

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 461 618**

51 Int. Cl.:

**C07D 413/12** (2006.01)

**C07D 417/12** (2006.01)

**A01N 43/80** (2006.01)

**A01N 53/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **01.07.2010 E 10732336 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.03.2014 EP 2451808**

54 Título: **Compuestos de piridacina para el control de plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

**06.07.2009 US 223095 P**

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

**20.05.2014**

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)  
67056 Ludwigshafen, DE**

72 Inventor/es:

**VEZOUET, RONAN LE;  
SÖRGEL, SEBASTIAN;  
DEFIEBER, CHRISTIAN;  
GROSS, STEFFEN;  
KÖRBER, KARSTEN;  
CULBERTSON, DEBORAH, L. y  
ANSPAUGH, DOUGLAS, D.**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 461 618 T3**

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

**DESCRIPCION**

Compuestos de piridacina para el control de plagas de invertebrados

5 La presente invención se refiere a nuevos compuestos de piridacina que son útiles para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de artrópodos. La invención se refiere además a un procedimiento para controlar plagas de invertebrados mediante el uso de estos compuestos. La invención se refiere además a un procedimiento para la protección de material de propagación de plantas y/o las plantas que crecen a partir del mismo mediante el uso de estos compuestos. La presente invención se refiere además a material de propagación de plantas y a una composición agrícola o veterinaria que comprende dichos compuestos.

10 Las plagas de invertebrados, y en particular artrópodos y nematodos, destruyen el crecimiento y los cultivos recolectados y atacan viviendas de madera y estructuras comerciales, causando, de esta forma, grandes pérdidas económicas al suministro de alimentos y a la propiedad. Aunque se conocen un gran número de agentes pesticidas, debido a la capacidad de las plagas diana para desarrollar resistencia a dichos agentes, existe una necesidad creciente de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados tales como insectos, arácnidos y nematodos. Por ello, es un objeto de la presente invención el proporcionar compuestos que tengan una buena actividad pesticida y que muestren un amplio espectro de actividad contra a un gran número de diferentes plagas de invertebrados, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos difíciles de controlar.

15 El Documento WO 2009/027393 A2 describe N-piridil amidas obtenidas de un ácido carboxílico que contiene un resto pirazol, las cuales son útiles para el control de plagas de invertebrados.

20 Los Documentos WO 2007/068373, WO 2007/068375 y WO 2007/068377, describen derivados N-aril- y N-hetarilamidas, obtenidas de ácidos carboxílicos que comprenden un carbociclo o heterociclo de 5 ó 6 átomos. Se menciona que estos compuestos son útiles para el control de microorganismos.

Los Documentos WO 2005/074686 y WO 2005/075411, describen derivados de N-arilamidas, las cuales se mencionan que son útiles en el control de microorganismos tales como hongos, bacterias en la fito-protección.

25 Los Documentos WO 2003/106427, WO 2004/046129 y JP 2007-77106, describen derivados de N-arilamidas, obtenidos de ácidos piracino carboxílicos. Se menciona que estos compuestos son útiles para combatir plagas de invertebrados.

El Documento WO 2001/00575 describe derivados de N-aril- y N-hetarilamidas, obtenidos de ácidos carboxílicos que comprenden un heterociclo de 5 ó 6 átomos que porta una función amido-derivada en posición orto. Se menciona que estos compuestos son útiles como insecticidas.

30 El Documento WO 2005/073165 describe derivados de N-aril- o N-hetarilamidas, obtenidos de ácidos carboxílicos que comprenden fenilo o un heterociclo, en el que el ciclo unido a N porta una función amido-derivada adicional en posición meta. Se menciona que estos compuestos son útiles como insecticidas.

El Documento EP 0606175 describe compuestos 2-ciano-3-hidroxi-propenamidas obtenidos de los compuestos isoxazoles correspondientes y su uso en composiciones farmacéuticas.

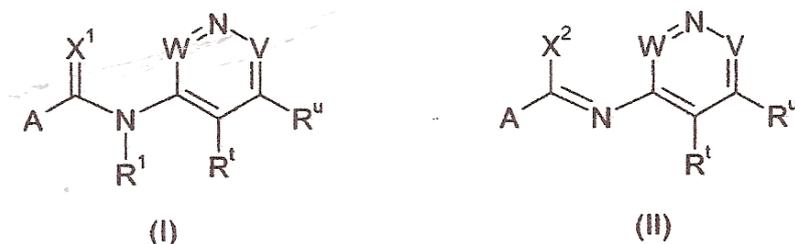
35 El Documento EP 0573883 describe derivados isoxazoles y su uso veterinario y médico.

El Documento WO 2000/29398 describe derivados de ácidos isotiazoles-carboxílicos y se menciona su uso como biocida.

40 Es un objeto de la presente invención el proporcionar compuestos que tienen una buena actividad pesticida, en particular actividad insecticida, y que muestren un amplio espectro de actividad contra un gran número de diferentes plagas de invertebrados, especialmente contra insectos difíciles de controlar.

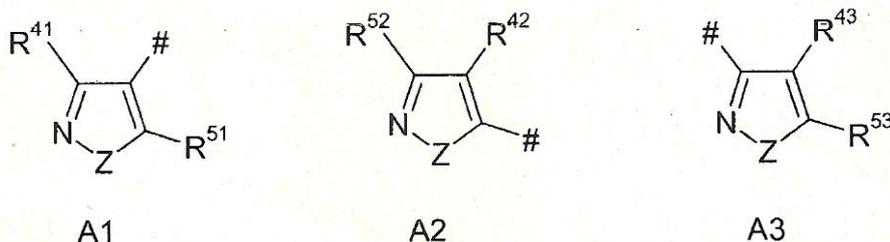
Se ha encontrado que estos objetivos pueden lograrse mediante compuestos de las fórmulas I y II, tal como se definen más adelante, y mediante sus sales y N-óxidos, en particular sus sales aceptables agrícola o veterinariamente.

En un primer aspecto, la presente invención se refiere a compuestos de piridacina de las fórmulas I y II y las sales y N-óxidos de los mismos,



en las que

A es un radical isoxazol o isotiazol de las fórmulas A1, A2 o A3,



5 en las que

# indica un sitio de unión al resto de las fórmulas I ó II, y en las que  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$  y  $R^{51}$  están independientemente entre sí seleccionados entre hidrógeno, halógeno, CN,  $\text{NO}_2$ , alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ , alquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  y alquinilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ , en las que los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no substituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden llevar 1, 2 ó 3 substituyentes idénticos o diferentes  $R^x$ , o en las que  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$  y  $R^{51}$  están además seleccionados entre  $\text{OR}^a$ ,  $\text{C(Y)R}^b$ ,  $\text{C(Y)OR}^c$ ,  $\text{S(O)}_m\text{R}^d$ ,  $\text{NR}^e\text{R}^f$ , heterociclilo, heteroarilo, cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ , cicloalquenilo de  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$  y fenilo, en las que los cinco últimos radicales mencionados pueden estar no substituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes idénticos o diferentes  $R^x$ , en las que m es 0, 1, 2 y en las que

10

15

20

$R^{52}$ ,  $R^{53}$  están seleccionados entre hidrógeno, halógeno, CN,  $\text{NO}_2$ , alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ , alquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  y alquinilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ , en las que los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no substituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden llevar 1, 2 ó 3 substituyentes idénticos o diferentes  $R^x$ , o en las que  $R^{52}$ ,  $R^{53}$  están además seleccionados entre  $\text{OR}^a$ ,  $\text{C(Y)R}^b$ ,  $\text{C(Y)OR}^c$ ,  $\text{S(O)}_m\text{R}^d$ ,  $\text{NR}^e\text{R}^f$ , heterociclilo, heteroarilo, cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ , cicloalquenilo de  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$  y fenilo, en las que los cinco últimos radicales mencionados pueden estar no substituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes idénticos o diferentes  $R^x$ , en las que m es 0, 1, 2 y en las que

Z es O o S;

V es  $\text{C(R}^v)$  o N;

W es  $\text{C(R}^w)$  o N;

con la condición de que si V o W es N;

25

$R^t$ ,  $R^u$ ,  $R^v$  y  $R^w$  están independientemente entre sí seleccionados entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquiltio de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquiltio de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquilsulfinilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilsulfinilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquilsulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilsulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , halocicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , alquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_4$ , haloalquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_4$ , alquinilo de  $\text{C}_2\text{-C}_4$  o alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ;

30

$X^1$  es S, O o  $\text{NR}^{1a}$ , en la que  $R^{1a}$  está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ , cicloalquilmetilo de  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ , halocicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ , alquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ , haloalquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ , alquinilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ , alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ,  $\text{OR}^a$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenilalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , hetaril-alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , heterociclil-alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no substituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o substituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$  y haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ;

35

$X^2$  es  $OR^{2a}$ ,  $NR^{2b}R^{2c}$ ,  $S(O)_mR^{2d}$ , en la que m es 0, 1 ó 2, en la que

$R^{2a}$  está seleccionado entre alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$ , heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o substituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , y en las que

$R^{2b}$ ,  $R^{2c}$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilcarbonilo, heteroarilo, hetarilsulfonilo, heterociclilo, heterocicililcarbonilo, heterocicilsulfonilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los doce últimos radicales mencionados puede estar no sustituidos o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , o

$R^{2b}$  y  $R^{2c}$  conjuntamente con el átomo de átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un heterociclo saturado o no saturado, de 5 ó 6 átomos, el cual puede portar un heteroátomo adicional seleccionado entre O, S y N como un átomo de anillo y en el que el heterociclo puede estas no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , y en las que

$R^{2d}$  está seleccionado entre alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;

$R^1$  es hidrógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo de  $C_1-C_{10}$ , cicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ , alquenilo de  $C_2-C_{10}$ , haloalquenilo de  $C_2-C_{10}$ , alquinilo de  $C_2-C_{10}$ , haloalquinilo de  $C_2-C_{10}$ ,  $OR^a$ ,  $C(Y)R^b$ ,  $C(Y)OR^c$ ,  $S(O)_2R^d$ ,  $NR^eR^f$ ,  $C(Y)NR^gR^h$ ,  $S(O)_mNR^eR^f$ ,  $C(Y)NR^iNR^jR^k$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, alquilenos de  $C_1-C_5-OR^a$ , alquilenos de  $C_1-C_5-CN$ , fenil-alquilo de  $C_1-C_5$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_5$ , heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_5$ , cicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ -alquilo de  $C_1-C_5$ , alquilenos de  $C_1-C_5-C(Y)R^b$ , alquilenos de  $C_1-C_5-C(Y)OR^c$ , alquilenos de  $C_1-C_5-NR^eR^f$ , alquilenos de  $C_1-C_5-C(Y)NR^gR^h$ , alquilenos de  $C_1-C_5-S(O)_2NR^d$ , alquilenos de  $C_1-C_5-S(O)_mNR^eR^f$ , alquilenos de  $C_1-C_5-C(Y)NR^iR^jR^k$ , en el que los dieciseis últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes idénticos o diferentes  $R^x$  o  $R^y$  y en las que m es 0, 1 ó 2;

Y es O o S;

$R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , cicloalquilometilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o substituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;

$R^d$  está seleccionado entre alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , cicloalquilometilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;

$R^e$ ,  $R^f$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , cicloalquilometilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , alquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilcarbonilo, hetarilsulfonilo, heterociclilo, heterocicililcarbonilo, heterocicilsulfonilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los doce últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 substituyentes, los cuales, inde-

pendientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; o

5 R<sup>e</sup> y R<sup>f</sup> conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un heterociclo saturado o no saturado, de 5 ó 6 átomos, el cual puede portar un heteroátomo adicional seleccionado entre O, S y N como un átomo de anillo y en el que el heterociclo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

10 R<sup>g</sup>, R<sup>h</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y hetaril-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, heterociclil-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

15 R<sup>i</sup> está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilometilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, fenilo y fenil-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en los que el anillo fenilo en los dos últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

20 R<sup>x</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre ciano, nitro, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilcarbonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, heterociclilo de 5 a 7 átomos, fenilo, cicloalcoxi de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, heterociclilo de 3 a 6 átomos y fenoxi, en los que los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales R<sup>y</sup>; y en la que

25 R<sup>y</sup> está seleccionado entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, S(O)<sub>m</sub>R<sup>d</sup>, S(O)<sub>m</sub>NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>, alquilcarbonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilcarbonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxicarbonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxicarbonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> y alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

30 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un procedimiento para el control de plagas de invertebrados, cuyo procedimiento comprende el tratamiento de las plagas, su suministro de alimento, su hábitat o su terreno de reproducción o una planta, semilla, suelo, área, material o medioambiente en el cual las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios a proteger del ataque o infestación de plagas con una cantidad eficaz pesticidamente de un compuesto de piridacina de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención o una sal o un N-óxido del mismo.

35 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un procedimiento para la protección de material de propagación de plantas y/o las plantas que crecen a partir del mismo, cuyo procedimiento comprende el tratamiento del material de propagación de plantas con una cantidad eficaz pesticidamente de un compuesto de piridacina de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención o una sal aceptable agrícolamente o un N-óxido del mismo.

40 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a material de propagación de plantas, que comprende al menos un compuesto de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención o una sal aceptable agrícolamente o un N-óxido del mismo.

45 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a compuestos para uso en un procedimiento para el tratamiento o protección de un animal de infestación o infección por parásitos, especialmente ectoparásitos, que comprende la puesta en contacto del animal con una cantidad eficaz parasiticidamente de un compuesto de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención o una sal aceptable veterinariamente o un N-óxido del mismo. La puesta en contacto del animal con el compuesto I o II, su sal o la composición veterinaria de la invención significa su aplicación o administración al animal.

50 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a una composición agrícola que contiene al menos un compuesto de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención y/o una sal aceptable agrícolamente o un N-óxido del mismo y al menos un vehículo líquido o sólido.

55 Los radicales unidos a la cadena principal de los compuestos de las fórmulas I o II pueden contener uno o más centros de quiralidad. En este caso, los compuestos de las fórmulas I o II están presentes en la forma de enantiómeros o diastereómeros diferentes, dependiendo de los sustituyentes. Los compuestos de fórmula II existen adicionalmente como isómeros cis o trans con respecto al eje N=C. La presente invención se refiere a cada posible estereoisómero de los compuestos de las fórmulas I o II, es decir, a enantiómeros o diastereómeros individuales, así como a mezclas de los mismos.

- Los compuestos de las fórmulas I o II pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos), los cuales pueden tener propiedades macroscópicas diferentes, tales como estabilidad o mostrar propiedades biológicas diferentes tales como actividades. La presente invención se refiere a compuestos amorfos y cristalinos de los fórmulas I o II, mezclas de estados cristalinos diferentes del compuesto I o II respectivo, así como a sales amorfas o cristalinas de los mismos.
- Las sales de los compuestos de las fórmulas I o II son preferiblemente sales aceptables agrícola y veterinariamente. Pueden formarse de una manera usual, por ejemplo, mediante reacción del compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de las fórmulas I o II tiene funcionalidad básica.
- Las sales útiles agrícolamente de los compuestos de las fórmulas I y II abarcan especialmente las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tengan efecto adverso sobre la acción pesticida de los compuestos de las fórmulas I o II.
- Los aniones de sales de adición de ácido útiles son fundamentalmente cloruro, bromuro, fluoruro, bisulfato, sulfato, bifosfato, monofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanóicos de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse mediante la reacción de compuestos de las fórmulas I y II con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.
- Las sales aceptables veterinariamente de los compuestos de las fórmulas I y II abarcan especialmente las sales de adición de ácido que son conocidas y aceptadas en la técnica para la formación de sales de uso veterinario. Las sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de las fórmulas I y II conteniendo un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo cloruros, sulfatos, fosfonatos y nitratos, y sales de ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético, ácido maléico, por ejemplo las sales monoácidas o las sales diácidas de ácido maléico, ácido dimaléico, ácido fumárico, por ejemplo las sales monoácidas o las sales diácidas de ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metano sulfénico, ácido metano sulfónico, y ácido succínico.
- El término "N-óxido" incluye cualquier compuesto de las fórmulas I ó II que tenga al menos un átomo de nitrógeno terciario que está oxidado a un resto N-óxido.
- El término "plaga de invertebrados" tal como se usa en la presente invención, abarca poblaciones animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos, los cuales pueden atacar plantas, ocasionando, de esta forma, daño substancial a las plantas atacadas, así como ectoparásitos que pueden infestar a animales, en particular animales de sangre caliente, tales como, por ejemplo, mamíferos o pájaros, u otros animales superiores tales como reptiles, anfibios o peces, ocasionando, de esta forma, daño substancial a los animales infestados.
- El término "material de propagación de planta" tal como se usa en la presente invención, incluye todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y materiales de planta vegetativos, tales como cortes y tubérculos (por ejemplo, patatas), los cuales pueden usarse para la multiplicación de la planta. Estos incluyen semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, vástagos, brotes y otras partes de las plantas. Los semilleros y plantas jóvenes, los cuales han de ser trasplantados después de la germinación o después de emerger del suelo, pueden igualmente ser incluidos. Estos materiales de propagación de plantas pueden ser tratados profilácticamente con un compuesto de protección de plantas tanto antes como después de plantarlos o de trasplantarlos.
- El término "plantas" comprende todo tipo de plantas incluyendo las "plantas no cultivadas" y, en particular, las "plantas cultivadas".
- El término "plantas no cultivadas" se refiere a cualquier tipo de especie salvaje o especies relacionadas o géneros relacionados de una planta cultivada.
- El término "plantas cultivadas" tal como se usa en la presente invención, incluye plantas que han sido modificadas por selección, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas genéticamente modificadas son plantas, cuyo material genético ha sido modificado de tal manera, mediante el uso de técnicas de ADN recombinantes, que mediante otras circunstancias naturales no pueden fácilmente obtenerse por selección cruzada, mutaciones o recombinación natural. Típicamente, uno o más genes han sido integrados dentro del material genético de una planta genéticamente modificada con el fin de mejorar ciertas propiedades de la planta. Dichas modificaciones genéticas pueden incluir también, pero sin limitarse a ellas, modificaciones post-traducción dirigidas de poli proteína(s) (oligo- o plipéptidos), por ejemplo mediante glucosilación o adiciones de polímeros tales como restos prenilados, acetilados o farnesilados o restos PEG (por ejemplo, tal como se divulga en *Biotechnol. Prog.*, vol. 17 (nº. 4) págs. 720-4, (Jul-Aug. 2001); *Protein Eng. Des. Sel.*, vol. 17, (nº. 1), págs. 57-66, (Jan. 2004); *Nat. Protoc.*, vol. 2, (nº. 5), págs. 1225-35, (2007); *Curr. Opin. Chem. Biol.*, vol. 10, (nº. 5), págs. 487-91, (Oct. 2006); *Epub.*, vol. 28, (Aug. 2006); *Biomaterials*, vol. 22, (nº. 5), págs. 405-17, (Mar. 2001); *Bioconjug. Chem.*, vol. 16, (nº. 1), págs. 113-21, (Jan-Feb. 2005).
- El término "plantas cultivadas" tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que han sido hechas tolerantes a las aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como inhibidores hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD); inhibidores acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonil ureas (véanse, por ejemplo Docu-

