeso, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra diatomeas, o minerales sintéticos de suelo tales como sílice, 20 alúmina, o silicatos especialmente silicatos de aluminio o de magnesio. Como portadores sólidos para gránulos los siguientes son adecuados: rocas naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de comidas inorgánicos u orgánicos, de materiales orgánicos, tales como aserrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, cáscaras de maíz o tallos de tabaco, tierra de diatomeas, fosfato tricálcico, corcho en polvo, o negro de carbón absorbente; polímeros solubles en agua, resinas, ceras, o fertilizantes sólidos. Estas 25 composiciones sólidas pueden, si se desea, contener uno o más agentes humectantes, de dispersión, de emulsión o colorantes compatibles, que cuando son sólidos, también puede servir como diluyente.

El portador también puede ser líquido, por ejemplo: agua, alcoholes, particularmente butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, particularmente acetato de metilglicol, cetonas, en particular acetona, ciclohexanona, metil 30 cetona, metilisobutilcetona, o isoforona; fracciones de petróleo, tales como hidrocarburos parafínicos o aromáticos, especialmente xilenos o alquil naftalenos, aceites minerales o vegetales; hidrocarburos alifáticos clorados, en particular tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos aromáticos clorados, en particular clorobencenos, solventes solubles en agua o muy polares tal como dimetilformamida, dimetilsulfóxido, o N-metilpirrolidona, gases licuados, o 35 similares, o un mezcla de los mismos.

El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, agente dispersante o agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de tales agentes de tensioactivos. Entre ellos figuran, por ejemplo, sales de ácidos poliacrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de 40 óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas, fenoles sustituidos (en particular, alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos anteriores. La presencia de al menos un agente tensioactivo es generalmente esencial cuando el ingrediente activo y/o el portador inerte son solamente 45 ligeramente solubles en agua o no son solubles en agua y el agente portador de la composición para la aplicación es agua.

Las composiciones de la invención también pueden contener otros aditivos tales como colorantes o adhesivos. Adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros sintéticos o naturales en forma de polvo, gránulos o entramados, 50 tal como goma arábiga, alcohol de polivinilo o acetato de polivinilo, fosfolípidos naturales, tales como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos pueden utilizarse en las formulaciones. Es posible utilizar colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul Prusia, colorantes orgánicos, tal como colorantes de alizarina, colorantes azoicos o materias colorantes de ftalocianina de metal, u oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o zinc. 55

Para su aplicación agrícola, los compuestos de la invención son así generalmente en forma de composiciones, que se encuentran en diversas formas sólidas o líquidas.

Las formas sólidas de las composiciones que se pueden utilizar son polvos (con un contenido del compuesto de la invención, de hasta un 80%), polvos o gránulos que se pueden mojar (incluyendo gránulos dispersables en agua), 60 en particular los obtenidos extrusión, compactación, impregnación de un portador granular, o granulación a partir de un polvo (el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos que se pueden mojar o gránulos siendo entre aproximadamente un 0,5 y aproximadamente un 80%). Las composiciones sólidas homogéneas o heterogéneas que contienen uno o más compuestos de la invención, por ejemplo, gránulos, cuentas, briquetas o cápsulas, se 65 pueden utilizar para tratar agua estancada o en movimiento durante un período de tiempo. Un efecto similar puede lograrse mediante goteo o alimentaciones intermitentes de de concentrados dispersables en agua tal como se describe aquí.

ES 2 341 974 T3

Las composiciones líquidas, por ejemplo, incluyen soluciones acuosas o no acuosas o suspensiones (tal como concentrados emulsionables, emulsiones, fluidos, dispersiones o soluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas también incluyen, en particular, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones, fluidos, aerosoles, polvos que se pueden mojar (o polvo para pulverización), pastas secas o fluidos como formas de composiciones que son líquidas o pensadas para formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo como aerosoles acuosos (incluyendo volumen bajo y ultra bajo) o como nieblas o aerosoles. Las composiciones líquidas, por ejemplo, en forma de concentrados emulsionables o solubles más frecuentemente comprenden cerca aproximadamente del 5 al 80% en peso aproximadamente del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o soluciones que ya están preparadas para la aplicación contienen, en su caso, de aproximadamente un 0,01 a aproximadamente un 20% del ingrediente activo. Además del solvente, los concentrados emulsionables o solubles pueden contener, cuando sea necesario, de aproximadamente un 2 a aproximadamente un 50% de aditivos adecuados, tales como estabilizantes, agentes activos de superficie, agentes penetrantes, inhibidores de corrosión, colorantes o adhesivos. Las emulsiones de cualquier concentración requerida, que son especialmente adecuadas para su aplicación, por ejemplo, a plantas, se pueden obtener de estos concentrados por dilución con agua. Estas composiciones se incluyen en el ámbito de las composiciones que pueden ser empleadas en la presente invención. Las emulsiones pueden ser en forma de tipo de agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia espesa.