- mentos de EE.UU. 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) o imidazolinonas (véanse, por ejemplo, los Documentos de EE.UU. 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); inhibidores
- 5 enolpiruvilshikamato-3-fosfato sintasa (EPSPS), tal como glifosato (véase, por ejemplo, Documento WO 92/00377); inhibidores glutamino sintetasa (GS), tal como glufosinato (véanse, por ejemplo Documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o herbicidas oxinil (véase, por ejemplo Documento de EE.UU. 5.559.024) como un resultado de procedimientos convencionales de selección o ingeniería genética. Diversas plantas cultivadas han sido convertidas en tolerantes a herbicidas mediante procedimientos convencionales de selección (mutagénesis), por ejemplo la colza
- 10 de verano Clearfield<sup>®</sup> (Canola) se ha hecho tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox. Los procedimientos de ingeniería genética se han usado para hacer que plantas cultivadas, tales como soja, algodón, maíz, remolacha y colza, sean tolerantes a herbicidas, tales como glifosato y glufosinato, algunos de los cuales se encuentran comercialmente disponibles bajo los nombres comerciales RoundupReady<sup>®</sup> (glifosato) y LibertyLink<sup>®</sup> (glufosinato).
- El término “plantas cultivadas” tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que, mediante el
- 15 uso de técnicas de ADN recombinante, son capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente las conocidas procedentes del género bacteriano bacillus, particularmente del *Bacillus thuringiensis*, tales como  $\alpha$ -endotoxinas, por ejemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo, VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias colonizantes de nematodos, por ejemplo *Photorhabdus spp* o *Xenorhabdus spp*; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arácnidos, toxinas de avispas, u otras neurotoxinas específicas de insectos, toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de Estreptomicetos, lectinas de plantas, tales como lectinas de guisantes o cebada; aglutininas; inhibidores de proteínasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivantes de ribosomas (RIP), tales como ricino, RIP de maíz, abrina, luffina, saporina o briodina; enzimas de metabolismo de esteroides, tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdiesteroide-IDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisona o HMG-CoA-reductasa; bloqueadores del canal de iones, tales como bloqueadores de canales de sodio y potasio; esterasa de hormona juvenil; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); estibel sintasa, bibencil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas toxinas o proteínas insecticidas se entiende expresamente
- 20 incluidas también las pre-toxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o modificadas de cualquier otra forma. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios de proteínas (véase, por ejemplo, Documento WO 02/15701). Ejemplos adicionales de dichas toxinas o plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar dichas toxinas, se encuentran divulgados, por ejemplo, en los Documentos EP-A-374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/018810 y WO 03/052073. Los procedimientos para la producción de dichas plantas genéticamente modificadas son generalmente conocidos para las personas expertas en la técnica y se encuentran descritos, por ejemplo, en las publicaciones anteriormente mencionadas. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas genéticamente modificadas imparten a las plantas que producen estas proteínas protección de plagas perjudiciales procedentes de ciertos grupos taxonómicos de insectos artrópodos, particularmente a escarabajos (Coleópteros), moscas (Dípteros), y mariposas y polillas (Lepidópteros) y a nematodos parásitos de plantas (Nematodos).
- 35 El término “plantas cultivadas” tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, son capaces de sintetizar una o más proteínas para incrementar la resistencia o tolerancia de dichas plantas a patógenos bacterianos, víricos o fúngicos. Los ejemplos de dichas proteínas son las denominadas “proteínas relacionadas con la patogénesis” (Proteínas PR, véase, por ejemplo el Documento EP-A 0 392 225), genes de resistencia a enfermedades de plantas (por ejemplo, cultivares de patatas, los cuales expresan genes de resistencia que actúan contra infestantes *Phytophthora* procedentes de la patata mexicana salvaje *Solanum bulbocastanum*) o lisozima T4 (por ejemplo, cultivares de patatas capaces de sintetizar estas proteínas con resistencia incrementada contra bacterias tal como *Erwinia amylovora*). Los procedimientos para la producción de dichas plantas genéticamente modificadas son generalmente conocidos para las personas expertas en la técnica y se encuentran descritos, por ejemplo, en las publicaciones anteriormente mencionadas.
- 40 El término “plantas cultivadas” tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, son capaces de sintetizar una o más proteínas para incrementar la productividad (por ejemplo, producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido en almidón, contenido en aceite o contenido en proteína), tolerancia a la sequía, salinidad u otros factores medioambientales limitantes del crecimiento o tolerancia a plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o víricos de dichas plantas.
- 45 El término “plantas cultivadas” tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, contienen una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo, cosechas de aceite que producen ácidos omega 3 de cadena larga o ácidos grasos omega 9 insaturados promotores de salud (por ejemplo, colza Nexera<sup>®</sup>).
- 50 El término “plantas cultivadas” tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, contienen una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas
- 55 El término “plantas cultivadas” tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, contienen una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas
- 60 El término “plantas cultivadas” tal como se usa en la presente invención, incluye además plantas que, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, contienen una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas

substancias de contenido, específicamente para mejorar la producción de materias primas, por ejemplo, patatas que producen cantidades incrementadas de amilopectina (por ejemplo, patata Amflora®).

5 Los restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son, al igual que el término halógeno, términos colectivos para listados individuales de los miembros de grupos individuales. El prefijo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub> indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

El término halógeno indica en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

10 El término "alquilo" tal como se usa en la presente invención y en los restos alquilo de alcoxi, alquilcarbonilo, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo y alcoxi alquilo indica en cada caso un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene usualmente desde 1 hasta 10 átomos de carbono, frecuentemente desde 1 hasta 6 átomos de carbono, preferiblemente desde 1 hasta 4 átomos de carbono y, en particular, desde 1 hasta 3 átomos de carbono. Los ejemplos de un grupo alquilo son metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, 2-butilo, iso-butilo, terc-butilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1.etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, n-heptilo, 1-metilhexilo, 2-metilhexilo, 3-metilhexilo, 4-metilhexilo, 5-metilhexilo, 1-etilpentilo, 2-etilpentilo, 3-etilpentilo, 1-propilpentilo, n-octilo, 1-metiloctilo, 2-metilheptilo, 1-etilhexilo, 2-etilhexilo, 1,2-dimetilhexilo, 1-propilpentilo y 2-propilpentilo.

20 El término "alquileo" (o alcanodiilo) tal como se usa en la presente invención, indica en cada caso un radical alquilo tal como se ha definido anteriormente, en el que un átomo de hidrógeno en cualquier posición de la cadena principal de carbono está reemplazado por un sitio de unión adicional, formando, de esta forma, un resto bivalente.

25 El término "haloalquilo" tal como se usa en la presente invención y en los restos haloalquilo de haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilcarbonilo, haloalquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo, indica en cada caso un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene usualmente desde 1 hasta 10 átomos de carbono, frecuentemente desde 1 hasta 6 átomos de carbono, en el que los átomos de hidrógeno de este grupo están parcial o totalmente reemplazados con átomos de halógeno. Los restos haloalquilo preferidos están seleccionados entre haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, más preferiblemente entre haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, en particular entre fluoroalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, y similares.

30 El término "alcoxi" tal como se usa en la presente invención, indica en cada caso un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que está unido mediante un átomo de oxígeno y que usualmente tiene desde 1 hasta 10 átomos de carbono, frecuentemente desde 1 hasta 6 átomos de carbono, preferiblemente desde 1 hasta 4 átomos de carbono. Los ejemplos de un grupo alcoxi son metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, n-butiloxi, 2-butiloxi, isobutiloxi, terc-butiloxi, y similares.

35 El término "haloalcoxi" tal como se usa en la presente invención, indica en cada caso un grupo alcoxi de cadena recta o ramificada que tiene desde 1 hasta 10 átomos de carbono, frecuentemente desde 1 hasta 4 átomos de carbono, preferiblemente desde 1 hasta 3 átomos de carbono, en el que los átomos de hidrógeno de este grupo están parcial o totalmente reemplazados con átomos de halógeno, en particular átomos de flúor. Los restos haloalcoxi preferidos incluyen haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular fluoroalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, tales como fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi, y similares.

40 El término "cicloalquilo" tal como se usa en la presente invención y en los restos cicloalquilo de cicloalcoxi y cicloalquilmetilo, indica en cada caso un radical cicloalifático mono- o bicíclico que tiene usualmente desde 3 hasta 10 átomos de carbono o 3 a 6 átomos de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, biciclo[2.1.1]hexilo, biciclo[3.1.1]heptilo, biciclo[2.2.1]heptilo, y biciclo[2.2.2]octilo.

45 El término "halocicloalquilo" tal como se usa en la presente invención y en los restos halocicloalquilo de halocicloalquilmetilo, indica en cada caso un radical cicloalifático mono- o bicíclico que tiene usualmente desde 3 hasta 10 átomos o 3 a 6 átomos de carbono, en el que al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 ó 5 de los átomos de hidrógeno están reemplazados por halógeno, en particular por flúor o cloro. Los ejemplos son 1- y 2-fluorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-difluorociclopropilo, 1,2,2-trifluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, 1- y 2-clorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-diclorociclopropilo, 1,2,2-triclorociclopropilo, 2,2,3,3-tetraclorociclopropilo, 1- y 2-clorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-diclorociclopropilo, 1,2,2-triclorociclopropilo, 2,2,3,3-tetraclorociclopropilo, 1-, 2- y 3-fluorociclopropilo, 1,2-, 2,2-, 3,3-, 3,4-, 2,5-difluorociclopropilo, 1-, 2- y 3-clorociclopropilo, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-diclorociclopropilo y similares.

50 El término "alqueno" tal como se usa en la presente invención, indica en cada caso un radical hidrocarburo insaturado individual que tiene usualmente 2 a 10, preferiblemente 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo vinilo, alilo (2-propen-1-ilo), 1-propen-1-ilo, 2-propen-2-ilo, metililo (2-metilprop-2-en-1-ilo), 2-buten-1-ilo, 3-buten-1-ilo, 2-penten-1-ilo, 3-penten-1-ilo, 4-penten-1-ilo, 1-metilbut-2-en-1-ilo, 2-etilprop-2-en-1-ilo y similares.

El término "alquino" tal como se usa en la presente invención, indica en cada caso un radical hidrocarburo insaturado individual que tiene usualmente 2 a 10, preferiblemente 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo etinilo, propargilo

(2-propin-1-ilo), 1-propin-1-ilo, 1-metilprop-2-in-1-ilo), 2-butin-1-ilo, 3-butin-1-ilo, 1-pentin-1-ilo, 3-pentin-1-ilo, 4-pentin-1-ilo, 1-metilbut-2-in-1-ilo, 2-etilprop-2-in-1-ilo y similares.

5 El término "alcoخالquilo" tal como se usa en la presente invención se refiere a alquilo que usualmente comprende 1 a 4 átomos de carbono, en el que 1 átomo de carbono porta un radical alcoxi, usualmente comprende 1 a 10, en particular 1 a 4 átomos de carbono tal como se ha definido anteriormente. Los ejemplos son CH<sub>2</sub>OHCH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-OC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, n-propoximetilo, CH<sub>2</sub>-OCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, n-butoximetilo, (1-metilpropoxi)metilo, (2-metilpropoxi)metilo, CH<sub>2</sub>-OC(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, 2-(metoxi)etilo, 2-(etoxi)etilo, 2-(n-propoxi)etilo, 2-(1-metiletoxi)etilo, 2-(n-butoxi)etilo, 2-(1-metilpropoxi)etilo, 2-(2-metilpropoxi)etilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)etilo, 2-(metoxi)propilo, 2-(etoxi)propilo, 2-(n-propoxi)propilo, 2-(1-metiletoxi)propilo, 2-(n-butoxi)propilo, 2-(1-metilpropoxi)propilo, 2-(2-metilpropoxi)propilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 3-(metoxi)propilo, 3-(etoxi)propilo, 3-(n-propoxi)propilo, 3-(1-metiletoxi)propilo, 3-(n-butoxi)propilo, 3-(1-metilpropoxi)propilo, 3-(2-metilpropoxi)propilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 2-(metoxi)butilo, 2-(etoxi)butilo, 2-(n-propoxi)butilo, 2-(1-metiletoxi)butilo, 2-(n-butoxi)butilo, 2-(1-metilpropoxi)butilo, 2-(2-metilpropoxi)butilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 3-(metoxi)butilo, 3-(etoxi)butilo, 3-(n-propoxi)butilo, 3-(1-metiletoxi)butilo, 3-(n-butoxi)butilo, 3-(1-metilpropoxi)butilo, 3-(2-metilpropoxi)butilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 4-(metoxi)butilo, 4-(etoxi)butilo, 4-(n-propoxi)butilo, 4-(1-metiletoxi)butilo, 4-(n-butoxi)butilo, 4-(1-metilpropoxi)butilo, 4-(2-metilpropoxi)butilo, 4-(1,1-dimetiletoxi)butilo y similares.

20 El término "alquilcarbonilo" (alquil-C(=O)-) tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificada tal como se ha definido anteriormente, que comprende 1 a 10 átomos de carbono (= alquilcarbonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>), preferiblemente 1 hasta 4 átomos de carbono (= alquilcarbonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), unido a través de un átomo de carbono del grupo carbonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquilcarbonilo" tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilcarbonilo tal como se ha definido anteriormente, en el que los átomos de hidrógeno están parcial o completamente substituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

25 El término "alquilitio" (también alquilsulfinito o alquil-S-) tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que comprende 1 a 10 átomos de carbono (= alquilitio de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>), preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono (= alquilitio de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), tal como se ha definido anteriormente, que está unido mediante un átomo de azufre en cualquier posición en el grupo alquilo.

30 El término "haloalquilitio" tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilitio tal como se ha definido anteriormente, en el que los átomos de hidrógeno están parcial o completamente substituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

El término "alquilsulfinito" (también alquilsulfoxilo o alquil-S(=O)-) tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada tal como se ha definido anteriormente que comprende 1 a 10 átomos de carbono (= alquilsulfinito de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>), preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfinito de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), unido mediante el átomo de azufre del grupo sulfinito en cualquier posición en el grupo alquilo.

35 El término "haloalquilsulfinito" tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilsulfinito tal como se ha definido anteriormente, en el que los átomos de hidrógeno están parcial o completamente substituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

40 El término "alquilsulfonilo" (también alquil-S(=O)<sub>2</sub>-) tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que comprende 1 a 10 átomos de carbono (= alquilsulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>), preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), tal como se ha definido anteriormente, que está unido mediante el átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquilsulfonilo" tal como se usa en la presente invención se refiere a un grupo alquilsulfonilo tal como se ha definido anteriormente, en el que los átomos de hidrógeno están parcial o completamente substituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

45 El término "heterocíclico" incluye en general radicales heterocíclicos monocíclicos de 5-, 6-, 7- ó 8 átomos y radicales heterocíclicos bicíclicos de 8 a 10 átomos, pudiendo estar los radicales mono- y bicíclicos saturados, parcialmente insaturados o insaturados. Los radicales heterocíclicos mono- y bicíclicos usualmente comprenden 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre N, O y S como átomos de anillos.

50 Los ejemplos de radicales heterocíclicos de 5 ó 6 átomos saturados o insaturados comprenden anillos heterocíclicos no aromáticos saturados o insaturados, tales como pirrolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, dioxolenilo, tiolanilo, dihidrotienilo, oxazolidinilo, isoxazolinilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, tiazolinilo, isotiazolinilo, tiazolidinilo, isotiazolidinilo, oxatolanilo, piperidinilo, piperacínilo, piranilo, pirazolidinilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, 1,3- y 1,4-dioxanilo, tiopiranilo, dihidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiacínilo y similares. Los ejemplos para anillo heterocíclico que comprenden también 1 ó 2 grupos carbonilo como átomos de anillo, comprenden pirrolidin-2-onilo, pirrolidin-2,5-dionilo, imidazolidin-2-onilo, oxazolidin-2-onilo, tiazolidin-2-onilo y similares.

El término "hetarilo" incluye radicales heteroaromáticos de 5 ó 6 átomos monocíclicos que comprenden como átomos de anillo 1, 2, 3 ó 4 heteroátomos seleccionados entre N, O y S. Los ejemplos de radicales heteroaromáticos de 5 ó 6 átomos incluyen piridilo, es decir, 2-, 3- ó 4-piridilo, pirimidinilo, es decir, 2-, 4- ó 5-pirimidinilo, piracinilo, piridacínilo, es decir 3- ó 4-piridacínilo, tienilo, es decir 2- ó 3-tienilo, furilo, es decir 2- ó 3-furilo, pirrolilo, es decir 2- ó 3-pirrolilo, oxazolilo, es decir 2-, 3- ó 5-oxazolilo, isoxazolilo, es decir, 3-, 4- ó 5-isoxazolilo, tiazolilo, es decir, 2-, 3- ó 5-tiazolilo, isotiazolilo, es decir, 3-, 4- ó 5-isotiazolilo, pirazolilo, es decir, 1-, 3-, 4- ó 5-pirazolilo, imidazolilo, es decir, 1-, 2-, 4- ó 5-imidazolilo, oxadiazolilo, por ejemplo, 2- ó 5-[1.3.4]oxadiazolilo, 4- ó 5-(1,2,3-oxadiazol)ilo, 3- ó 5-(1,2,4-oxadiazol)ilo, 2- ó 5-(1,3,4-tiadiazol)ilo, tiadiazolilo, por ejemplo 2- ó 5-(1,3,4-tiadiazol)ilo, 4- ó 5-(1,2,3-tiadiazol)ilo, 3- ó 5-(1,2,4-tiadiazol)ilo, triazolilo, por ejemplo 1H-, 2H- o 3H-1,2,3-triazol-4-ilo, 2H-triazol-3-ilo, 1H-, 2H-, o 4H-1,2,4-triazolilo y tetrazolilo, es decir, 1H- o 2H-tetrazolilo.

El término "hetarilo" incluye también radicales heteroaromáticos de 8 a 10 átomos bicíclicos que comprenden como átomos de anillo 1, 2 ó 3 heteroátomos seleccionados entre N, O y S, en los que un anillo heteroaromático de 5 ó 6 átomos está fusionado a un anillo fenilo o a un radical heteroaromático de 5 ó 6 átomos. Los ejemplos de anillos heteroaromáticos de 5 ó 6 átomos fusionados a un anillo fenilo o a un radical heteroaromático de 5 ó 6 átomos incluyen benzofuranilo, benzotienilo, indolilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzoxadiazolilo, benzotiadiazolilo, benzoxacínilo, quinolinilo, isoquinolinilo, purinilo, 1,8-naftiridilo, pteridilo, pirido[3,2-d]pirimidilo o piridoimidazolilo y similares. Estos radicales hetarilo fusionados pueden estar unidos al resto de la molécula mediante cualquier átomo de anillo del anillo heteroaromático de 5 ó 6 átomos o mediante un átomo de carbono del resto fenilo fusionado.

Los términos "fenilalquilo" y "fenoxialquilo" se refieren a fenilo o fenoxi, respectivamente, los cuales están unidos mediante un grupo alquilo, en particular un grupo metilo (= hetarilmetilo), al resto de la molécula, incluyendo los ejemplos bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, 2-fenoxietilo y similares.

Los términos "heterocicloalquilo" y "hetarilalquilo" se refieren a heterocíclico o hetarilo, respectivamente, tal como se han definido anteriormente, los cuales están unidos mediante un grupo alquilo, en particular un grupo metilo (= heterocicliometilo o hetarilmetilo, respectivamente), al resto de la molécula.

Las observaciones hechas más adelante como a realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de las fórmulas I o II son válidas por sí mismas, así como, preferiblemente, en combinación entre sí. Las observaciones hechas más adelante referentes a realizaciones preferidas de las variables son además válidas en lo referente a los compuestos de las fórmulas I o II así como a lo referente a los usos y procedimientos de acuerdo con la invención y las composiciones de acuerdo con la presente invención.

Una primera realización preferida de la invención se refiere a los compuestos de piridacina de la fórmula I, a sus sales y a sus N-óxidos.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a aquellos compuestos en los que X es oxígeno. A estos compuestos se hace igualmente referencia en adelante en la presente invención como compuestos de fórmula I'.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a aquellos compuestos en los que Z es O.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a aquellos compuestos en los que Z es S.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia además a aquellos compuestos en los que R<sup>1</sup> es hidrógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo de C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenilo de C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo de C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquileo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-CN, OR<sup>a</sup>, C(Y)R<sup>b</sup>, C(Y)OR<sup>c</sup>, S(O)<sub>2</sub>R<sup>d</sup>. Preferiblemente, R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquileo de C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-CN, alquileo de C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-OR<sup>a</sup>, hetaril-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, heterocicli-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> o cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>. Más preferiblemente, R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. En particular, R<sup>1</sup> es hidrógeno o alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>.

Otra realización de la invención se refiere a compuestos de piridacina de la fórmula II, a las sales y N-óxidos de los mismos y a los procedimientos y usos de dichos compuestos. En los compuestos de la fórmula II, se da preferencia a aquellos compuestos en los que X<sup>2</sup> en la fórmula II es OR<sup>2a</sup> o SR<sup>2a</sup>. En estos compuestos, R<sup>2a</sup> es preferiblemente alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilmetilo o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>.

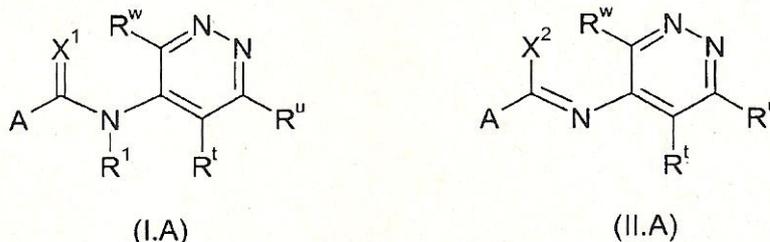
Otra realización de la invención se refiere a compuestos de piridacina de la fórmula II, en los que X<sup>2</sup> es NR<sup>2b</sup>R<sup>2c</sup>. En estos compuestos R<sup>2b</sup>, R<sup>2c</sup> están preferiblemente seleccionados, independientemente entre sí, entre alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilmetilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> o R<sup>2b</sup>, R<sup>2c</sup> conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un heterociclo de 5 ó 6 átomos unidos a nitrógeno, que puede comprender un heteroátomo adicional seleccionado entre O, S y N, por ejemplo, siendo NR<sup>2b</sup>R<sup>2c</sup> 1-pirrolidinilo, 1-piperacínilo, 4-morfolinilo o 4-tiomorfolinilo.

Entre los compuestos de las fórmulas I y II se da preferencia a aquellos compuestos en los que R<sup>u</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, y alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

Entre los compuestos de las fórmulas I y II se da preferencia a aquellos compuestos en los que  $R^t$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_3$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , y alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ .

- 5 Entre los compuestos de las fórmulas I y II se da preferencia a aquellos compuestos en los que W es un grupo  $C(R^w)$ . Los ejemplos de dichos compuestos son compuestos de las fórmulas I o II en los que el heterociclo que comprende los grupos V y W es piridacín-4-ilo.

Entre los compuestos de las fórmulas I y II se da preferencia además a aquellos compuestos seleccionados entre compuestos 4-piridacino sustituidos de las fórmulas I.A o II.A



- 10 en los que A,  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $R^1$ ,  $R^t$ ,  $R^u$  y  $R^w$  independientemente entre sí, son tal como se han definido en la presente invención.

Entre los compuestos de las fórmulas I y II se da preferencia además a aquellos compuestos en los que W es  $CR^w$ , siendo  $R^w$  hidrógeno, es decir, W es CH.

- 15 Entre los compuestos de las fórmulas I y II se da preferencia además a aquellos compuestos en los que  $R^t$ ,  $R^u$ ,  $R^v$  y  $R^w$ , si están presentes, están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi o trofluorometoxi. Más preferiblemente, se da preferencia a aquellos compuestos en los que al menos dos de los radicales  $R^t$ ,  $R^u$ ,  $R^v$  o  $R^w$ , si están presentes, son hidrógeno.

Una realización particular de la invención se refiere a compuestos de las fórmulas I o II en los que V y W están seleccionados entre N y CH. Lo más particularmente,  $R^t$ ,  $R^u$ ,  $R^v$  y  $R^w$ , si están presentes, son hidrógeno.

- 20 Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de piridacina de las fórmulas I y II, a las sales y N-óxidos de los mismos y a los procedimientos y usos de dichos compuestos, en los que A es un radical A1. Entre los compuestos, en los que A es A1, se da preferencia a los compuestos de la fórmula I en los que  $X^1$ ,  $R^1$ ,  $R^t$ ,  $R^u$ ,  $R^v$  y  $R^w$  son tal como se han definido anteriormente y, en particular, tienen uno de los significados preferidos.

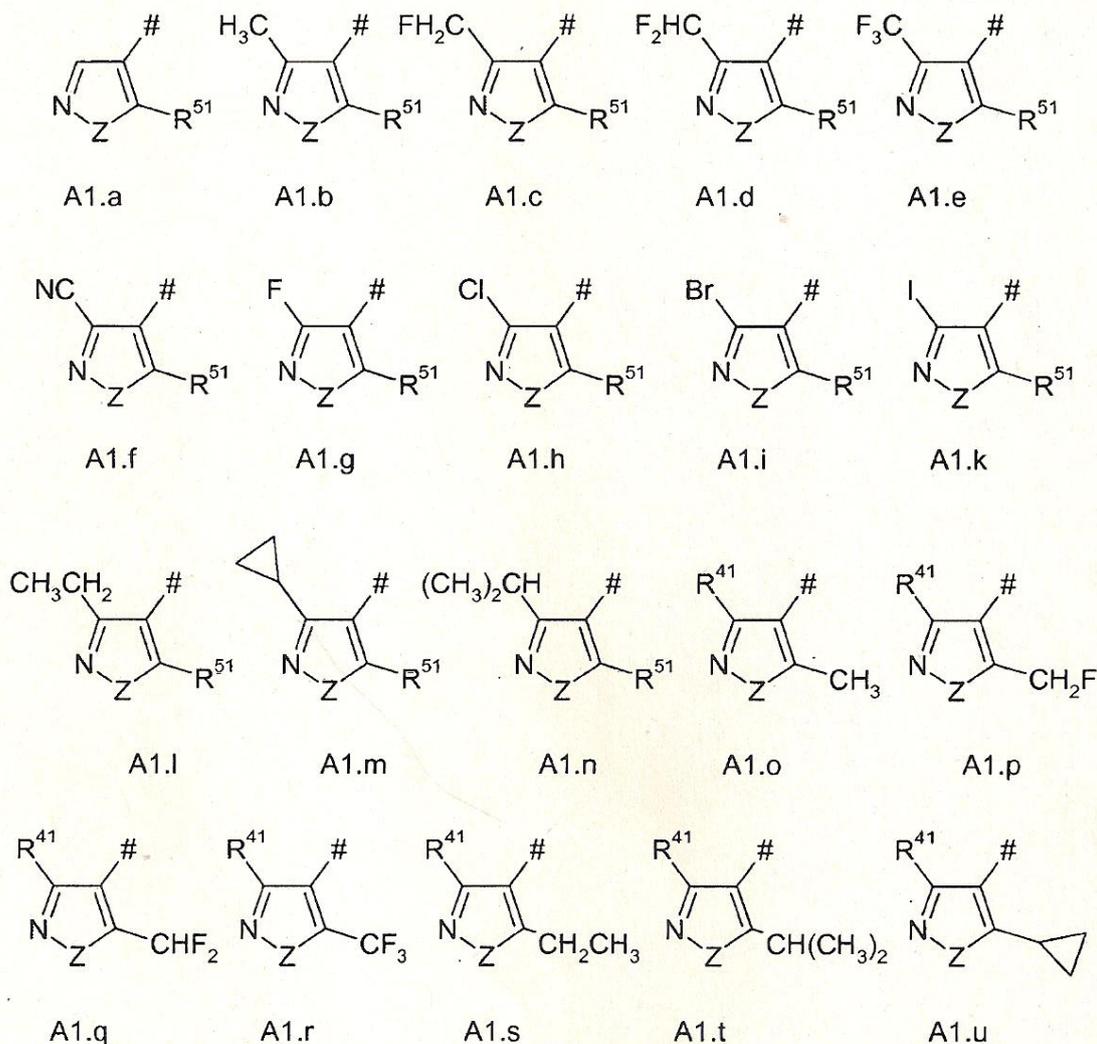
- 25 Entre los compuestos de las fórmulas I y II en los que A es A1, se da preferencia además a aquellos compuestos en los que  $R^{41}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_4$  y alquenilo de  $C_2-C_{10}$  en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden portar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_3$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , alquisulfonilo de  $C_1-C_4$ , y haloalquilsulfonilo de  $C_2-C_4$ , o en los que  $R^{41}$  está seleccionado además entre cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , hetarilo de  $C_5-C_6$  y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , alquisulfonilo de  $C_1-C_4$  y haloalquilsulfonilo de  $C_2-C_4$ .

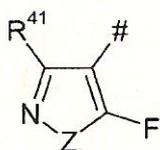
- 35 Preferiblemente,  $R^{41}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$  y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_3$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ . Preferiblemente,  $R^{41}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$  y halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ . Más preferiblemente,  $R^{41}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$  y halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ . Lo más preferiblemente,  $R^{41}$  está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_3$ , haloalquilo de  $C_1-C_3$  y cicloalquilo de  $C_3-C_5$ . Incluso más preferiblemente,  $R^{41}$  es hidrógeno o alquilo de  $C_1-C_3$ . En particular,  $R^{41}$  es hidrógeno.

- 45 Entre los compuestos de las fórmulas I y II en los que A es A1, se da preferencia además a aquellos compuestos en los que  $R^{51}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_{40}$  y alquenilo de  $C_2-C_{10}$  en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden portar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de

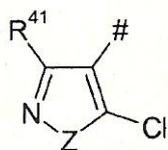
5 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquisulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, o en los que R<sup>51</sup> está seleccionado además entre cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, hetarilo de C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub> y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquisulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>. Preferiblemente, R<sup>51</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. Preferiblemente, R<sup>51</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Más preferiblemente, R<sup>51</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Lo más preferiblemente, R<sup>51</sup> está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>. Incluso más preferiblemente, R<sup>51</sup> es hidrógeno o alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>. En particular, R<sup>51</sup> es hidrógeno.

15 Los ejemplos de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d, A1.e, A1.f, A1.g, A1.h, A1.i, A1.k, A1.l, A1.m, A1.n, A1.o, A1.p, A1.q, A1.r, A1.s, A1.t, A1.u, A1.v, A1.w, A1.x, A1.y y A1.z, en los que Z es O y R<sup>51</sup>, R<sup>41</sup> es un radical tal como se define en una línea de la Tabla A.(radicales A1.a1 - A1.a81 a A1.z1 - A1.z81):

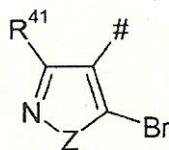




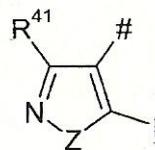
A1.v



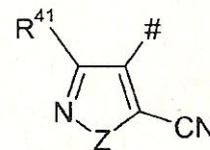
A1.w



A1.x



A1.y



A1.z

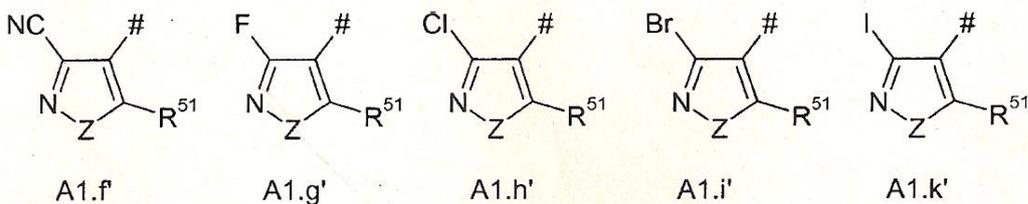
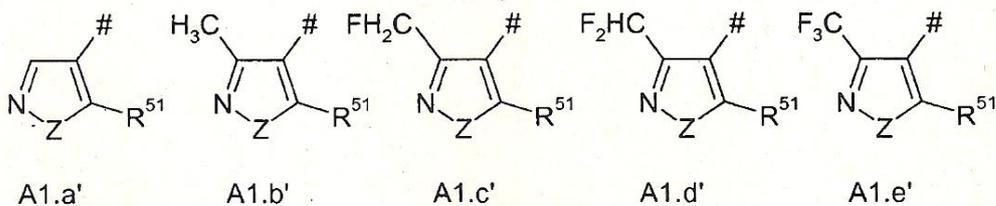
Tabla A

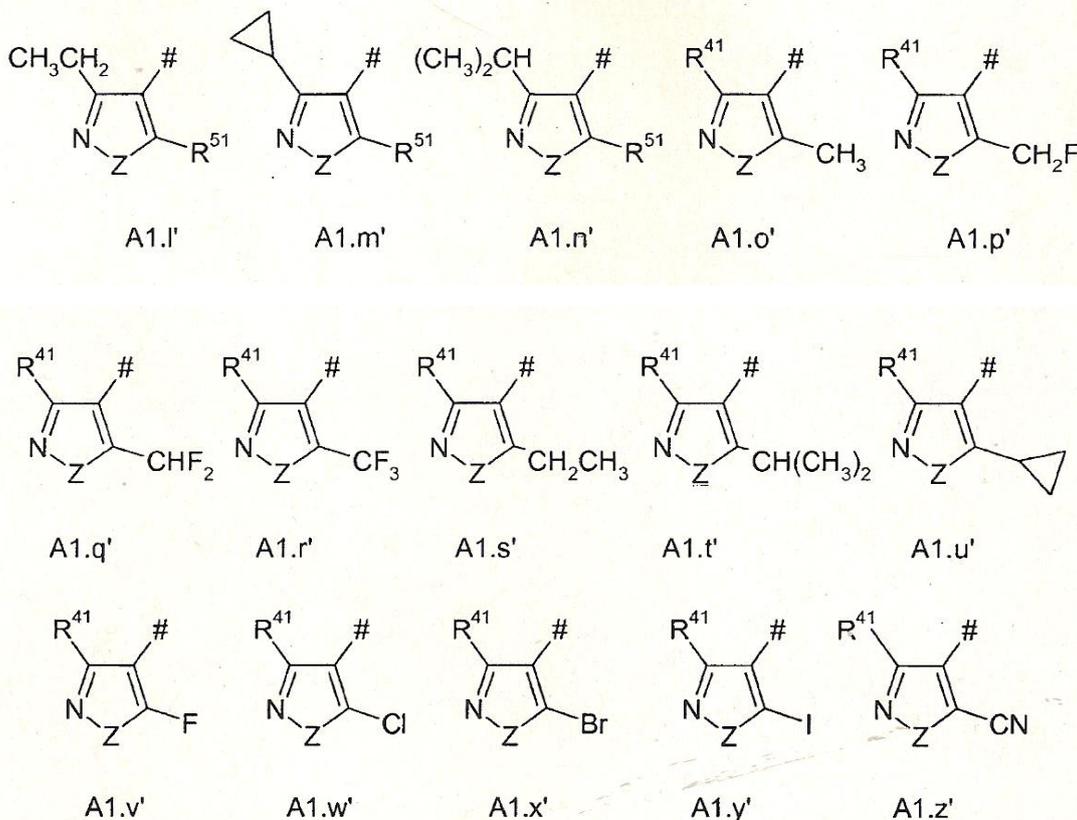
Línea	Radical R <sup>51</sup> /R <sup>41</sup> /R <sup>52</sup> /R <sup>53</sup>	Línea	Radical R <sup>51</sup> /R <sup>41</sup> /R <sup>52</sup> /R <sup>53</sup>
1	H	28	5-tiazolilo
2	CH <sub>3</sub>	29	4-trifluorometil-tiazol-2-ilo
3	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	30	4-metiltiazol-2-ilo
4	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	31	4-feniltiazol-2-ilo
5	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	32	5-triazolilo
6	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	33	3-metil-triazol-5-ilo
7	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	34	4-clorobencilo
8	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	35	4-nitro-1-pirazol-metilo
9	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	36	2-imidazolilo
10	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	37	4-imidazolilo
11	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	38	5-imidazolilo
12	4-(CH <sub>3</sub> O)-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	39	2-oxazolilo
13	2-piridilo	40	4-oxazolilo
14	5-cloro-2-piridilo	41	5-oxazolilo
15	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	42	3-isoxazolilo
16	4-(OCF <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	43	4-isoxazolilo
17	4-(SCF <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	44	5-isoxazolilo
18	4-(OCHF <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	45	3-metilisoxazol-5-ilo
19	4-(CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	46	5-metilisoxazol-3-ilo
20	4-(SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	47	3-pirazolilo
21	2,6-Cl-4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>	48	[1.3.4]tiadiazol-2-ilo
22	3-cloro-4-trifluoro-metilpiridin-2-ilo	49	5-tetrazolio
23	3-piridilo	50	4-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
24	4-piridilo	51	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
25	2-tiazolilo	52	2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
26	4,5-dimetil-tiazol-2-ilo	53	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
27	4-tiazolilo	54	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>

Tabla A (Cont.)