Las composiciones líquidas de esta invención pueden, además de las aplicaciones normales de uso agrícola, utilizarse por ejemplo para el tratamiento de sustratos o de sitios infestados o susceptibles de infestación por artrópodos (u otras plagas controladas por los compuestos de esta invención), incluidos locales, áreas de almacenamiento o de procesamiento al aire libre o en interiores, contenedores o equipos para acumular o hacer correr el agua.

Todas estas dispersiones acuosas o emulsiones o mezclas de pulverización se pueden aplicar, por ejemplo, a cultivos mediante cualquier medio adecuado, principalmente por pulverización, con índices que son generalmente del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1.200 litros de mezcla de aspersión por hectárea, pero puede ser mayor o menor (por ejemplo, volumen bajo o ultra bajo), dependiendo de las necesidades o de la técnica de aplicación. Los compuestos o composiciones según la invención son convenientemente aplicados a la vegetación y, en particular a raíces u hojas con plagas que han de ser eliminadas. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es por riego químico, es decir, la adición de una formulación que contiene el ingrediente activo al agua de riego. Este riego puede ser riego por aspersión de pesticidas foliares o puede ser riego de tierra o riego subterráneo para suelo ni o para pesticidas sistémicos.

Las suspensiones concentradas, que se pueden aplicar mediante pulverización, se preparan para producir un producto estable fluido que no se conforma (molienda fina) y usualmente contienen de aproximadamente un 10 a aproximadamente un 75% en peso del ingrediente activo, de aproximadamente un 0,5 a aproximadamente un 30% de agentes activos superficiales, de aproximadamente un 0,1 a aproximadamente un 10% de agentes tixotrópicos, de aproximadamente un 0 a aproximadamente un 30% de aditivos adecuados, tal como agentes antiespumantes, inhibidores de corrosión, estabilizadores, agentes penetrantes, adhesivos y, como portador, agua o un líquido orgánico en el que el ingrediente activo es poco soluble o insoluble. Algunos sólidos orgánicos o sales inorgánicas se pueden disolver en el portador para ayudar a prevenir la conformación o como anticongelantes para el agua.

Los polvos que se pueden mojar (o polvo para pulverización) se preparan de manera que contienen del 10 aproximadamente al 80% aproximadamente en peso del ingrediente activo, de aproximadamente el 20 a aproximadamente el 90% de un portador sólido, de aproximadamente un 0 a un 5% aproximadamente de un agente humectante, de aproximadamente un 3 a un 10% aproximadamente de un agente de dispersión y, cuando sea necesario, de aproximadamente un 0 a aproximadamente un 80% de uno o más estabilizantes y/u otros aditivos, tal como agentes penetrantes, adhesivos, antiaglomerantes, colorantes, o similares. Para obtener estos polvos que se pueden mojar, el ingrediente activo se mezcla en un mezclador adecuado con sustancias adicionales que pueden estar impregnadas en el relleno poroso y se muelen en un molino o triturador adecuado. Esto produce polvos que se pueden mojar, cuya humectabilidad y suspensión es ventajosa. Se pueden suspender en agua para proporcionar la concentración deseada y esta suspensión se pueden emplear muy ventajosamente, en particular, para su aplicación al follaje de plantas.

Los “gránulos dispersables en agua (WG)” (gránulos que son fácilmente dispersables en agua) tienen composiciones que son sustancialmente similares a la de los polvos que se pueden mojar. Pueden prepararse mediante granulación de las formulaciones descritas para los polvos que se pueden mojar, ya sea por una vía húmeda (contacto con el ingrediente activo finamente dividido con el relleno inerte y un poco de agua, por ejemplo, 1-20% en peso, o con una solución acuosa de un agente de dispersión o aglomerante, seguido de secado y cribado), o por una vía seca (compactación seguida de molido y cribado).

Los índices y las concentraciones de las composiciones formuladas pueden variar de acuerdo con el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o uso de las mismas. En general, las composiciones para su aplicación en el control de artrópodos o parásitos nematodos de plantas contienen generalmente de aproximadamente un 0,00001% a aproximadamente un 95%, más particularmente de aproximadamente un 0,0005% a aproximadamente un 50% en peso de uno o más compuestos de la invención o del total de activos ingredientes (es decir, los compuestos de la invención, junto con otras sustancias tóxicas para artrópodos o nematodos, sinergistas, oligoelementos o estabilizadores). Las composiciones actuales empleadas y sus dosis de aplicación serán seleccionadas para conseguir el(los) efecto(s) deseado(s) por el agricultor, productor de ganado, médico o veterinario, operador de control de plagas u otra persona experta en la materia.

ES 2 341 974 T3

Composiciones sólidas o líquidas para su aplicación tópica a animales, madera, productos almacenados o enseres domésticos usualmente contienen de aproximadamente un 0,00005% a aproximadamente un 90%, más particularmente de aproximadamente un 0,001% a aproximadamente un 10% en peso de uno o más compuestos de la invención. Para la administración a animales por vía oral o parenteral, incluyendo composiciones sólidas o líquidas por vía percutánea, éstas contienen normalmente de aproximadamente un 0,1% a aproximadamente un 90% en peso de uno o más compuestos de la invención. Piensos medicamentosos contienen normalmente de aproximadamente un 0,001% a aproximadamente un 3% en peso de uno o más compuestos de la invención. Concentrados o complementos para su mezcla con piensos contienen normalmente de aproximadamente un 5% a aproximadamente un 90%, preferentemente de aproximadamente un 5% a aproximadamente un 50% en peso de uno o más compuestos de la invención. Pastillas para lamer de sal mineral contienen normalmente de aproximadamente un 0,1% a aproximadamente un 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o sus sales pesticidamente aceptables.

Las composiciones en polvo o líquidas para su aplicación en ganado, productos, locales o áreas al aire libre pueden contener desde aproximadamente un 0,0001% a aproximadamente un 15%, más especialmente entre aproximadamente un 0,005% a aproximadamente un 2,0% en peso, de uno o más compuestos de la invención. Concentraciones adecuadas en aguas tratadas son aproximadamente entre aproximadamente 0,0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más particularmente, aproximadamente 0,001 ppm a aproximadamente 5,0 ppm de uno o más compuestos de la invención, y puede ser utilizado terapéuticamente en el cultivo de peces con tiempos de exposición adecuados. Cebos comestibles pueden contener de aproximadamente un 0,01% a aproximadamente un 5%, preferiblemente entre aproximadamente un 0,01% a aproximadamente un 1,0% en peso, de uno o más compuestos de la invención.

Cuando se administra a vertebrados por vía parenteral, de forma oral o por vía percutánea o de otro tipo, la dosis de los compuestos de la invención dependerá de la especie, edad, o la salud de los vertebrados y de la naturaleza y el grado de infestación potencial o real, por artrópodos o plagas de helmintos. Una sola dosis de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, preferiblemente de aproximadamente 2,0 a aproximadamente 20,0 mg, por kg de peso del animal o dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20,0 mg, preferentemente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg, por kg de peso del animal por día, para medicación sostenida, son generalmente adecuadas por vía oral o parenteral. Mediante el uso de formulaciones o dispositivos de liberación sostenida, la dosis diaria requerida en un periodo de meses se podrá combinar y administrar a los animales en una sola ocasión.

Los siguientes Ejemplos 2A - 2M de la composición ilustran las composiciones para su uso contra los artrópodos, especialmente ácaros o insectos, o nematodos, que comprende, como ingrediente activo, compuestos de la invención, tal como los descritos en los ejemplos de preparación. Las composiciones descritas en los ejemplos 2A - 2M, cada una, pueden diluirse para dar una composición de pulverización en concentraciones adecuadas para su uso en el campo. Las descripciones genéricas de los ingredientes químicos (para los que todos los siguientes porcentajes son en porcentaje en peso), utilizados en la composición de los Ejemplos 2A - 2M ejemplificados a continuación, son los siguientes:

Nombre Comercial	Descripción química
Ethylan BCP	Condensado de óxido de etileno nonilfenol
Soprophor BSU	Condensado de óxido de etileno tristirilfenol
Arylan CA	Una solución 70% w/v de dodecilbenzenosulfonate de calcio
Solvesso 150	Solvente aromático C ₁₀ ligero
Arylan S	Dodecilbenzenosulfonato de sodio
Darvan NO ₂	Lignosulfonato de sodio
Celite PF	Portador de silicato de magnesio sintético

ES 2 341 974 T3

Nombre Comercial	Descripción química
5	
Sopropon T36	Sales de sodio de ácidos policarboxílicos
Rhodigel 23	Goma de xantano polisacárido
10	
Bentone 38	Derivado orgánico de montmorillonita de magnesio
15	
Aerosil	Dióxido de silicio microfino

20 Ejemplo 2A

Un concentrado soluble en agua se prepara con la composición de la siguiente manera:

Ingrediente activo	7%
25	
Ethylan BCP	10%
30	
N-metilpirrolidona	83%

35 A una solución de Ethylan BCP disuelta en una porción de N-metilpirrolidona se añade el ingrediente activo con calentamiento y agitando hasta que se disuelva. La solución resultante está compuesta por el volumen con el resto del solvente.

40 Ejemplo 2B

Un concentrado emulsionable (CE) se prepara con la composición de la siguiente manera:

Ingrediente activo	25% (máximo)
45	
Soprophor BSU	10%
50	
Arylan CA	5%
N-metilpirrolidona	50%
55	
Solvesso 150	10%

60 Los tres primeros componentes se disuelven en la N-metilpirrolidona y se añade a continuación Solvesso 150 para obtener el volumen final.