Línea	Radical R <sup>51</sup> /R <sup>41</sup> /R <sup>52</sup> /R <sup>53</sup>	Línea	Radical R <sup>51</sup> /R <sup>41</sup> /R <sup>52</sup> /R <sup>53</sup>
55	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	70	2,4,6-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
56	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	71	2,3,4-Cl <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>2</sub>
57	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	72	2,6-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>
58	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	73	CH <sub>2</sub> F
59	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	74	CHF <sub>2</sub>
60	2-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	75	CF <sub>3</sub>
61	3-CH <sub>3</sub> O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	76	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
62	3-Cl-4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	77	CH <sub>2</sub> Cl
63	3-NO <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	78	CHCl <sub>2</sub>
64	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	79	CCl <sub>3</sub>
65	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	80	CH <sub>2</sub> CHCl <sub>2</sub>
66	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	81	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>
67	2-fenil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	82	F
68	3-fenil-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	83	Cl
69	2-F-4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	84	Br

5 Los análogos de las estructuras listadas anteriormente, ejemplos de los radicales A1, son los radicales de las fórmulas A1.a', A1.b', A1.c', A1.d', A1.e', A1.f', A1.g', A1.h', A1.i', A1.k', A1.l', A1.m', A1.n', A1.o', A1.p', A1.q', A1.r', A1.s', A1.t', A1.u', A1.v', A1.w', A1.x', A1.y' y A1.z', en los que Z es O y R<sup>51</sup>, R<sup>41</sup> es un radical tal como se define en una línea de la Tabla A. (radicales A1.a'1 – A1.a'81 a A1.z'1 – A1.z'81).





Una realización adicional de la invención se refiere a compuestos de piridacina de las fórmulas I y II, a las sales y N-óxidos de los mismos y a los procedimientos y usos de dichos compuestos, en los que A es un radical A2. Entre los compuestos de las fórmula I y II, en los que A es un radical A2, se da preferencia a los compuestos de las fórmulas I o II en los que  $\text{X}^1$ ,  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^t$ ,  $\text{R}^u$ ,  $\text{R}^v$  y  $\text{R}^w$  son tal como se han definido anteriormente y, en particular, tienen uno de los significados preferidos.

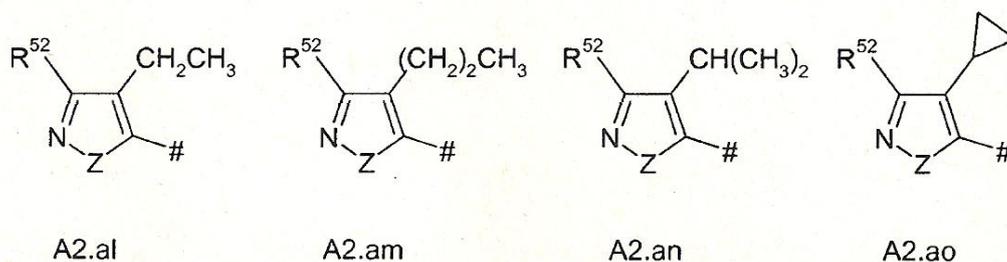
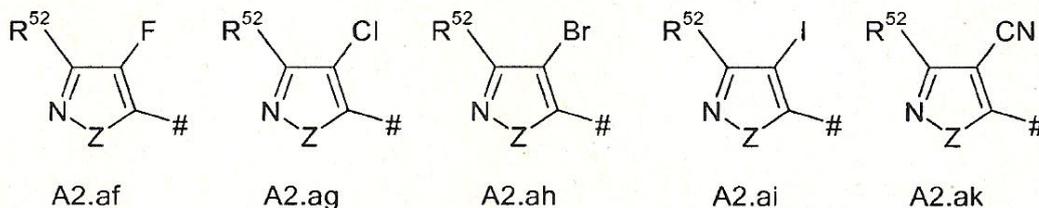
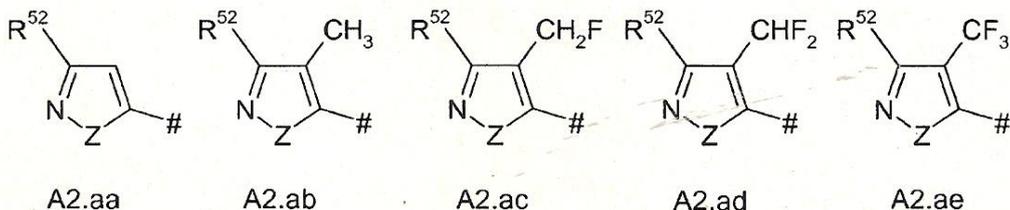
Entre los compuestos de las fórmulas I y II en los que A es A2, se da preferencia además a compuestos en los que  $\text{R}^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$  y alquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden portar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquisulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$  y haloalquilsulfonilo de  $\text{C}_2\text{-C}_4$ , o en los que  $\text{R}^{42}$  está seleccionado además entre cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , hetarilo de  $\text{C}_5\text{-C}_6$  y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquisulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$  y haloalquilsulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ . Entre los compuestos de las fórmulas I y II en los que A es A2, se da preferencia a aquellos compuestos en los que  $\text{R}^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$  y alquenilo de  $\text{C}_2\text{-C}_3$  en los que los 2 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden portar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , heterarilo de  $\text{C}_5\text{-C}_6$ , fenilo y fenoxi, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquisulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$  y haloalquilsulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , o en los que  $\text{R}^{42}$  está seleccionado además entre cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , hetarilo de  $\text{C}_5\text{-C}_6$  y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquisulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$  y haloalquilsulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ . Más preferiblemente,  $\text{R}^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , halocicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$  y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$  y haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , en particular,  $\text{R}^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$  y halocicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ .

Preferiblemente,  $R^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$  y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ . Preferiblemente,  $R^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$  y halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ . Más preferiblemente,  $R^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$  y halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ . Lo más preferiblemente,  $R^{42}$  está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_3$ , haloalquilo de  $C_1-C_3$  y cicloalquilo de  $C_3-C_5$ . Incluso más preferiblemente,  $R^{42}$  es hidrógeno o alquilo de  $C_1-C_3$ . En particular,  $R^{42}$  es hidrógeno.

Entre los compuestos de las fórmulas I y II en los que A es A2, se da preferencia además a aquellos compuestos en los que  $R^{52}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_{10}$  y alqueno de  $C_2-C_{10}$  en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden portar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , alquisulfonilo de  $C_1-C_4$  y haloalquilsulfonilo de  $C_2-C_4$ , o en los que  $R^{52}$  está seleccionado además entre cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , hetarilo de  $C_5-C_6$  y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , alquisulfonilo de  $C_1-C_4$  y haloalquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ .

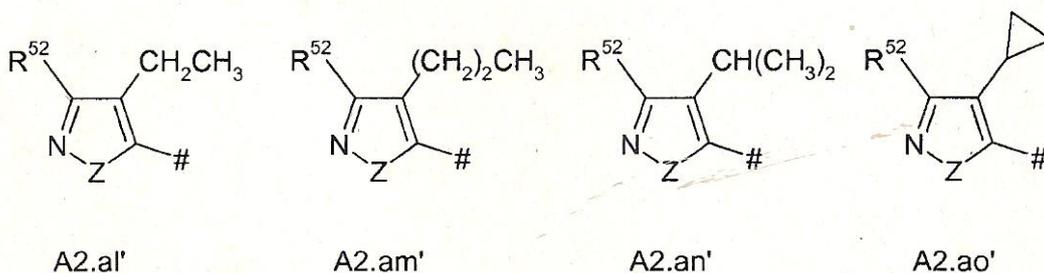
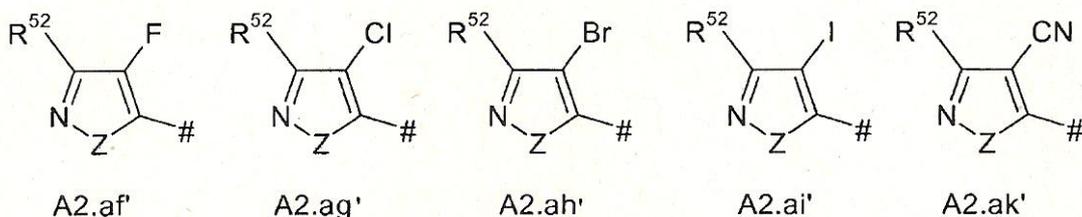
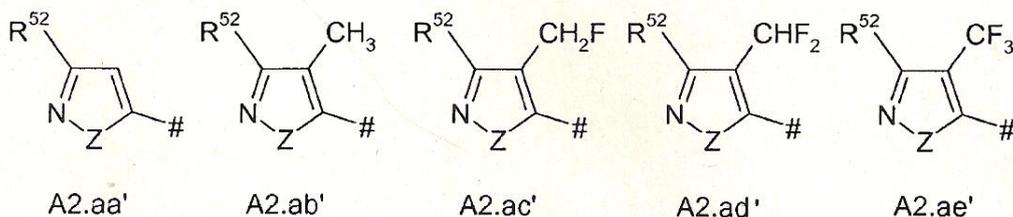
Preferiblemente,  $R^{52}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$  y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ . Preferiblemente,  $R^{52}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$  y halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ . Más preferiblemente,  $R^{52}$  es hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$  o haloalquilo de  $C_1-C_4$ . Incluso más preferiblemente,  $R^{52}$  es hidrógeno o alquilo de  $C_1-C_3$ . En particular,  $R^{52}$  es hidrógeno.

Los ejemplos de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.aa, A2.ab, A2.ac, A2.ad, A2.ae, A2.af, A2.ag, A2.ah, A2.ai, A2.ak, A2.al, A2.am, A2.an y A2.ao, en los que Z es O y  $R^{52}$  es un radical tal como se define en una línea de la Tabla A (radicales A2.aa1 – A2.aa81 a A2.ao1 – A2.ao81):



Los análogos de las estructuras anteriormente listadas, ejemplos de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.aa', A2.ab', A2.ac', A2.ad', A2.ae', A2.af', A2a.g', A2.ah', A2.ai', A2.ak', A2.al', A2.am', A2.an' y A2.ao', en los que Z es S y R<sup>52</sup> es un radical tal como se define en una línea de la Tabla A (radicales A2.aa'1 – A2.aa'81 a A2.ao'1 – A2.ao'81).

5



10 Una realización adicional de la invención se refiere a compuestos de piridacina de las fórmulas I y II, a las sales y N-óxidos de los mismos y a los procedimientos y usos de dichos compuestos, en los que A es un radical A3. Entre los compuestos de la fórmula I y II en los que A es un radical A3, se da preferencia a los compuestos de las fórmulas I o II en los que X<sup>1</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, R<sup>v</sup> y R<sup>w</sup> son tal como se han definido anteriormente y, en particular, tienen uno de los significados preferidos.

15 Entre los compuestos de las fórmulas I y II en los que A es A3, se da preferencia a compuestos en los que R<sup>43</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y alqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> en los que los 2 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden portar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquisulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, o en los que R<sup>43</sup> está seleccionado además entre cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, hetarilo de C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub> y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquisulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

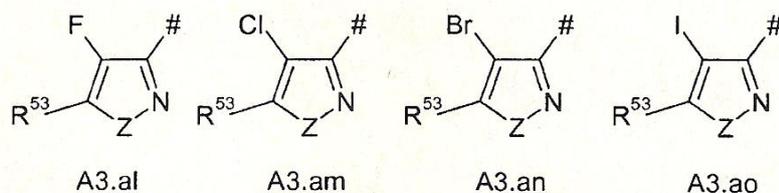
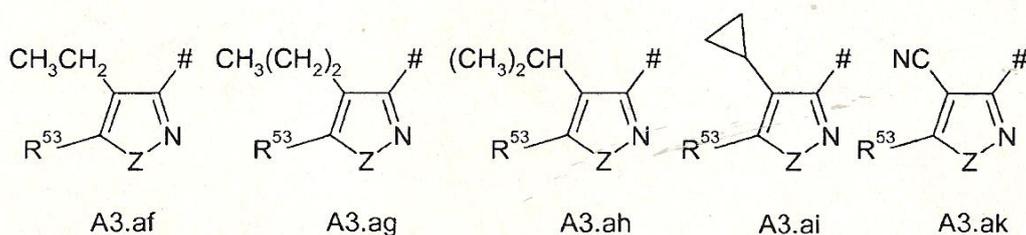
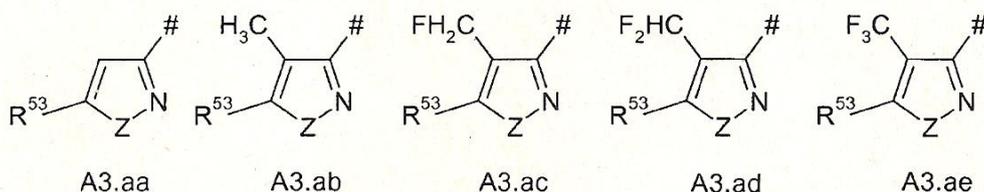
25 Preferiblemente, R<sup>43</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. Preferiblemente, R<sup>43</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Más preferiblemente, R<sup>43</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Lo más preferiblemente, R<sup>43</sup> está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>. Incluso más preferiblemente, R<sup>43</sup> es hidrógeno o alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>. En particular, R<sup>43</sup> es hidrógeno.

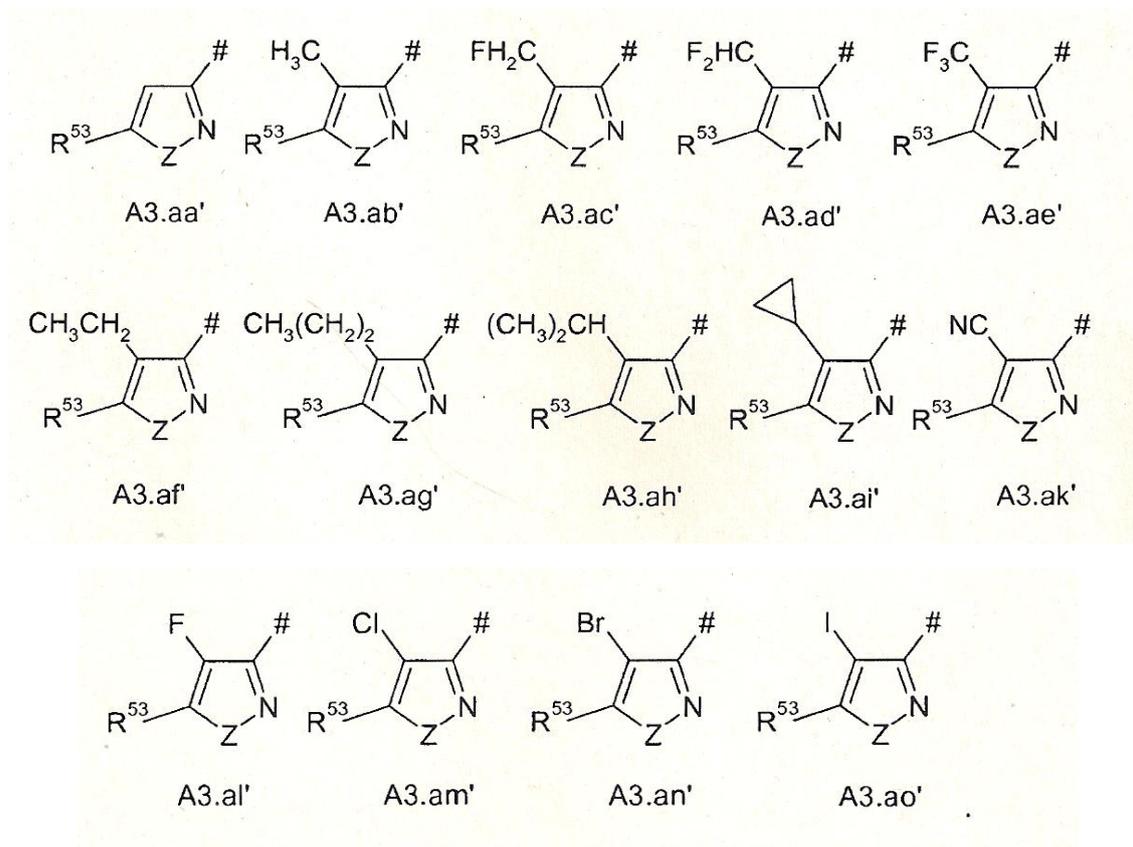
- 5 Entre los compuestos de las fórmulas I y II en los que A es A3, se da preferencia además a aquellos compuestos en los que R<sup>53</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> y alqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub> en los que los 2 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden portar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquisulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo de C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, o en los que R<sup>53</sup> está seleccionado además entre cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, hetarilo de C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub> y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquisulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

Preferiblemente, R<sup>53</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales seleccionados entre halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>. Preferiblemente, R<sup>53</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, CN, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Más preferiblemente, R<sup>53</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Lo más preferiblemente, R<sup>53</sup> está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>. Incluso más preferiblemente, R<sup>53</sup> es hidrógeno o alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>. En particular, R<sup>53</sup> es hidrógeno.