65

ES 2 341 974 T3

Ejemplo 2C

Se prepara un polvo que se puede mojar (WP) con la composición de la siguiente manera:

5

Ingrediente activo	40%
Arylan S	2%
Darvan NO ₂	5%
Celite PF	53%

10

15

Los ingredientes se mezclan y se muelen en un molino de martillo hasta obtener un polvo con un tamaño de partícula inferior a 50 micras.

20

Ejemplo 2D

Una formulación acuosa fluida se prepara con la composición de la siguiente manera:

25

Ingrediente activo	40,00%
Ethylan BCP	1,00%
Sopropon T360.	0,20%
Etileno glicol	5,00%
Rhodigel 230.	0,15%
Agua	53,65%

30

35

40

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se muele en un molino de lecho hasta que se obtiene un tamaño medio de partícula inferior a 3 micras.

Ejemplo 2E

Un concentrado de suspensión emulsionable se prepara con la composición de la siguiente manera:

50

Ingrediente activo	30,0%
Ethylan BCP	10,0%
Bentone 38	0,5%
Solvesso 150	59,5%

55

60

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se muelen en una muela de lecho hasta que se obtiene un tamaño medio de partícula inferior a 3 micras.

65

ES 2 341 974 T3

Ejemplo 2F

Unos gránulos dispersable en agua se preparan con la composición de la siguiente manera:

5	Ingrediente activo	30%
10	Darvan n° 2	15%
15	Arylan S	8%
	Celite PF	47%

Los ingredientes se mezclan, se micronizan en un molino de fluido de energía y, a continuación se granulan en una granuladora rotativa por pulverización con agua (hasta 10%). Los gránulos resultantes se secan en un secador de lecho fluido para retirar el exceso de agua.

Ejemplo 2G

Un polvo se prepara con la composición de la siguiente manera:

25	Ingrediente activo	1 a 10%
30	Polvo de talco superfino	99 a 90%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se muelen adicionalmente tal como sea necesario para lograr un polvo fino. Este polvo puede ser aplicado en un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo, vertederos de basura, productos almacenados o enseres domésticos o animales infestados por, o en riesgo de infestación por, artrópodos para controlar los artrópodos por ingestión oral. Medios adecuados para distribuir el polvo en el lugar de infestación por artrópodos incluyen ventiladores mecánicos, agitadores manuales o dispositivos de auto-tratamiento de ganado.

Ejemplo 2H

Un cebo comestible se prepara con la composición de la siguiente manera:

45	Ingrediente activo	0,1 a 1,0%
50	Harina de trigo	80%
	Melaza	19,9 a 19%

Los ingredientes están íntimamente mezclados y se forman como se requiere en forma de cebo. Este cebo comestible puede ser distribuido en un lugar, por ejemplo instalaciones domésticas o industriales, por ejemplo, cocinas, hospitales o almacenes, o zonas al aire libre, infestadas por los artrópodos, por ejemplo, hormigas, langostas, cucarachas, moscas o, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

Ejemplo 2I

Una formulación de solución se prepara con una composición de la siguiente manera:

65	Ingrediente activo	15%
	Dimetil sulfóxido	85%

ES 2 341 974 T3

El ingrediente activo se disuelve en dimetil sulfóxido con mezcla y/o calentamiento según sea necesario. Esta solución puede aplicarse por vía percutánea como una aplicación de vertido en animales domésticos infestados por artrópodos o, después de la esterilización por filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (0,22 micrómetros de tamaño de poro), por inyección parenteral, con un índice de aplicación de 1,2 a 12 ml de solución por cada 100 kg de peso corporal del animal.

Ejemplo 2J

Un polvo que se puede mojar se prepara con la composición de la siguiente manera:

Ingrediente activo	50%
Ethylan BCP	5%
Aerosil	5%
Celite PF	40%

El Ethylan BCP se absorbe en el Aerosil, que se mezcla a continuación con los demás ingredientes y se muelen en un molino de martillo para proporcionar un polvo que se puede mojar, que se puede diluir con agua en una concentración de entre el 0,001% y el 2% en peso del compuesto activo y se aplica a un lugar de la infección por artrópodos, por ejemplo, larvas de dípteros o nematodos vegetales, mediante pulverización; o en los animales domésticos infestados por, o en riesgo de infección por artrópodos, por pulverización o por inmersión, o por vía oral en agua potable, para controlar los artrópodos.

Ejemplo 2K

Una composición de liberación lenta en bolo se forma a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes en porcentajes variables (similares a los descritos para las composiciones anteriores) dependiendo de la necesidad:

Ingrediente activo

Agente de densidad

Agente de liberación lenta

Aglutinante

Los ingredientes íntimamente mezclados se forman en gránulos que se comprimen en un bolo con una gravedad específica de 2 o más. Esto se puede administrar por vía oral a animales domésticos rumiantes para la retención en el retículo-rumen para proporcionar una liberación continua lenta del compuesto activo durante un período prolongado de tiempo para controlar la infección de animales domésticos rumiantes por artrópodos.