Los ejemplos de radicales adecuados A3 son los radicales de las fórmulas A3.aa, A3.ab, A3.ac, A3.ad, A3.ae, A3.af, A3.a.g, A3.ah, A3.ai, A3.ak, A3.al, A3.am, A3.an y A3.ao, en los que Z es O y R<sup>53</sup> es un radical tal como se define en una línea de la Tabla A (radicales A3.aa1 – A3.aa81 a A3.ao1 – A3.ao81):

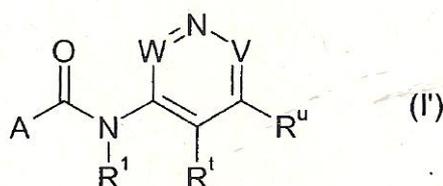


Los análogos de las estructuras anteriormente listadas, ejemplos de radicales adecuados A3 son los radicales de las fórmulas A3.aa', A3.ab', A3.ac', A3.ad', A3.ae', A3.af', A3a.g', A3.ah', A3.ai', A3.ak', A3.al', A3.am', A3.an' y A3.ao', en los que Z es S y R<sup>53</sup> es un radical tal como se define en una línea de la Tabla A (radicales A3.aa'1 – A3.aa'81 a A3.ao'1 – A3.ao'81).



5

Una realización muy preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que X<sup>1</sup> es O. A estos compuestos se hace referencia igualmente más adelante en la presente invención como compuestos I'.



10

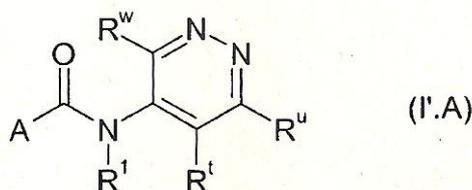
En la fórmula I', las variables A, R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, V y W son tal como se definen en la presente invención.

Entre los compuestos de la fórmula I', se da preferencia a aquellos compuestos en los que al menos uno de los radicales R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, V y W, preferiblemente al menos dos de los radicales R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, V y W, y más preferiblemente al menos todos los radicales R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, V y W tienen uno de los significados preferidos.

15 Entre los compuestos de la fórmula I', se da preferencia además a aquellos compuestos en los que A es un radical A1, por ejemplo, un radical seleccionado entre los radicales isoxazol A1.a1 a A1.z81.

Entre los compuestos de la fórmula I', se da preferencia además a aquellos compuestos en los que A es un radical A1, por ejemplo, un radical seleccionado entre los radicales isotiazol A1.a'1 a A1.z'81.

20 Una realización particularmente preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I'.A y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que



A es un radical A1, tal como se define en la presente invención, en particular A1, en el que  $R^{41}$ ,  $R^{51}$  tienen los significados preferidos, en particular un radical isoxazol de las fórmulas A1.a a A1.z, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isoxazol A1.a1 a A1.z81;

5  $R^1$  es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

10  $R^1$  es además lo más preferiblemente propilo, iso-propilo, butilo, iso-butilo, terc-butilo,  $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CBr}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{C}_2\text{F}$ ,  $\text{CH}_2\text{C}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{C}_2\text{Br}$ ,  $\text{CH}_2\text{CHF}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CHCl}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CHBr}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CN}$ ,  $\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$ ,  $\text{CH}_2\text{CHCN}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$ , etil-ciclopropano, etil-ciclobutano, 2-metil-oxelano, 3-etil-oxelano, 3-metiltietano, 3-metiltietano, 1,1-dióxido, etil-ciclopentano, 2-etil-tetrahidrofurano, 3-etil-tetrahidrofurano, metil-ciclopropano, metil-ciclobutano, 2-metil-oxetano, 3-metil-oxetano, 3-metil-tietano, 3-tietano, 1,1-dióxido, ciclopentano, 2-metil-tetrahidrofurano, tetrahidrofurano, tolueno, 2-metil-furano, 3-metil-furano, 2-etil-tiofeno, 3-metil-tiofeno, 5-etil-tiofeno, 5-etil-isotiazol, 4-etil-isotiazol, 3-metil-isotiazol, 3-metil-isoxazol, 5-metil-oxazol, 2-etil-oxazol, 5-etil-tiazol, 2-etil-tiazol, 4-etil-tiazol, 5-metil-1H-pirazol, 4-etil-1H-pirazol, 3-metil-1H-pirazol, 5-etil-1-metil-1H-pirazol, 4-etil-1-metil-1H-pirazol, 3-etil-1-metil-1H-pirazol, 5-metil-1H-imidazol, 4-etil-1H-imidazol, 2-metil-1H-imidazol, 5-etil-1-metil-1H-imidazol, 2-etil-1-metil-1H-imidazol, 1,4-dimetil-1H-imidazol, 2-metil-4,5-dihidro-oxazol, 2-etil-4,5-dihidro-tiazol, 2-etil-4,5-dihidro-1H-imidazol, 2-etil-1-metil-4,5-dihidro-1H-imidazol,

20  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno.

Los ejemplos de compuestos de esta realización particularmente preferida son los compuestos dados en las Tabla 1 a 50 siguientes.

25 Tabla 1: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$ ,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.a1 a A1.a81.

Tabla 2: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$  es metilo,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.a1 a A1.a81.

Tabla 3: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$ ,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.b1 a A1.b81.

30 Tabla 4: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$  es metilo,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.b1 a A1.b81.

Tabla 5: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$ ,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.c1 a A1.c81.

35 Tabla 6: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$  es metilo,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.c1 a A1.c81.

Tabla 7: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$ ,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.d1 a A1.d81.

Tabla 8: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$  es metilo,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.d1 a A1.d81.

40 Tabla 9: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$ ,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.e1 a A1.e81.

Tabla 10: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que  $R^1$  es metilo,  $R^t$ ,  $R^u$ , y  $R^w$  son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.e1 a A1.e81.



Tabla 34: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.r1 a A1.r81.

Tabla 35: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.s1 a A1.s81.

5 Tabla 36: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.s1 a A1.s81.

Tabla 37: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.t1 a A1.t81.

10 Tabla 38: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.t1 a A1.t81.

Tabla 39: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.u1 a A1.u81.

Tabla 40: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.u1 a A1.u81.

15 Tabla 41: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.v1 a A1.v81.

Tabla 42: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.v1 a A1.v81.

20 Tabla 43: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.w1 a A1.w81.

Tabla 44: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.w1 a A1.w81.

Tabla 45: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.x1 a A1.x81.

25 Tabla 46: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.x1 a A1.x81.

Tabla 47: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.y1 a A1.y81.

30 Tabla 48: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.y1 a A1.y81.

Tabla 49: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.z1 a A1.z81.

Tabla 50: Compuestos de la fórmula l'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en los que R<sup>1</sup> es metilo, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno y en los que A está seleccionada entre los radicales A1.z1 a A1.z81.

35 Los ejemplos adicionales de esta realización particularmente preferida son los compuestos en analogía a los compuestos listados en la Tabla 1 a 50, en los que R<sup>1</sup> es un radical representado por cada línea individual (85 a 160) de la Tabla B siguiente:

Tabla B

Línea	Radical R <sup>1</sup>	Línea	Radical R <sup>1</sup>
85	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	90	terc-butilo
86	Propilo	91	CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
87	iso-propilo	92	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
88	Butilo	93	CH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>
89	iso-butilo	94	CH <sub>2</sub> CH=CBr <sub>2</sub>

Tabla B (Cont.)

Línea	Radical R <sup>1</sup>	Línea	Radical R <sup>1</sup>
95	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	128	2-furilmetilo
96	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	129	3-furfurilmetilo
97	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Br	130	2-tienilmetilo
98	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	131	3-tienilmetilo
99	CH <sub>2</sub> CHCl <sub>2</sub>	132	isotiazol-3-ilmetilo
100	CH <sub>2</sub> CHBr <sub>2</sub>	133	isotiazol-4-ilmetilo
101	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	134	isotiazol-5-ilmetilo
102	CH <sub>2</sub> CN	135	isoxazol-3-ilmetilo
103	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	136	oxazol-2-ilmetilo
104	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	137	oxazol-5-ilmetilo
105	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	138	oxazol-4-ilmetilo
106	CH(Me)CH <sub>2</sub> CN	139	tiazol-2-ilmetilo
107	2-metoxietilo	140	tiazol-4-ilmetilo
108	2-etoxietilo	141	tiazol-5-ilmetilo
109	Ciclopropilmetilo	142	1H-pirazol-3-ilmetilo
110	Ciclobutilmetilo	143	1H-pirazol-4-ilmetilo
111	Ciclopentilmetilo	144	2H-pirazol-3-ilmetilo
112	oxetan-2-ilmetilo	145	1-metil-1H-pirazol-3-ilmetilo
113	oxetan-3-ilmetilo	146	1-metil-1H-pirazol-4-ilmetilo
114	oxolan-2-ilmetilo	147	2-metil-2H-pirazol-3-ilmetilo
115	oxolan-3-ilmetilo	148	1H-imidazol-2-ilmetilo
116	tietan-3-ilmetilo	149	1H-imidazol-4-ilmetilo
117	1,1-dioxatietan-3-ilmetilo	150	1H-imidazol-5-ilmetilo
118	Ciclopropilo	151	1-metil-1H-imidazol-2-ilmetilo
119	Ciclobutilo	152	1-metil-1H-imidazol-4-ilmetilo
120	Ciclopentilo	153	1-metil-1H-imidazol-5-ilmetilo
121	oxetan-2-ilo	154	oxozolin-2-ilmetilo
122	oxetan-3-ilo	155	tiazolin-2-ilmetilo
123	oxolan-2-ilo	156	1H-imidazolin-2-ilmetilo
124	oxolan-3-ilo	157	1-metil-1H-imidazolin-2-ilmetilo
125	tietan-3-ilo	158	1-fenilpirazol-4-ilmetilo
126	1,1-dioxatietan-3-ilo	159	5-metilfuran-2-ilmetilo
127	Bencilo	160	5,5-dimetiltetrahidrofuran-2-ilmetilo

Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.A y a las sales y N-óxidos de los mismos, en los que

5 A es un radical A1, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A1, en el que R<sup>41</sup>, R<sup>51</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isotiazol de las fórmulas A1.a' a A1.z', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isotiazol A1.a'1 a A1.z'81;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

10 R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno.

Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.A y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

15 A es un radical A2, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A2, en el que R<sup>42</sup>, R<sup>52</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isoxazol de las fórmulas A2.aa a A2.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isoxazol A2.aa1 – A2.aa81 a A2.do1 a A2.do81;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

20 R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente dos o tres, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno.

25 Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.A y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

A es un radical A2, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A2, en el que R<sup>42</sup>, R<sup>52</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isotiazol de las fórmulas A2.aa' a A2.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isotiazol A2.aa'1 – A2.aa'81 a A2.do'1 a A2.do'81;

30 R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

35 R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente dos o tres, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno.

Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.A y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

40 A es un radical A3, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A3, en el que R<sup>43</sup>, R<sup>53</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isoxazol de las fórmulas A3.aa a A3.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isoxazol A3.aa1 - A3.aa81 a A3.do1 – A3.do81;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

45 R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno.

50 Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.A y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

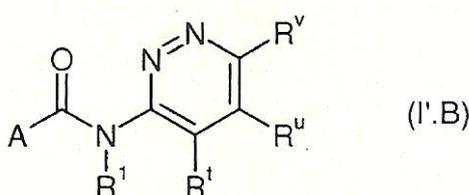
A es un radical A3, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A3, en el que R<sup>43</sup>, R<sup>53</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isotiazol de las fórmulas A3.aa' a A3.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isotiazol A3.aa'1 - A3.aa'81 a A3.do'1 - A3.do'81;

5 R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

10 R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>w</sup> son hidrógeno.

Otra realización particularmente preferida se refiere a compuestos de la fórmula I'.B y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que



15 A es un radical A1, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A1, en el que R<sup>41</sup>, R<sup>51</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isoxazol de las fórmulas A1.a a A1.z, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isoxazol A1.a1 a A1.z81;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

20 R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> son hidrógeno.

25 Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.B y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

A es un radical A1, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A1, en el que R<sup>41</sup>, R<sup>51</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isotiazol de las fórmulas A1.a' a A1.z', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isotiazol A1.a'1 a A1.z'81;

30 R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

35 R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> son hidrógeno.

Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.B y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

40 A es un radical A2, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A2, en el que R<sup>42</sup>, R<sup>52</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isoxazol de las fórmulas A2.aa a A2.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isoxazol A2.aa1 - A2.aa81 a A2.ha1 - A2.ha81;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

5 R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente dos o tres, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> son hidrógeno.

Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.B y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

10 A es un radical A2, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A2, en el que R<sup>42</sup>, R<sup>52</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isotiazol de las fórmulas A2.aa' a A2.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isotiazol A2.aa'1 - A2.aa'81 a A2.ha'1 - A2.ha'81;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

15 R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente dos o tres, de los radicales R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, y R<sup>v</sup> son hidrógeno.

Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.B y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

20 A es un radical A3, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A3, en el que R<sup>43</sup>, R<sup>53</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isoxazol de las fórmulas A3.aa a A3.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isoxazol o isotiazol A3.aa1 - A3.aa81 a A3.do1 - A3.do81;

25 R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

30 R<sup>u</sup>, R<sup>v</sup>, y R<sup>t</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales R<sup>u</sup>, R<sup>v</sup>, y R<sup>t</sup> son hidrógeno.

Otra realización preferida particular se refiere a compuestos de la fórmula I'.B y a sales y N-óxidos de los mismos, en los que

35 A es un radical A3, tal como se define en la presente invención, en particular un radical A3, en el que R<sup>43</sup>, R<sup>53</sup> tienen los significados preferidos, en particular un radical isotiazol de las fórmulas A3.aa' a A3.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales isotiazol A3.aa'1 - A3.aa'81 a A3.do'1 - A3.do'81;

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

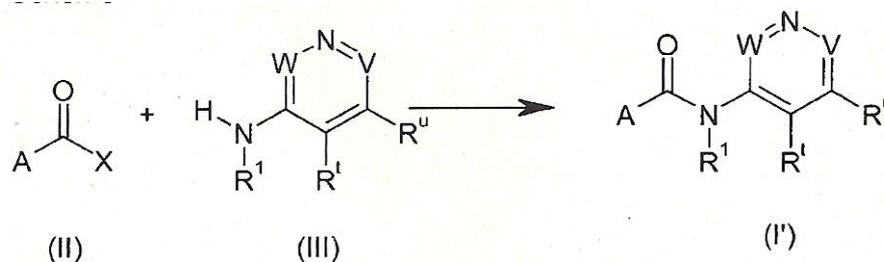
R<sup>1</sup> está además lo más preferiblemente representado por un radical tal como se define en cada línea de la Tabla B;

40 R<sup>u</sup>, R<sup>v</sup>, y R<sup>t</sup> están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en los que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 ó 3, de los radicales R<sup>u</sup>, R<sup>v</sup>, y R<sup>t</sup> son hidrógeno.

45 Los compuestos de la fórmula I, en los que X<sup>1</sup> es O o S (compuestos I'), pueden prepararse, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento representado en el Esquema 1, mediante la reacción de un derivado de ácido isoxazol o isotiazol carboxílico activado II con un compuesto 3- o 4-aminopiridacino, compuesto III (véase, por ejemplo, Houben-Weyl: Methoden der Organische Chemie, vol. E5, págs. 941-1045, (1985), Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York). Los derivados II de ácido isoxazol o isotiazol carboxílico activados son, por ejemplo, haluros de acilo, ésteres activados, anhídridos, azidas de acilo, en los que X es, por ejemplo, cloruro, bromuro, para-nitrofenoxi, pentafluorofenoxi, N-hidroxisuccinimidas, hidroxibenzotriazol-1-ilo. En el Esquema 1, los radicales A, R<sup>1</sup>, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, V y W tienen los significados mencionados anteriormente y, en particular, siendo preferidos los significados mencionados.

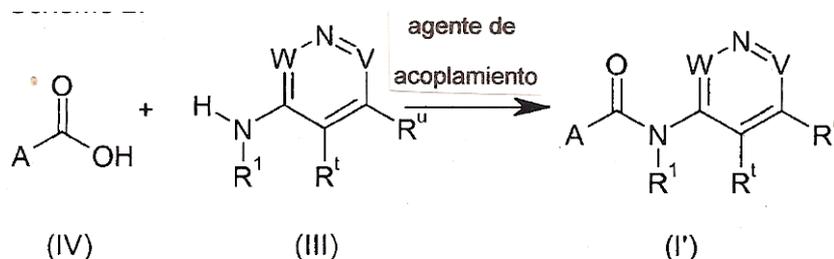
50

Esquema 1:



5 Los compuestos de la fórmula I, en los que X<sup>1</sup> es O o S (compuestos I'), pueden igualmente prepararse, por ejemplo, mediante la reacción del ácido isoxazol o isotiazol carboxílico IV y el compuesto 3- ó 4-aminopiridacino III, en la presencia de un agente de acoplamiento de acuerdo con el Esquema 2. En el Esquema 2, los radicales A, R<sup>t</sup>, R<sup>u</sup>, V y W tienen los significados mencionados anteriormente y, en particular, siendo preferidos los significados mencionados.

Esquema 2:



10 Los agentes de acoplamiento adecuados son, por ejemplo:

. agentes de acoplamiento a base de carbodiimidas, por ejemplo N,N'-diciclohexilcarbodiimida [J.C. Sheehan, G.P. Hess, *J. Am. Chem. Soc.*, vol. 77, pág. 1067, (1955)], N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida;

15 . agentes de acoplamiento que forman anhídridos mezclados con ésteres carbónicos, por ejemplo 2-etoxi-1-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinoleína [B. Belleau, G. Malek, *J. Amer. Chem. Soc.*, vol. 90, pág. 1651, (1968)], 2-isobutiloxi-1-isobutiloxycarbonil-1,2-dihidroquinoleína [Y. Kiso, H. Yajima, *J. Chem. Soc. Chem. Commun.*, pág. 942, (1972)];

20 . agentes de acoplamiento a base de sales de fosfonio, por ejemplo hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio [B. Castro, J.R. Domoy, G. Evin, C. Selve, *Tetrahedron Lett.*, vol. 14, pág. 1219, (1975)], hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tripirrolidinofosfonio [J. Coste y otros, *Tetrahedron Lett.*, vol. 31, pág. 205, (1990)];

25 . agentes de acoplamiento a base de sales de uronio o que tienen una estructura de N-óxido guanidinio, por ejemplo hexafluorofosfato de N,N,N',N'-tetrametil-O-(1H-benzotriazol-1-il)uronio [R. Knorr, A. Trzeciak, W. Bannwarth, D. Gillesen, *Tetrahedron Lett.*, vol. 30, pág. 1927, (1989)], tetrafluoroborato de N,N,N',N'-tetrametil-O-(1H-benzotriazol-1-il)uronio, hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-il)dipiperidinocarbenio [S. Chen, J. Xu, *Tetrahedron Lett.*, vol. 33, pág. 647, (1992)];

. agentes de coplamiento que forman cloruros, por ejemplo cloruro bis-(2-oxo-oxazolidinil)fosfínico [J. Diago-Mesequer, *Synthesis*, pág. 547, (1980)].