Ejemplo 2L

Una composición de liberación lenta en forma de gránulos, cuentas, briquetas o similares puede prepararse con composiciones de la siguiente manera:

Ingrediente activo	0,5 a 25%
Cloruro de polivinilo	75 a 99,5%
Ftalato de dioctilo (plastificante)	

Los componentes se mezclan y a continuación se forman en formas adecuadas mediante fusión-extrusión o moldeo. Estos componentes son útiles, por ejemplo, para su adición a agua estancada o para la fabricación de collares o etiquetas para las orejas para su colocación en animales domésticos para controlar las plagas mediante liberación lenta.

ES 2 341 974 T3

Ejemplo 2M

Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición de la siguiente manera:

5	Ingrediente activo	85% (máximo)
	Polivinilpirrolidona	5%
10	Arcilla de atapulgita	6%
	Sulfato de sodio lauril	2%
15	Glicerina	2%

20 Los ingredientes se mezclan en una papilla al 45% con agua y se trituran en mojado a un tamaño de partícula de 4 micras, a continuación secado por aspersión para eliminar el agua.

Procedimientos de uso de pesticidas

25 El siguiente procedimiento de ensayo representativo, utilizando compuestos de la invención, se realizó para determinar la actividad parasiticida de los compuestos de la invención.

Procedimiento A

30 *Procedimiento de cribado para detectar la sistematicidad de los compuestos contra la Ctenocephalides felis (pulga de gato)*

35 Un contenedor de prueba se llenó con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Un cilindro de vidrio se cerró en un extremo con parafilm y se colocó en la parte superior del recipiente de ensayo. La solución del compuesto de ensayo fue inoculado a continuación en sangre bovina y se añadió al cilindro de vidrio. La *Ctenocephalides felis* tratada se mantuvieron en esta prueba de perro artificial (sangre de 37°C, 40-60% de humedad relativa; *Ctenocephalides felis* 20-22°C, 40-60% de humedad relativa) y la evaluación realizada a las 24 y 48 horas después de la aplicación. números compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-24, 2-1, 2-2, 2-3, 2-5, 2-6, 2-9, 2-11, 2-12, 2-13, 2-15, 2-16, 2-17, 2-20, 2-21, 2-22, 2-85, 3-2, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-9, 3-15, 3-17, 3-19, 3-20, 3-21, 3-22, 3-23, 3-25, 3-29, 3-30, 3-31, 3-32, 3-34, 3-35, 3-36, 3-37, 3-38, 3-136 y 3-149 dio al menos el 90% de control de *Ctenocephalides felis* en una concentración de prueba de 5 ppm o menos.

40

Procedimiento B

45 *Cribado de Diabrotica undecimpunctata (gusano de la raíz del maíz del sur)*

50 Dos días antes de la aplicación, semillas de maíz fueron sumergidas en agua caliente en condiciones para obtener una germinación rápida. Un día antes de la aplicación, huevos de *Diabrotica undecimpunctata* fueron transferidos a una mitad de un papel de filtro japonés colocado en un plato de Petri de plástico. Después, una semilla de maíz germinada fue colocada en una almohadilla humedecida al lado del papel de filtro. Tres gotas de 200 microlitros de la solución de ensayo compuesto se pipetaron con cuidado en el huevo. El resto de la solución se colocó sobre el maíz, y luego se cerró la placa de Petri. Los huevos tratados en las placas de Petri se mantuvieron en una cámara climática durante 6 días. La eficacia de los compuestos (porcentaje de los huevos muertos y/o larvas, en comparación con el control no tratado) se evaluó 6 días después de la aplicación usando un microscopio binocular.

55

Procedimiento C

Cribado de Nephotettix Cinciceps (saltahojas del arroz)

60 Las hojas de 12 plantas de arroz que tienen una longitud de 8 cm del tallo se sumergieron durante 5 segundos en una solución acuosa de la sustancia de ensayo formulada. Después de retirar la solución, las plantas de arroz tratadas de esta manera se colocaron en una placa Petri y se poblaron con aproximadamente 20 larvas (estadio L3) de *Nephotettix cinciceps*. La placa de Petri se cerró y se almacenó en una cámara climática (16 horas de luz/día, 25°C, 40-60% de humedad relativa). Después de 6 días de almacenamiento, se determinó el porcentaje de mortalidad de las larvas saltahojas.

65

ES 2 341 974 T3

Procedimiento D

Procedimiento de cribado para probar la actividad de contacto contra Ctenocephalides felis (pulga de gato)

5 Las soluciones de los compuestos de prueba se colocaron sobre papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se colocó en tubos de ensayo y se infectó con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. La *Ctenocephalides felis* tratada se mantuvo en una cámara climática (26°C, 80% HR) y el porcentaje de eficacia se evaluó 24 horas y 48 horas después de la aplicación, en comparación con el control sin tratar.