30 Los compuestos de la fórmula I, en los que X<sup>1</sup> es O (compuestos I') y R<sup>1</sup> es diferente de hidrógeno, pueden igualmente prepararse mediante la alquilación de las amidas I (en las cuales R<sup>1</sup> es hidrógeno y que pueden obtenerse de acuerdo con el Esquema 1 ó 2) usando agentes de alquilación adecuados en la presencia de bases.

Esquema 3:



Los ácidos isoxazol o isotiazol carboxílicos IV y sus derivados activados II, así como los compuestos 3- ó 4-aminopiridacino III, son conocidos en la técnica o se encuentran comercialmente disponibles o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos en la literatura.

Los compuestos de la fórmula I, en los que  $X^1$  es diferente de oxígeno, pueden prepararse a partir de los compuestos de la fórmula I' mediante procedimientos convencionales:

Los compuestos de la fórmula I, en los que  $X^1$  es S, pueden prepararse, por ejemplo, mediante la reacción de un compuesto de fórmula I' con 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro o pentasulfuro de fósforo, de acuerdo con el procedimiento descritos por M. Jesberger y otros, en *Synthesis*, pág. 1929, (2003).

Los compuestos de la fórmula I, en los que  $X^1$  es  $NR^{1a}$ , pueden prepararse, por ejemplo, mediante la reacción de un compuesto I' con 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro para obtener la tioamida correspondiente (compuesto I, en el que  $X^1$  es S), la cual, a continuación, reacciona con una amina apropiada de acuerdo con el procedimiento descrito por V. Glushkov y otros, en *Pharmaceutical Chemistry Journal*, vol. 39, (nº. 10), págs. 533-536, (2005).

Los compuestos de la fórmula II, en los que  $X^2 = SR^{2a}$ , pueden prepararse mediante la alquilación de la tioamida correspondiente (compuesto I, en el que  $X^1$  es S) mediante reacción con un agente de alquilación de acuerdo con el procedimiento descrito por V. Gluskov y otros, en *Pharmaceutical Chemistry Journal*, vol. 39, (nº. 10), págs. 533-536, (2005). De una manera similar, pueden obtenerse los compuestos I, en los que  $X^2 = SOR^{2a}$  o  $SO_2R^{2a}$  mediante la oxidación de los compuestos II con  $X^2 = SR^{2a}$ .

Los N-óxidos de los compuestos de las fórmulas I y II pueden prepararse mediante la oxidación de los compuestos I, de acuerdo con procedimientos convencionales de preparación de N-óxidos heteroaromáticos, por ejemplo, mediante el procedimiento descrito por C. Botteghi y otros, en *Journal of Organometallic Chemistry*, vol. 370, págs. 17-31, (1989).

Como regla, los compuestos de las fórmulas I y II pueden prepararse mediante los procedimientos descritos anteriormente. Si un compuesto individual no puede prepararse mediante las vías anteriormente descritas, estos pueden prepararse derivando otros compuestos I o II o mediante modificaciones usuales de las vías de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos I o II pueden prepararse de manera ventajosa a partir de otros compuestos I o II mediante hidrólisis del éster, amidación, esterificación, escisión con éter, olefinación, reducción, oxidación y similares.

Las mezclas de reacción se preparan de una manera usual, por ejemplo, mediante mezclado con agua, separación de las fases, y, en casos apropiados, purificación de los productos brutos mediante cromatografía, por ejemplo, sobre alúmina o sobre gel de sílice. Algunos de los compuestos intermedios y productos finales pueden obtenerse en la forma de aceites viscosos incoloros o de color pardo claro, los cuales son liberados o purificados de los componentes volátiles bajo presión reducida y a temperatura relativamente elevada. Si los compuestos intermedios y productos finales se obtienen en la forma de sólidos, estos pueden purificarse mediante recristalización o trituración.

Debido a su excelente actividad, los compuestos de las fórmulas generales I o II pueden usarse para el control de plagas de invertebrados.

De acuerdo con ello, la presente invención proporciona igualmente un procedimiento para el control de plagas de invertebrados, cuyo procedimiento comprende el tratamiento de las plagas, su suministro alimentario, su hábitat o su terreno de reproducción o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tales como semillas), suelo, área, material o medioambiente en el cual las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación de plantas (tal como semillas), superficies o espacios a proteger del ataque o infestación de la plaga con una cantidad eficaz pesticidamente de un compuesto de las fórmulas (I) o (II) o una sal o N-óxido de los mismos o una composición tal como se ha definido anteriormente.

Preferiblemente, el procedimiento de la invención sirve para la protección del material de protección de plantas (tal como semillas) y la planta que crece a partir del mismo del ataque o infestación de plagas de invertebrados y com-

prende el tratamiento del material de propagación de plantas (tal como semillas) con una cantidad eficaz pesticidamente de un compuesto de las fórmulas (I) o (II) o una sal o N-óxido aceptable agrícolamente tal como se ha definido anteriormente o con una cantidad eficaz pesticidamente de una composición agrícola tal como se ha definido anteriormente y más adelante. El procedimiento de la invención no está limitado a la protección del "substrato" (planta, materiales de propagación de plantas, material del suelo, etc.) que ha sido tratado de acuerdo con la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, así, por ejemplo, de acuerdo con la protección a una planta que crece a partir de unos materiales de propagación de plantas tratados (tal como semillas), de la propia planta que no ha sido tratada.

En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" están seleccionadas preferiblemente entre artrópodos y nematodos, más preferiblemente entre insectos, arácnidos y nematodos perjudiciales, e incluso más preferiblemente entre insectos, acáridos y nematodos.

La invención proporciona además una composición agrícola para combatir dichas plagas de invertebrados, la cual comprende dicha cantidad tal de al menos un compuesto de las fórmulas generales I o II o al menos una sal o N-óxido útil agrícolamente del mismo y al menos un vehículo aceptable agrícolamente líquido y/o sólido inerte que tiene una acción pesticida y, si se desea, al menos un tensioactivo.

Dicha composición puede contener un único compuesto activo de las fórmulas I o II o una sal o N-óxido del mismo, o una mezcla de diversos compuestos activos I o II o sus sales de acuerdo con la presente invención. La composición de acuerdo con la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

Los compuestos de las fórmulas I o II y las composiciones pesticidas que los comprenden, son agentes eficaces para el control de plagas de artrópodos y nematodos. Las plagas de invertebrados controladas por los compuestos de las fórmulas I o II incluyen, por ejemplo

insectos del orden de los lepidópteros (Lepidópteros), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Chosistoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armígera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege stictalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pesudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phaleria bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotoga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* y *Zeiraphera canadiensis*;

escarabajos (Coleópteros), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agrilus lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hyllobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarse decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissohoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga spp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*;

dipteranos (Dípteros), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemya platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifoli*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucila sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* y *Tipula paludosa*;

trips (Tisanópteros), por ejemplo *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*;

himenópteros (Himenópteros), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudínea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* y *Solenopsis invicta*;

5 heterópteros (Heterópteros), por ejemplo *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* y *Thyanta perditor*;

10 homópteros (Homópteros), por ejemplo *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambici*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolia*, *Bemisia tabaco*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefoli*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaguinea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyrarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humili*, *Psylla mali*, *Psilla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sapphis mala*, *Sapphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schinoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera auriantii* y *Viteus vitifoli*;

15 termitas (Isópteros) , por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipens*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* y *Termes natalensis*;

25 ortópteros (Ortópteros), por ejemplo *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blatella germanica*, *Folicula auricularia*, *Gryllotalpa grillotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* y *Tachycines asynamorus*;

30 aracnoideos, tales como arácnidos (Acaros), por ejemplo de las familias Argásidos, Ixódidos y Sarcoptidos, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y *Eriophyidae* spp, tales como *Aculus Schleichendali*, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp. tal como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. tal como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. tal como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawui*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, y *Oligonychus pratensis*;

35 sifonápteros, por ejemplo *Xenopsylla cheopsis*, *Cerotophyllus* spp.

Las composiciones y compuestos de las fórmulas I o II son útiles para el control de nematodos, especialmente nematodos parasitarios de plantas tales como nematodos de las raíces, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, y otras especies *Meloidogyne*;

40 nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies *Glododera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies *Heterodera*; nematodos de agallas de semillas, especies *Anguina*; nematodos del tallo y hojas, especies *Aphelenchoides*; nematodos de aguijón, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies *Bursaphelenchus*; nematodos de anillo, especies *Criconema*, especies *Criconemella*, especies *Criconemoides*, especies *Mesocriconema*; nematodos del tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies *Ditylenchus*; nematodos punzón, especies *Dolichodorus*; nematodos en espiral, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies *Helycotinenchus*; nematodos de vaina y envainados, especies *Hemicycliophora* y especies *Hemicriconemoides*; especies *Hirsmanniella*; nematodos lanza, especies *Hoplaimus*; nematodos de falsa raíz, especies *Nacobus*; nematodos de aguja, *Longidorus elanogatus* y otras especies *Longidorus*; nematodos del pino, especies *Paratylenchus*; nematodos lesión, *Pratilenchus neglectus*, *Pratilenchus penetrans*, *Pratilenchus curvatus*, *Pratilenchus goodeyi* y otras especies *Pratilenchus*; nematodos barrenadores, *Radopholus similis* y otras especies *Radopholus*; nematodos reniforme, *Rotylenchus robustus* y otras especies *Rotylenchus*; especies *Scutellonema*; nematodos de formadores de raíces, *Trichodorus primitivus* y otras especies *Trichodorus*, especies *Paratrachodorus*; nematodos achaparrados, *Tylenchorhynchus Clayton*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies *Tylenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies *Tylenchulus*; nematodos daga, especies *Xiphinema*; y otras especies de nematodos parásitos de plantas.

55

En una realización preferida de la invención, los compuestos de las fórmulas I o II se usan para el control de insectos o arácnidos, en particular insectos de los órdenes Lepidópteros, Coleópteros, Tisanópteros y Homópteros y arácnidos del orden Acaros. Los compuestos de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención son particularmente útiles para el control de insectos del orden Tisanópteros y Homópteros.

- 5 Los compuestos de las fórmula I o II o las composiciones pesticidas que los comprenden, pueden usarse para proteger el crecimiento de plantas y cultivos del ataque o infestación por plagas de invertebrados, especialmente insectos, ácaros o arácnidos, mediante el contacto de la planta/cultivo con una cantidad eficaz pesticidamente de compuestos de las fórmulas I o II. El término "cultivo" se refiere tanto a cultivos en crecimiento como recolectados.

- 10 Los compuestos de las fórmulas I o II pueden convertirse en las formulaciones usuales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas y gránulos. La forma de uso depende del fin particular deseado; en cada caso, debe asegurarse una distribución fina y uniforme del compuesto de acuerdo con la invención.

- 15 Las formulaciones se preparan de una manera conocida (véanse, por ejemplo, para revisión la Patente de EE.UU. 3.060.084, el Documento EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, págs. 147-48, (1967), Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, págs. 8-57 y siguientes, (1963), Documento WO 91/13546, Patentes de EE.UU. 4.172.714, 4.144.050, 3.920.442, 5.180.587, 5.232.701, 5.208.030, GB 2.095.558, Patente de EE.UU. 3.299.566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, (1961), Hance y otros, Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, (1989), y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), (2001), 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, (1988)(ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo, extendiendo el compuesto activo con compuestos auxiliares adecuados para la formulación de productos agroquímicos, tales como disolventes y/o vehículos, y si se desean, emulsificadores, tensioactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespumación, agentes anticongelación, para formulaciones para el tratamiento de semillas también opcionalmente colorantes y/o agentes aglomerantes y/o agentes gelificantes.

- 25 Los ejemplos de disolventes adecuados son agua, disolventes aromáticos (por ejemplo, productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (N-metilpirrolidona [NMP], N-octilpirrolidona [NOP]), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, dimetilamidas de ácido graso, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos. En principio, pueden usarse igualmente mezclas de disolventes.

- 30 Los emulsificadores adecuados son emulsificadores no iónicos y aniónicos (por ejemplo éteres de alcoholes polioxietileno grasos, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Los ejemplos de dispersantes son licores residuales de lignino-sulfito y metilcelulosa.

- 35 Los tensioactivos adecuados usados son sales de metal alcalino, metal alcalinotérreo y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquil sulfatos, alquil sulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y éteres glicol de alcoholes grasos sulfatados, además de condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietileno octilfenol éter, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenol poliglicol éteres, tributilfenil poliglicol éter, triestearilfenil poliglicol éter, alquilaril poliéter alcoholes, alcohol y condensados de óxido de etileno-alcohol graso, aceite de ricino etoxilado, polioxietileno alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico poliglicol éter acetal, ésteres de sorbitol, licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa.

- 40 Las sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones directamente pulverizables, emulsiones, pastas o dispersiones en aceite son fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tal como aceite de keroseno o diesel, además de aceites de alquitrán de carbón y aceites de origen vegetal y animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes altamente polares, por ejemplo dimetil sulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.

Igualmente, pueden agregarse a la formulación agentes anticongelantes tales como glicerina, etileno glicol, propileno glicol y bactericidas.

- 50 Los agentes antiespumantes adecuados son, por ejemplo, agentes antiespumantes a base de silicio o estearato magnésico.

Un agente conservante adecuado es, por ejemplo, diclorofeno.

Las formulaciones para el tratamiento de semillas pueden comprender adicionalmente aglomerantes y opcionalmente colorantes.

5 Los aglomerantes pueden agregarse para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Los aglomerantes adecuados son copolímeros de bloque, tensioactivos EO/PO, pero también alcoholes de polivinilo, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, poliestirenoaminas, polietilenoamidas, polietilenoiminas (Lupasol<sup>®</sup>, Polymin<sup>®</sup>), poliéteres, poliuretanos, acetato de polivinilo, tilosa y copolímeros obtenidos a partir de estos polímeros.

10 Opcionalmente, pueden incluirse igualmente colorantes en la formulación. Los colorantes o tintes adecuados para el tratamiento de formulaciones de semillas son Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112, C.I. Solvent Red 1, pigment blue 15:4, pigment blue 15:3, pigment blue 15:2, pigment blue 15:1, pigment blue 80, pigment yellow 1, pigment yellow 13, pigment red 112, pigment red 48:2, pigment red 48:1, pigment red 57:1, pigment red 53:1, pigment orange 43, pigment orange 34, pigment orange 5, pigment green 36, pigment green 7, pigment white 8, pigment brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red 108.

Un ejemplo de un agente gelificante es carrageenano (Satiagel<sup>®</sup>).

15 Los polvos, materiales para pulverización y productos espolvoreables pueden prepararse mezclando o moliendo conjuntamente las substancias activas con un vehículo sólido.

Los gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, pueden prepararse mezclando los compuestos activos con vehículos sólidos.

20 Los ejemplos de vehículos sólidos son tierras minerales tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, piedra caliza, cal, yeso, bole, loes, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato cálcico, sulfato magnésico, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato amónico, fosfato amónico, nitrato amónico, ureas, y productos de origen vegetal, tales como harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscarade nuez, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.

25 En general, las formulaciones comprenden desde 0,01 hasta 95% en peso, preferiblemente desde 0,1 hasta 90% en peso, del compuesto(s) activo. En este caso, el compuesto(s) activo se usa con una pureza de desde 90% hasta 100% en peso, preferiblemente 95% a 100% en peso (de acuerdo con el espectro de RMN).

Para fines de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas pueden diluirse 2 a 10 veces dando lugar a concentraciones en la forma de preparaciones listas para su uso de 0,01 a 60% en peso de compuesto activo en peso, preferiblemente 0,1 a 40% en peso.

30 Los compuestos de las fórmulas I o II pueden usarse tal cual, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de los mismos, por ejemplo en la forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, productos espolvoreables, materiales para pulverización, o gránulos, directamente pulverizables, mediante pulverización, atomización, espolvoreado, dispersión o vertido. Las formas de uso dependen totalmente de los fines deseados, estando estos destinados a asegurar en cada caso la distribución la más fina posible del compuesto(s) activo de acuerdo con la invención.

35 Las formas de uso acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos humectables (polvos, dispersiones en aceite pulverizables) mediante la adición de agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, como tales o disueltas en un aceite o disolvente, pueden homogeneizarse en agua mediante un agente humectante, pegajosificante, dispersante o emulsificador. No obstante, es igualmente posible preparar concentrados compuestos de substancia activa, agente humectante, pegajosificante, dispersante o emulsificador y, cuando sea apropiado, disolvente o aceite, y dichos concentrados son adecuados para dilución con agua.

40 Las concentraciones de compuesto activo en las preparaciones lista para usar pueden variar dentro de intervalos relativamente amplios. En general, estas son desde 0,0001 hasta 10%, preferiblemente desde 0,01 hasta 1% en peso.

45 El compuesto(s) activo puede usarse igualmente con éxito en el procedimiento de ultrabajo volumen (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden por encima del 95% en peso de compuesto activo, o incluso aplicar el compuesto activo sin aditivos.

Lo que sigue a continuación son ejemplos de formulaciones:

1. Productos para dilución con agua para aplicaciones foliares. Para fines de tratamiento de semillas, dichos productos pueden aplicarse a las semillas diluidos o no diluidos.

50 A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

Se disuelven 10 partes en peso del compuesto(s) activo en 90 partes en peso de agua o un disolvente soluble en agua. Como una alternativa, se agregan agentes humectantes u otros productos auxiliares. El compuesto(s) activo se disuelve tras dilución con agua, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 10% (p/p) de compuesto(s) activo.

B) Concentrados dispersables (DC)

5 Se disuelven 20 partes en peso del compuesto(s) activo en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua proporciona una dispersión, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 20% (p/p) de compuesto(s) activo.

C) Concentrados emulsificables (EC)

10 Se disuelven 15 partes en peso del compuesto(s) activo en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecilmencenosulfonato cálcico y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5 partes en peso). La dilución con agua proporciona una emulsión, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 15% (p/p) de compuesto(s) activo.

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

15 Se disuelven 25 partes en peso del compuesto(s) activo en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecilmencenosulfonato cálcico y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 35 partes en peso de agua mediante una máquina emulsificadora (por ejemplo, Ultrarax) y se transforma en una emulsión homogénea. La dilución con agua proporciona una emulsión, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 25% (p/p) de compuesto(s) activo.

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

20 En un molino de bolas en agitación, se pulverizan 20 partes en peso del compuesto(s) activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, agentes humectantes y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico, obteniéndose una suspensión fina de compuesto(s) activo. La dilución con agua proporciona una suspensión estable del compuesto(s) activo, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 20% (p/p) de compuesto(s) activo.

F) Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

25 Se muelen finamente 50 partes en peso del compuesto(s) activo con adición de 50 partes en peso de dispersantes y agentes humectantes y se forman gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua mediante instrumentos técnicos (por ejemplo extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable del compuesto(s) activo, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 50% (p/p) de compuesto(s) activo.

30 G) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, SS, WS)

Se muelen finamente 75 partes en peso del compuesto(s) activo en un molino de rotor-estator con adición de 25 partes en peso de dispersantes, agentes humectantes y gel de sílice. La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable del compuesto(s) activo, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 75% (p/p) de compuesto(s) activo.

35 H) Formulación de gel (GF)

40 En un molino de bolas en agitación, se pulverizan 20 partes en peso del compuesto(s) activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de un agente gelificante, agentes humectantes y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico, obteniéndose una suspensión fina de compuesto(s) activo. La dilución con agua proporciona una suspensión estable del compuesto(s) activo, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 20% (p/p) de compuesto(s) activo.

2. Productos a aplicar no diluidos para aplicaciones foliares. Para fines de tratamiento de semillas, dichos productos pueden aplicarse a las semillas diluidos o no diluidos.

I) Polvos espolvoreables (DP, DS)

45 Se muelen finamente 5 partes en peso del compuesto(s) activo y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto proporciona un producto espolvoreable que tiene 5% (p/p) de compuesto(s) activo.

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

50 Se muelen finamente 0,5 partes en peso del compuesto(s) activo y se asocian con 95,5 partes en peso de vehículos, obteniéndose, de esta forma, una formulación con 0,5% (p/p) de compuesto(s)

activo. Los procedimientos usuales son extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado. Esto proporciona gránulos para aplicar no diluidos para uso foliar.

K) Soluciones ULV (UL)

5 Se disuelven 10 partes en peso del compuesto(s) activo en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto proporciona un producto que tiene 10% (p/p) de compuesto(s) activo, el cual se aplica no diluido para uso foliar.

10 Los compuestos de las fórmulas I o II son igualmente adecuados para el tratamiento de materiales de propagación de plantas (tales como semillas). Las formulaciones para el tratamiento de semillas convencionales incluyen, por ejemplo, concentrados fluidibles FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DB, polvos dispersables en agua para tratamiento pastoso WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación de gel GF. Estas formulaciones pueden aplicarse a las semillas diluidas o no diluidas. La aplicación a las semillas se lleva cabo antes de la siembra, bien directamente sobre las semillas o bien después de haber pre-germinado estas últimas.

15 En una realización preferida, se usa una formulación FS para el tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación FS puede comprender 1 a 800 g/l de ingrediente activo, 1 a 200 g/l de tensioactivo, 0 a 200 g/l de agente anti-congelante, 0 a 400 g/l de aglomerante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un disolvente, preferiblemente agua.

20 Otras formulaciones FS preferidas de compuestos de las fórmulas I o II para el tratamiento de semillas comprenden 0,5 a 80% en peso del ingrediente activo, desde 0,05 hasta 5% en peso de un agente humectante, desde 0,5 hasta 15% en peso de un agente dispersante, desde 0,1 hasta 5% en peso de un espesante, desde 5 hasta 20% en peso de un agente anticongelante, desde 0,1 hasta 2% en peso de un agente anti-espuma, desde 1 hasta 20% en peso de un pigmento y/o un colorante, desde 0 hasta 15% en peso de un espesante/agente de adhesión, desde 0 hasta 75% en peso de una carga/vehículo, y desde 0,01 hasta 1% en peso de un conservante.

25 Diversos tipos de aceites, agentes humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas, o bactericidas pueden agregarse a los ingredientes activos, en caso de ser apropiado, justo inmediatamente antes de su uso (mezcla en tanque). Usualmente, estos agentes se mezclan con los agentes de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:40 a 10:1.

Los compuestos de las fórmula I o II son eficaces tanto a través del contacto (vía suelo, cristal, pared, mosquitero, alfombra, partes de plantas o partes animales), como por ingestión (cebo, o parte de la planta).

30 Para uso frente a hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, o cucarachas, los compuestos de las fórmulas I o II se usan preferiblemente en una composición de cebo.

35 El cebo puede ser un sólido, un líquido o una preparación semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos pueden conformarse en diversas formas adecuadas a la aplicación respectiva, por ejemplo, gránulos, bloques, bastones, discos. Los cebos líquidos pueden usarse para rellenar diversos dispositivos para asegurar la apropiada aplicación, por ejemplo, envases abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de goteo, o fuentes de evaporación. Los geles pueden estar basados en matrices acuosas o aceitosas y pueden formularse de acuerdo a necesidades particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

40 El cebo usado en la composición es un producto, que es lo suficientemente atractivo como para incitar a insectos tales como hormigas, termitas, abejas, moscas, mosquitos, grillos, etc., o cucarachas a comerlo. El grado de atracción puede manipularse mediante el uso de estimulantes de la alimentación o feromonas del sexo. Los estimulantes de la alimentación están elegidos, por ejemplo, pero no exclusivamente, entre proteínas animales y/o de plantas (harina de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), entre grasas y aceites de origen animal y/o de plantas, o mono-, oligo- o poli-organosacáridos, especialmente entre sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melazas o miel. Las partes frescas o en descomposición de frutos, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos pueden servir igualmente como un estimulante de la alimentación. Las feromonas del sexo son conocidas por ser más específicas de insectos. Las feromonas específicas están descritas en la literatura y son conocidas para los expertos en la técnica.

50 Las formulaciones de compuestos de las fórmulas I o II como aerosoles (por ejemplo, en envases de espray), esprays de aceite o esprays de bomba son altamente adecuados para el usuario no profesional para el control de plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosoles están preferiblemente compuestas del compuesto activo, disolventes tales como alcoholes de bajo peso molecular (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona), hidrocarburos parafínicos (por ejemplo, kerosenos) que tiene intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetil sulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, además de compuestos auxiliares tales como emulsificadores tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo conteniendo de 3 a 7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfumes tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonilo aromáticos, caso de ser apropiado estabilizadores tales como benzoato sódico, tensioactivos anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, caso de ser

necesario propulsores tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso, o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de espray de aceite difieren de las recetas de aerosoles en que no se usan propulsores.

5 Los compuestos de las fórmulas I o II y sus respectivas composiciones pueden igualmente usarse en mosquiteros y serpentines para fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores de larga duración e igualmente en papeles para polillas, almohadillas para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes de la temperatura.

10 Los procedimientos para el control de enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebra amarilla, filariasis linfática, y leishmaniasis) con compuestos de las fórmulas I o II y sus composiciones respectivas, comprenden igualmente el tratamiento de las superficies de cabañas y casas, pulverización de aire e impregnación de cortinas, tiendas de campaña, prendas de vestir, colchas, trampas para moscas tse-tse o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, tejidos, prendas de punto, prendas no tejidas, material tejido u hojas y material encerado comprenden, preferiblemente, una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglomerante. Los repelentes adecuados son, por ejemplo, N,N-dietil-metato-  
15 toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexa-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, lactona del ácido (2-hidroximetilciclohexil)acético, 2-etil-1,3-hexanodiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no usado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin), un repelente obtenido de, o indético a, extractos de plantas tipo limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-  
20 eucamalol, o extractos de plantas brutas procedentes de plantas tal como *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Cymbopogon martinii*, *Cymbopogon citratus* (lemon grass), *Cymbopogon nardus* (citronella). Los aglomerantes adecuados están seleccionados, por ejemplo, entre polímeros y copolímeros de ésteres de vinilo de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo, y acrilato de metilo, hidrocarburos mono- y di-etilénicamente insaturados, tal como estireno, y dienos alifáticos, tal como butadieno.

25 La impregnación de cortinas y colchas se realiza generalmente sumergiendo el material textil dentro de emulsiones o dispersiones de los compuestos activos de las fórmulas I o II o pulverizándolos sobre los mosquiteros.

Los procedimientos que pueden usarse para el tratamiento de la semilla son, en principio, todo tratamiento adecuado para semillas y, especialmente, las técnicas de abonado de semillas conocidos en la técnica, tales como recubrimiento de semillas (por ejemplo, granulación de semillas), espolvoreado de semillas e inhibición de semillas (por  
30 ejemplo, remojo de semillas). En la presente invención, "tratamiento de semillas" se refiere a todos los procedimientos que ponen en contacto las semillas y los compuestos de las fórmulas I o II entre sí, y "abonado de semillas" a procedimientos de tratamiento de semillas que proporcionan a las semillas una cantidad de los compuestos de las fórmulas I o II, es decir, que generan una semilla que comprende el compuesto de las fórmulas I o II. En principio, el tratamiento puede aplicarse a la semilla en cualquier momento a partir de la recolección de la semilla hasta la siembra de la semilla. La semilla puede tratarse inmediatamente antes, o durante, la plantación de la semilla, por ejemplo, usando el procedimiento del "cajón plantador". No obstante, el tratamiento puede igualmente llevarse a cabo durante varias semanas o meses, por ejemplo, hasta 12 meses, antes de la plantación de la semilla, por ejemplo, en la forma de un tratamiento de abonado de semillas, sin haberse observado una eficacia significativamente reducida.

40 De manera conveniente, el tratamiento se aplica a semillas no sembradas. Tal como se usa en la presente invención, el término "semilla no sembrada" se entiende que incluye semillas en cualquier periodo desde la recolección de la semilla hasta la siembra en el suelo con el fin de germinación y crecimiento de la planta.

Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento, en el cual, la semilla se mezcla, en un dispositivo adecuado, por ejemplo un dispositivo de mezclado para asociaciones de sólidos o sólidos/líquidos, con la cantidad deseada de formulaciones para el tratamiento de semillas, bien como tales o bien después de dilución previa con  
45 agua, hasta que la composición se distribuye uniformemente sobre la semilla. Cuando sea apropiado, esto es seguido por una etapa de secado.

Los compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos, son, en particular, igualmente adecuados para ser usados para combatir parásitos en y sobre animales.

50 Por ello, un objeto adicional de la presente invención es proporcionar el uso de nuevos procedimientos para el control de parásitos en y sobre animales. Otro objeto de la invención es proporcionar pesticidas más seguros para animales. Otro objeto de la invención es proporcionar además pesticidas para animales que puedan usarse en dosis más bajas que las de los pesticidas existentes. Y otro objeto de la invención es proporcionar pesticidas para animales, que proporcionen un control residual duradero de los parásitos.

55 La invención se refiere igualmente a composiciones que contienen una cantidad eficaz parasíticamente de compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y un vehículo aceptable, para combatir parásitos en o sobre animales.

- 5 La presente invención proporciona igualmente compuestos para uso en un procedimiento para tratar, controlar, prevenir y proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos, el cual comprende la administración o aplicación oralmente, tópica o parenteralmente a los animales de una cantidad eficaz parasíticamente de compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y un vehículo aceptable o composición que los comprende.
- 10 La presente invención proporciona igualmente un procedimiento no terapéutico para tratar, controlar, prevenir y proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos, el cual comprende la administración a un locus-P de una cantidad eficaz parasíticamente de compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y un vehículo aceptable o composición que los comprende.
- 15 La invención proporciona igualmente un procedimiento para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos, el cual comprende la inclusión de una cantidad eficaz parasíticamente de compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y una vehículo aceptable o composición que los comprende.
- 20 La invención se refiere además a compuestos de la fórmula I para tratar, controlar, prevenir o proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos. La invención se refiere igualmente al uso de un compuesto de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y un vehículo aceptable o composición que los comprende, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento terapéutico de animales contra infecciones o infestaciones por parásitos.
- 25 La actividad de compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su adecuabilidad para el control de endo- y ectoparásitos en y sobre animales que requieren, por ejemplo, dosificaciones noeméticas, bajas, en el caso de aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad, y una manipulación segura.
- 30 De manera sorprendente, se ha encontrado que los compuestos de las fórmulas I o II son adecuados para combatir endo- y ectoparásitos en y sobre animales.
- 35 Los compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y composiciones que los comprenden, son preferiblemente usados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones de animales, incluyendo animales de sangre caliente (incluyendo seres humanos) y peces. Por ejemplo, son adecuados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado vacuno, ganado ovino, ganado porcino, camellos, venados, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, gamos y renos, y también animales de piel tales como visón, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua salada y corriente tales como truchas, carpas y anguilas.
- 40 Los compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y composiciones que los comprenden, son preferiblemente usados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros y gatos.
- 45 Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen pero sin limitarse a ellos, piojo, piojo mordedor, garrapata, estros nasales, moscas melófagas, moscas mordedoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, ácaros, mosquito hipelate, mosquitos y pulgas.
- 50 Los compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables veterinariamente de los mismos y composiciones que los comprenden, son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto- y/o endoparásitos. Son activos frente a todas o algunas de las fases del desarrollo.
- 55 Los compuestos de las fórmulas I o II son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.
- Los compuestos de las fórmulas I o II son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente.
- 60 pulgas (Sifonápteros), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*.
- 65 cucarachas (Blatarios - Blatoideos), por ejemplo *Blatella germanica*, *Blatella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*;
- 70 moscas, mosquitos (Dípteros), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glos-*

- 5 *sina fuscipes, Glossina tachinoides, Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hippelates spp., Hypoderma lineata, Lectoconops torrens, Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucila sericata, Lycoria pectoralis, Mansonia spp. Musca domestica, Muscina stabulans, Oestrus ovis, Phlebotomus argentipes, Psorophora columbiana, Psorophora discolor, Prosimulium mixtum, Sarcophaga hemorrhoidalis, Sarcophaga sp., Simulium vittatum, Stomoxys calcitrans, Tabanus bovinus, Tabanus atratus, Tabanus lineola, y Tabanus similis,*
- piojos (Ftirápteros), por ejemplo *Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Pthirus pubis, Haematopinus eurysternus, Haematopinus suis, Linognathus vituli, Bovicola bovis, Menopon gallinae, Menochanthus stramineus, y Solenopotes capillatus;*
- 10 garrapatas y ácaros parásitos (Parasitiformes): garrapatas (Ixódidos), por ejemplo *Ixodes scapularis, Ixodes holocyclus, Ixodes pacificus, Rhipicephalus sanguineus, Dermaceptor variabilis, Amblyomma americanum, Amblyomma maculatum, Ornithodoros hermsi, Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (Mesostigmata), por ejemplo, *Omithonyssus bacoti y Dermanyssus gallinae,*
- 15 actinédidos (Prostigmata) y Acarídidos (Astigmata), por ejemplo *Acarapis spp., Cheyletiella spp., Omitocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioples spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., y Laminosioptes spp.,*
- chinchas (Heterópteros): *Cimex lectularius, Cimex hemipterus, Reduvius senilis, Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp. y Arilus critatus,*
- 20 Anoplúridos, por ejemplo *Haematopinus spp., Pediculus spp., Pthirus spp. y Solenopotes spp.,*
- Malófagos (subórdenes Ambliceros e Isnóceros), por ejemplo *Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Trichodectes spp., y Felicola spp.,*
- Lombrices cilíndricas nematodos:
- 25 Gusano de alambre y Triquinosis (Tricosiríngidos), por ejemplo *Trichinellidae (Trichinella spp.), (Trichuridae) Trichuris spp., Capillaria spp,*
- Rabdítidos, por ejemplo *Rhabditis spp., Strongyloides spp., Helicephalobus spp.,*
- 30 Estrongílidos, por ejemplo *Strongylus spp., Ancylostoma spp., Necator americanus, Bunostomum spp. (Gusano gancho), Trichostrongylus spp., Haemonchus contortus, Ostertagia spp., Coperia spp., Nematodirus spp., Dycitocaulus spp., Cyathostoma spp., Oesophagostomum spp., Stephanorus dentatus, Ollulanus spp., Chabertia spp., Stephanorus dentatus, Syngamus trachea, Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Globocephalus spp., Necator spp., Metastrongylus spp., Muellerius capillaris, Protostrongylus spp., Angiostrongylus spp., Parelaphostrongylus spp., Aleurostrongylus abstrusus, y Dioctophyma renale,*
- 35 Lombrices cilíndricas intestinales (Ascáridos), por ejemplo *Ascaris lumbricoides, Ascaris suum, Ascaris galli, Parascaris equorum, Enterobius vermicularis* (Lombriz de los niños), *Toxocara canis, Toxascaris leonine, Skjabinema spp., y Oxyuris equi,*
- Camallánidos, por ejemplo *Dracunculus medinensis* (lombriz de guinea)
- Filáridos, por ejemplo *Thelazia spp., Wuchereria spp., Brugia spp., Onchocerca spp., Dilofilari spp.a, Dipetalonema spp., Setaria spp., Elaeophora spp., Spirocerca lupi, y Habronema spp,*
- 40 Lombrices de cabeza espinosa (Acantocéfalos), por ejemplo *Acanthocephalus spp., Macracanthorhynchus hirudinaceus y Oncicola spp.,*
- Planarianos (Platelmintos):
- 45 Lombrices (Tremátodos), por ejemplo *Faciola spp., Fascioloides magna, Paragonimus spp., Dicrocoelium spp., Fasciolopsis buski, Clonorchis sinensis, Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Alaria alata, Paragonimus spp., y Nanocytes spp.,*
- Cercomeromorfos, en particular Cestodos (Tenias), por ejemplo, *Diphyllobothrium spp., Tenia spp., Echinococcus spp., Dipylidium caninum, Multiceps spp., Hymenolepsis spp., Mesocestoides spp., Vampirolepsis spp., Moniezia spp., Anoplocephala spp., Sirometra spp., Anoplocephala spp. y Hymenolepsis spp.*
- 50 Los compuestos de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes Dípteros, Sifonápteros e Ixódidos.