10

Procedimiento E

Procedimiento de cribado para probar la actividad de contacto contra Rhipicephalus sanguineus (garrapata de perro Brown)

15

Las soluciones de los compuestos de prueba fueron se colocaron sobre papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se colocó en tubos de ensayo y se infectaron con larvas de 20-30 (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y los tubos se cerraron con un clip. El *Rhipicephalus sanguineus* tratado se mantuvo en una cámara climática (25°C, 90% HR) y el porcentaje de eficacia se evaluó 24 horas después de la aplicación, en comparación con el control sin tratar.

20

Referencias citadas en la descripción

25 Esta lista de referencias citadas por el solicitante está prevista únicamente para ayudar al lector y no forma parte del documento de patente europea. Aunque se ha puesto el máximo cuidado en su realización, no se pueden excluir errores u omisiones y la OEP declina cualquier responsabilidad en este respecto.

Documentos de patente citados en la descripción

30

• WO 8703781 A [0002]

• EP 0295117 A [0002]

• US 4695308 A [0002]

35

• US 4740231 A [0003]

• US 5916618 A [0004]

40

• US 4631211 A, Houghten [0070]

• WO 9637494 A [0122]

• WO 9825923 A [0122]

45

Documentos de patente no citados en la descripción

• **Lin, Ku**; Shiao. *Synthesis*, 1992, 1219 [0058]

50

• S.H. **DeWitt**. Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: *Automated Synthesis*. vol. 1, 69-77 [0066]

• **Barry A. Bunin**. The Combinatorial Index. *Academic Press*, 1998 [0069]

55

• **Houghten et al.** *Proc. Natl. Acad. Sci*, 1985, vol. 82, 5131-5136 [0070]

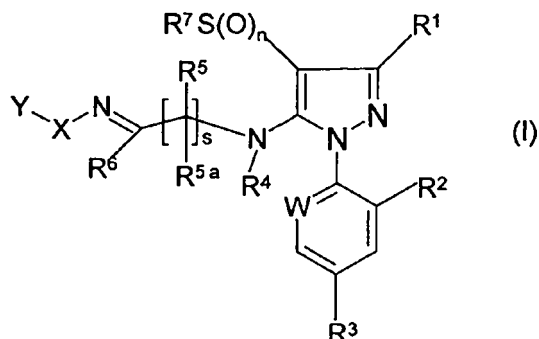
• Ch.R **Worthing**; S.B. **Walker**. The Pesticide Manual. *British Crop Protection Council*, 2003 [0124]

60

65

REIVINDICACIONES

1. Compuesto de fórmula (I):



en donde:

R¹ es CN, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, halógeno, CSNH₂ o C(=N-V)-S(O)_r-Q;

R² es halógeno;

W es N o C-halógeno;

R³ es CF₃, OCF₃ o SF₃;

R⁴ es H, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, CO₂-(C₁-C₆)-haloalquilo, CO₂-(C₃-C₆)-alqueno, CO₂-(C₂-C₆)-alquino, CO₂-(CH₂)_mR⁸, (CH₂)_qR⁸, COR⁹, (CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R¹¹; o (C₁-C₆)-alquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-alquino o CO-C₍₁₋₆₎-alquilo, cuyos últimos cuatro grupos mencionados son no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales R¹²; o C₍₃₋₆₎-cicloalquilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alquilo y (C₁-C₆)-haloalquilo;

R⁵ y R^{5a} son cada uno independientemente hidrógeno, (C₁-C₄)-alquilo o (CH₂)_qR⁸;

R⁶ es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-alquino o (CH₂)_qR⁸;

R⁷ es (C₁-C₃)-alquilo o (C₁-C₃)-haloalquilo;

R⁸ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi, CN, NO₂, OH, S(O)_pR¹³ y NR¹⁴R¹⁵;

R⁹ y R^{9a} son cada uno independientemente H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-cicloalquilo, (C₃-C₆)-isopropil-(C₁-C₄)-alquilo, (CH₂)_qR⁸ o (CH₂)_qR¹⁰;

R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₄)-alquilo, (C₁-C₄)-haloalquilo, (C₁-C₄)-alcoxi, (C₁-C₄)-haloalcoxi, NO₂, CN, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, S(O)_pR¹³, OH y oxo;

R¹¹ es (C₃-C₆)-cicloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-haloalqueno, (C₂-C₆)-alquino, (C₂-C₆)-haloalquino, (CH₂)_qR⁸ o R¹⁰; o es (C₁-C₆)-alquilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en R¹²;

R¹² es halógeno, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi, (C₃-C₆)-alqueno, (C₃-C₆)-haloalqueno, (C₃-C₆)-alquino, (C₃-C₆)-haloalquino, (C₃-C₆)-haloalquino, (C₃-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, S(O)_pR¹⁶, CN, NO₂, OH, COR¹³, NR⁹R¹⁴, NR⁹COR¹⁴, NR⁹SO₂R¹⁶, CONR⁹R¹⁴, SO₂NR⁹R¹⁴, O(CH₂)_qR⁸, O(CH₂)_qR¹⁰, ONR⁹R^{9a} o CO₂R¹³;

R¹³ es (C₁-C₆)-alquilo o (C₁-C₆)-haloalquilo;

R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-alqueno, (C₃-C₆)-haloalqueno, (C₃-C₆)-alquino, (C₃-C₆)-cicloalquilo o (C₃-C₆)-cicloalquilo-(C₁-C₆)-alquilo; o

R¹⁴ y R¹⁵ junto con el átomo N adjunto forma un anillo de cinco o seis miembros saturado o insaturado que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, siendo el anillo no sustituido

ES 2 341 974 T3

o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₁-C₆)-alcoxilo y oxo;

5 R¹⁶ es (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-alqueno, (C₃-C₆)-haloalqueno, (C₃-C₆)-alquino, (C₃-C₆)-cicloalquilo o (CH₂)_qR⁸;

V es H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-alquino, (CH₂)_qR⁸, COR¹³, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, S(O)_pR¹³ o S(O)_p-(CH₂)_qR⁸;

10 Q es (C₁-C₆)-alquilo o CH₂R⁸;

X es O o NR¹⁷;

15 Y es CO-Z^a, CHO, SO₂Z^a, COCO-Z^a, CO₂Z, Z-CS^a o Z^b; o

R¹⁷, Y y el átomo N adjunto forman un anillo de cinco o seis miembros saturado que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, siendo el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C₁-C₆)-alquilo y (C₁-C₆)-haloalquilo;

20 Z es (C₃-C₆)-alqueno, (C₃-C₆)-alquino, R⁸, R¹⁰ o (C₁-C₇)-alquilo cuyo último grupo mencionado es no sustituido o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en R¹⁸; o (C₃-C₆)-cicloalquilo no sustituido o sustituido por uno o más (C₁-C₆)-alquilo o radicales halógenos;

25 Z^a es Z o NR¹⁹R²⁰;

Z^b es Z o H;

30 R¹⁷ es H, (C₂-C₆)-alqueno, (C₂-C₆)-alquino, R⁸ o (C₁-C₆)-alquilo, cuyo último grupo mencionado es no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en R¹⁸; o (C₃-C₆)-cicloalquilo cuyo último grupo mencionado es no sustituido o sustituido con uno o más (C₁-C₆)-alquilo o radicales halógenos;

R¹⁸ es halógeno, (C₁-C₆)-alcoxi, (C₁-C₆)-haloalcoxi, (C₃-C₆)-alqueno, (C₃-C₆)-alquino, (C₃-C₆)-cicloalquilo, S(O)_pR¹⁶, CN, NO₂, OH, NR⁹R¹⁴, R⁸O⁸, o CO₂R¹³;

35 R¹⁹ y R²⁰ son cada uno independientemente H, (C₁-C₆)-alquilo, (C₁-C₆)-haloalquilo, (C₃-C₆)-cicloalquilo, (C₃-C₆)-isopropil-(C₁-C₆)-alquilo o (CH₂)_qR⁸;

s es 1, 2 ó 3;

40 m y q son cada uno independientemente 0 ó 1;

N, P y R son cada uno independientemente 0, 1 ó 2; y

45 cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionado del grupo que consiste en N, O y S;

o una sal pesticidamente aceptable del mismo.

50 2. Compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1, en el que R¹ es CN.

3. Compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1 ó 2, en el que W es C-Cl.

55 4. Compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1, 2 ó 3, en el que R³ y R⁷ son cada uno CF₃.

5. Compuesto o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que:

60 R¹ es CN o CSNH₂;

R² es Cl;

W es C-Cl o N;

65 R³ es CF₃ o OCF₃;

R⁴ es H, (C₃-C₆)-alquino, (C₃-C₆)-haloalquino, (C₃-C₇)-cicloalquilo, CO₂-(C₁-C₃)-alquilo, CO₂-(C₃-C₆)-alqueno, CO₂-(C₃-C₆)-alquino, CO₂-(CH₂)_mR⁸, (CH₂)_qR⁸, COR⁹, (CH₂)_qR¹⁰ o SO₂R¹¹; o (C₁-C₆)-alquilo, (C₃-C₆)-alque-

ES 2 341 974 T3

nilo o CO-C_(1-C₆)-alquilo, cuyos tres últimos grupos mencionados son no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales R¹²;

R⁵ y R^{5a} son cada uno independientemente H o (C₁-C₃)-alquilo;

R⁶ es H o (C₁-C₃)-alquilo;

R⁷ es CF₃;

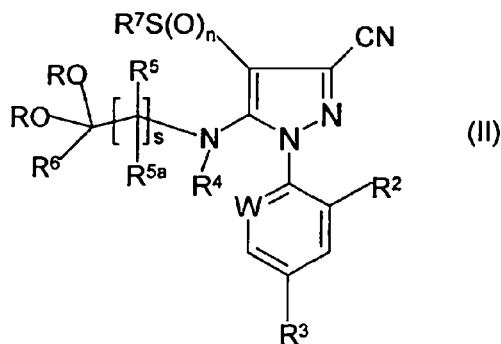
X es O o NH;

Y es Z, COZ^a, CSZ^a o CO₂Z; y

s es 1 ó 2.

6. Procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, cuyo procedimiento comprende:

a) cuando R¹ es CN, y R², R³, R⁴, R⁵, R^{5a}, R⁶, R⁷, W, X, Y, n y s son tal como se define en la reivindicación 1, reaccionar un compuesto de fórmula (II):

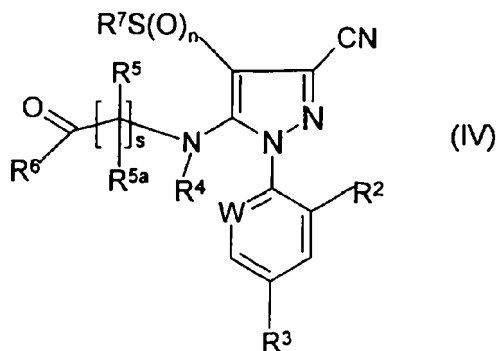


en donde R es (C₁-C₆)-alquilo, y los otros valores son tal como se define en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (III):



en donde X e Y son tal como se define en la reivindicación 1, o una sal ácida del mismo; o

b) cuando R¹ es CN, y los otros valores son tal como se definen en la reivindicación 1, reaccionar un compuesto de fórmula (IV):



en donde los diversos valores son los definidos en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (III) o una sal ácida del mismo, tal como sal de hidrócloruro; o

ES 2 341 974 T3

c) cuando R^1 es $CSNH_2$, y los otros valores son tal como se definen en la reivindicación 1, reaccionar el correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R^1 es CN, con un hidrosulfuro de metal alcali o alcalino-térreo, o con H_2S , en presencia de una base orgánica, o con el reactivo Ph_2PS_2 ; o

5 d) cuando R^1 es $CSNH_2$, y los otros valores son tal como se definen en la reivindicación 1, reaccionar el correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R^1 es CN, con un bis(trialquilsilil) sulfuro en presencia de una base; o

10 e) cuando R^1 es $C(=NH)-SQ$, y Q y los otros valores son tal como se definen en la reivindicación 1, reaccionar el correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R^1 es $CSNH_2$ con un agente alquilante de fórmula (V) o (VI):



15 donde Q es tal como se define en la reivindicación 1 y L^1 es un grupo saliente; o

20 f) cuando R^1 es $C(=N-V)-S-Q$, V es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H, y Q, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{5a} , R^6 , R^7 , W, X, Y, n y s son tal como se define en la reivindicación 1, alquilando, acilando o sulfonilando el correspondiente compuesto de fórmula (I) donde R^1 es $C(=NH)-S-Q$, con un compuesto de fórmula (VII):



25 en donde V es tal como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H, y L^2 es un grupo saliente; o

g) cuando n es 1 ó 2 y los otros valores son tal como se definen en la reivindicación 1, oxidar el compuesto correspondiente en el que n es 0 ó 1; y

30 h) si se desea, convertir un compuesto resultante de fórmula (I) en una sal pesticidamente aceptable del mismo.

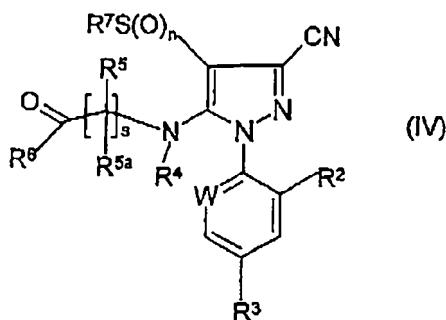
35 7. Composición pesticida que comprende un compuesto de fórmula (I) o una sal pesticidamente aceptable del mismo tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en asociación con un diluyente o portador pesticidamente aceptable y/o agente tensoactivo.

8. Utilización de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7, para la preparación de un medicamento veterinario.

40 9. Utilización de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7, para el control de plagas, en donde dicha utilización es *ex vivo*.

45 10. Procedimiento para controlar ectoparásitos artrópodos, insectos del suelo o nematodos de plantas en un locus que comprende la aplicación a los mismos una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7, en el que dicho procedimiento es *ex vivo*.

50 11. Compuesto de fórmula (IV):



65 en donde:

R^2 es Cl;

ES 2 341 974 T3

W es C-Cl;

R³ y R⁷ son cada uno CF₃;

5 R⁴ es metilo;

R⁵, R^{5a} y R⁶ son cada uno H;

10 n es 0 ó 1;

s es 2 ó 3.

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65