Más aún, el uso de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen para combatir mosquitos es especialmente preferido.

El uso de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen para combatir moscas es una realización preferida adicional de la presente invención.

- 5 Además, el uso de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen para combatir pulgas es especialmente preferido.

El uso de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen para combatir garrapatas es una realización preferida adicional de la presente invención.

- 10 Los compuestos de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen son también especialmente útiles para combatir endoparásitos (lombrices cilíndricas nematodos, lombrices de cabeza espinosa y planarios).

Los compuestos de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen pueden ser eficaces a través tanto del contacto (vía suelo, cristal, pared, colcha, alfombra, mantas o partes animales) como por ingestión (por ejemplo, cebos).

- 15 La presente invención se refiere al uso terapéutico y no terapéutico de compuestos de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen para controlar y/o combatir parásitos en y/o sobre animales.

- 20 Los compuestos de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen pueden usarse para proteger a los animales del ataque o infestación por parásitos, mediante el contacto de los mismos con una cantidad eficaz parasíticamente de compuestos de las fórmulas I o II y composiciones que los contienen. Como tal, el "contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicación de la mezcla/composiciones pesticidas directamente sobre el parásito, lo cual puede incluir un contacto indirecto en su locus-P, y opcionalmente también la administración de las mezclas/composición pesticidas directamente sobre el animal) como el contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito a través de la aplicación a su locus es un ejemplo de un uso no terapéutico de la fórmula I.

- 25 "Locus-P" tal como se define anteriormente, significa el hábitat, suministro alimenticio, terreno de reproducción, área, material o medioambiente en el cual un parásito está creciendo o puede crecer fuera del animal. Los compuestos de la invención pueden aplicarse igualmente de manera preventiva a los lugares en los cuales es de esperar la presencia de las plagas o parásitos.

La administración puede llevarse a cabo tanto profilácticamente como terapéuticamente.

- 30 La administración de los compuestos activos se lleva a cabo tanto directamente como en la forma de preparaciones adecuadas, oralmente, tópicamente/dérmica o parenteralmente.

- 35 Para administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de las fórmulas I o II pueden formularse como piensos animales, premezclas de piensos animales, concentrados de piensos animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, purgantes, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de las fórmulas I o II pueden administrarse a los animales en su agua de bebida. Para administración oral, la forma de dosificación elegida debería suministrar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día de los compuestos de las fórmulas I o II, preferiblemente 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

- 40 Como alternativa, los compuestos de las fórmulas I o II pueden administrarse a los animales parenteralmente, por ejemplo, mediante inyección intrarumial, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de las fórmulas I o II pueden dispersarse o disolverse en un vehículo aceptable fisiológicamente para inyección subcutánea. Como alternativa, los compuestos de las fórmulas I o II pueden formularse dentro de un implante para administración subcutánea. Además, los compuestos de las fórmulas I o II pueden administrarse transdérmicamente a los animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación elegida debería suministrar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día de los compuestos de las fórmulas I o II.

- 45 Los compuestos de las fórmulas I o II pueden igualmente aplicarse tópicamente a los animales en la forma de inmersiones, espolvoreados, polvos, medallones, esprays, champús, formulaciones para aplicar localmente y en ungüentos o en emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, las inmersiones y esprays usualmente contienen 0,5 ppm a 5.000 ppm y preferiblemente 1 ppm a 3.000 ppm de los compuestos de las fórmulas I o II. Además, los compuestos de las fórmulas I o II pueden formularse como marcadores para las orejas para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado vacuno y ovino.

- 50 Las preparaciones adecuadas son:

Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de dilución, soluciones para uso sobre la piel o en cavidades corporales, formulaciones para verter, geles;

Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semi-sólidas;

Formulaciones en las cuales el compuesto activo ha sido procesado en una base de ungüento o en una base de emulsión de aceite en agua o agua en aceite;

Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, granza, comprimidos, bolos, cápsulas aerosoles e inhalantes, y artículos conformados conteniendo el compuesto activo.

- 5 Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un disolvente adecuado y, opcionalmente, agregando además ingredientes tales como ácidos, bases, sales tampón, conservantes, y solubilizadores. Las soluciones se filtran y se rellenan de manera eséril.

10 Los disolventes adecuados son disolventes tolerables fisiológicamente tales como agua, alcanoles tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propileno glicol, polietileno glicoles, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, y mezclas de los mismos.

Los compuestos activos pueden opcionalmente disolverse en aceites vegetales o sintéticos tolerables fisiológicamente que sean adecuados para inyección.

15 Los solubilizadores adecuados son disolventes que promueven la disolución del compuesto activo en el disolvente principal o que previenen su precipitación. Los ejemplos son polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite de ricino polioxiethylado, y éster de sorbitano polioxiethylado.

Los conservantes adecuados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres de ácido p-hidroxibenzóico, y n-butanol.

20 Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran directamente después de dilución previa a la concentración de uso. Las soluciones orales y los concentrados se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y tal como se ha descrito anteriormente para soluciones para inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

Las soluciones para uso sobre la piel se aplican localmente, esparcen, frotan, espolvorean o pulverizan sobre ella.

Las soluciones para uso sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo con lo descrito anteriormente para soluciones para inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

25 Otros disolventes adecuados son polipropileno glicol, fenil etanol, fenoxi etanol, éster tal como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenoglicol alquiléter, por ejemplo, dipropilenglicol monometiléter, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcutol, solketal, propilencarbonato, y mezclas de los mismos.

30 Puede ser ventajoso agregar espesantes durante la preparación. Los espesantes adecuados son espesantes inorgánicos tales como bentonita, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados de celulosa, alcoholes polivinílicos y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

Los geles se aplican o se pulverizan sobre la piel o se introducen dentro de cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que han sido preparadas tal como se describe en el caso de las soluciones para inyección con suficiente espesante como para lograr un material transparente que tenga una consistencia tipo ungüento. Los espesantes usados son los espesantes anteriormente mencionados.

35 Las formulaciones para verter se vierten o pulverizan sobre áreas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo la piel y actuando sistémicamente.

40 Las preparaciones para verter se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsificando el compuesto activo en disolventes o mezclas de disolventes adecuados compatibles con la piel. En caso de ser apropiado, pueden agregarse otros compuestos auxiliares tales como colorantes, substancias promotoras de bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores de la luz, adhesivos.

45 Los disolventes adecuados son agua, alcanoles, glicoles, polietileno glicoles, polipropileno glicoles, glicerol, alcoholes aromáticos tales como alcohol bencílico, fenil etanol, ésteres tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de etilo, éteres tales como alquilenoglicol alquiléteres, tales como dipropileno glicol monometiléter, dietileno glicolmonobutiléter, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, carbonatos cíclicos tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, N-alquilpirrolidonas tales como N-metilpirrolidona, N-butilpirrolidona o N-octilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oxi-metileno-1,3-dioxolano y glicerol formal.

Los colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para uso sobre animales y que puedan disolverse o suspenderse.

50 Las substancias promotoras de absorción adecuadas son, por ejemplo, DMSO, aceites de dispersión tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropileno glicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

Los antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tal como metabisulfito potásico, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

Los estabilizadores de la luz adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

5 Los adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatina.

Las emulsiones pueden administrarse oralmente, dérmica o como inyecciones.

Las emulsiones son o bien del tipo de agua en aceite o bien de aceite en agua.

10 Se preparan disolviendo el compuesto activo o bien en la fase hidrófoba o bien en la hidrófila y homogeneizando esta con el disolvente u la otra fase con la ayuda de emulsificadores adecuados y, caso de ser apropiado, otros compuestos auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de la luz, sustancias potenciadoras de la viscosidad.

Las fases hidrófobas (aceites) adecuadas son:

15 Parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite de ricino, triglicéridos sintéticos tales como biglicérido caprílico/cáprico, mezcla de triglicéridos con aceites grasos vegetales de longitud de cadena de  $C_8$ - $C_{12}$  u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o no saturados conteniendo posiblemente también grupos hidroxilo, mono- y diglicéridos de ácidos grasos de  $C_8$ - $C_{10}$ , ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, pelargonato de dipropileno glicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena de  $C_{16}$ - $C_{18}$ , miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena de  $C_{12}$ - $C_{18}$ , estearato de isopropilo, oleato de oleilo, oleato de decilo, oletato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos tales como grasa de glándula coccígea de pato sintética, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionadas con el último, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecilo, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleílico, y ácidos grasos tal como ácido oléico y mezclas de los mismos.

20

25

Las fases hidrófilas adecuadas son: agua, alcoholes tales como propileno glicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

Los emulsificadores adecuados son:

30 Tensioactivos no iónicos, por ejemplo aceite de ricino polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monoestearato de sorbitano, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol éter; tensioactivos anfólicos tales como N-lauril-p-iminodipropionato disódico o lecitina; tensioactivos aniónicos, tal como lauril sulfato sódico, éter sulfatos de alcoholes grasos, sal monoetanolamina de mono/dialquil poliglicol éter de éster de ácido ortofosfórico; tensioactivos de carbón activo, tal como cloruro de cetiltrimetilamonio.

35 Los compuestos auxiliares adicionales adecuados son: sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otras celulosas y derivados de almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maléico, polietileno glicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias anteriormente mencionadas.

40 Las suspensiones pueden administrarse oral o tópicamente/dérmicamente. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, y en los casos apropiados, con adición de otros compuestos auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de la luz.

Los agentes de suspensión líquidos son todos ellos disolventes homogéneos y mezclas de disolventes.

Los agentes humectantes (dispersantes) adecuados son los emulsificadores anteriormente indicados.

45 Otros compuestos auxiliares que pueden mencionarse son los anteriormente indicados.

Las preparaciones semi-sólidas pueden administrarse oral o tópicamente/dérmicamente. Difieren de las suspensiones y emulsiones anteriormente descritas únicamente en su mayor viscosidad.

Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, y en casos apropiados, con adición de compuestos auxiliares, y se transforma a la forma deseada.

50 Los excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas tolerables fisiológicamente. Los usados son sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro sódico, carbonatos tales

como carbonato cálcico, bicarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice coloidal o precipitada, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos y piensos tal como leche en polvo, harina animal, harinas y trozos de granos, almidones.

5 Los compuestos auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes, y/o colorantes que han sido mencionados anteriormente.

Otros compuestos auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes tales como estearato magnésico, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la desintegración tal como almidón o polivinilpirrolidona reticulada, aglomerantes tal como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglomerantes secos tal como celulosa microcristalina.

10 En general, "cantidad eficaz parasíticamente" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y eliminación, destrucción, o disminución de cualquier otra forma de la incidencia y actividad del organismo diana. La cantidad eficaz parasíticamente puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad eficaz parasíticamente de las composiciones variará igualmente de acuerdo con las condiciones prevalentes  
15 tales como efecto parasítico deseado y duración, especies diana, modo de aplicación, y similares.

Las composiciones que pueden usarse en la invención pueden comprender generalmente desde aproximadamente 0,001 hasta 95% del compuesto de las fórmulas I o II.

Generalmente, es favorable aplicar los compuestos de las fórmulas I o II en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

20 Las preparaciones listas para usar contienen el compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferiblemente desde 0,1 hasta 65 por ciento en peso, más preferiblemente desde 1 hasta 50 por ciento en peso, lo más preferiblemente desde 5 hasta 40 por ciento en peso.

25 Las preparaciones que se diluyen antes de su uso contienen los compuestos que actúan contra los ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 por ciento en peso, preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso.

Además, las preparaciones comprenden los compuestos de las fórmulas I o II contra ectoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferiblemente de 0,05 a 0,9 por ciento en peso, muy particularmente preferiblemente de 0,00 a 0,25 por ciento en peso.

30 En una realización preferida de la presente invención, las composiciones que comprenden los compuestos de las fórmulas I o II se aplican dérmicamente/tópicamente.

En una realización preferida adicional, la aplicación tópica se lleva a cabo en la forma de artículos conformados que contienen el compuesto tales como collares, medallones, marcadores para las orejas, bandas para fijación en partes del cuerpo, y tiras y láminas adhesivas.

35 Generalmente, es favorable aplicar las formulaciones sólidas que liberan compuestos de las fórmulas I o II en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el curso de tres semanas.

40 Para la preparación de los artículos conformados, se usan termoplásticos y plásticos flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Los plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster, los cuales son suficientemente compatibles con los compuestos de las fórmulas I y II. En el Documento WO 03/086075 se da una lista detallada de plásticos y elastómeros, así como los procedimientos de preparación para los artículos conformados.

45 Las composiciones a usar de acuerdo con esta invención pueden contener igualmente otros ingredientes activos, por ejemplo otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas, o bactericidas, fertilizantes tales como nitrato amónico, urea, potasa, y superfosfato, fitotóxicantes y reguladores del crecimiento de las plantas, protectores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales pueden usarse secuencialmente o en combinación con las composiciones anteriormente descritas, y en casos apropiados, agregados también únicamente inmediatamente antes de su uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, la planta(s) puede pulverizarse con una composición de esta invención tanto antes como después de haber sido tratada con otros ingredientes activos.

50 Estos agentes pueden mezclarse con los agentes usados de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1. El mezclado de los compuestos de las fórmulas I o II o de las composiciones que los comprenden en la forma de uso como pesticidas con otros pesticidas frecuentemente da como resultado un espectro de acción pesticida más amplio.

La lista M siguiente de pesticidas conjuntamente con los cuales pueden usarse los compuestos de las fórmulas I o II de la invención y con los cuales podrían producirse efectos sinérgicos potenciales, está destinada a ilustrar las combinaciones posibles, pero no impone ninguna limitación:

5 M.1. Organo(tio)fosfatos: acephate, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphosmethyl, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlorpyrifos, chlorpyrifosmethyl, coumaphos, cyanophos, demeton-S-methyl, diazinon, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, flupyrazophos, fosthiazate, heptenophos, isoxathion, malathion, mecarbam, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omrthoate, oxydemeton-methyl, parathion, parathion-methyl, phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-methyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebufirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon, vamidothion;

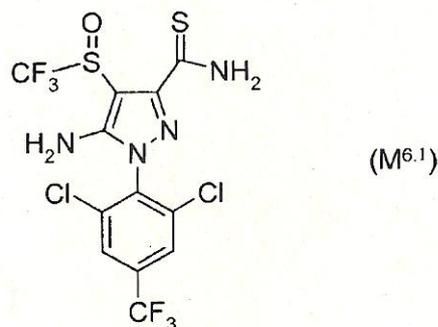
10 M.2. Carbamatos: aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb, formetanate, furathiocarb, isoprocarb, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, trimethacarb, XMC, xylilcarb, triazamate;

15 M.3. Piretroides: acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin S-cyclopentenyl, bioresmethrin, cycloprothrin, cyfluthrin, betacyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alphacypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin, deltamethrin, empenthrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, metofluthin, permethrin, phenothrin, prallethrin, profluthrin, pyrethrin (pyrethrum), resmethrin, RU 15525, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin, ZXI 8901;

M.4. Imitadores de hormonas juveniles: hydropene, kinoprene, methoprene, fenoxycarb, pyryproxifen:

20 M.5. Compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: acetamidrid, bensultap, cartap hydrochloride, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, thiamethoxam, nitenpyram, nicotina, spinosad (agonista alostérico), spinetoram (agonista alostérico), thiocloprid, thiocyclam, thiosultp-sodium y AKD 1022;

M.6. Compuestos antagonistas del canal cloruro cerrado GABA: chlordane, endosulfan, gamma-HCH (lindane); acetoprole, ethioprole, pyrafluprole, pyriprole, vaniliprole, el compuesto fenilpirazol de fórmula M6.1



30 M.7. Activadores del canal cloruro: abamectin, emamectin benzoate, milbeme ctin, lepimectin;

M.8. compuestos METI I: fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, flufenimer, rotenone;

M.9. Compuestos METI II y III: acequinocyl, fluacyprim, hydramethylon;

M.10. Desacopladores de fosforilación oxidativa: chlorfenapyr, DNOC;

35 M.11. Inhibidores de fosforilación oxidativa: azocyclotin, cyhexatin, diafenthion, fenbutatin oxide, propargite, tetradifon;

M.12. Interruptores de la muda: cyromazine, chromafenozide, halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide;

M.13. Sinergistas: butóxido de piperonilo, tribufos;

M.14. Compuestos bloqueadores del canal de sodio: indoxacarb, metaflomizone;

40 M.15. Fumigantes: bromuro de metilo, sulfúrico fluoruro de cloropicrina;

M.16. Bloqueadores de alimentación selectiva: crylotie, pymetrozine, flonicamid;

M.17. Inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezine, hexithiazox, etoxazole;

M.18. Inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezin, bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron;

5 M.19. Inhibidores de la síntesis de lípidos: spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat;

M.20. Agonistas octapaminérgicos: amitraz;

M.21. Moduladores del receptor rianodina: flubendiamide: (R)-, (S)-3-cloro-N1-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida (M21.1);

10 M.22. Varios: fosfuro de aluminio, amidoflumet, benclothiaz, benzoximate, bifenazate, bórax, bromopropilato, cianuro, cyenopyrafen, cyflumetofen, chinometionate, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridalilo, pyrfluquinazon, azufre, compuestos de azufre orgánicos, tártaro emético, sulfoxaflor, 4-but-2-iniloxi-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-2-fluoropirimidina, (M22.1) 3-benzoilamino N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-benzamina, (M22.2), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-piridin-2-ilmetil-benzamida (M22.3), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)-benzamida (M22.4), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-tiazol-2-ilmetil-benzamida (M22.5), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(tetrahidrofuran-2-ilmetil)-benzamida (M22.6), 4-[[6-bromopirid-3-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.7), 4-[[6-bromopirid-3-il]metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.8), 4-[[2-cloro-1,3-tiazolo-5-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.9), 4-[[6-cloropirid-3-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.10), 4-[[6-cloropirid-3-il]metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.11), 4-[[6-cloro-5-fluoropirid-3-il]metil](metil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.12), 4-[[5,6-dicloropirid-3-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.13), 4-[[6-cloro-5-fluoropirid-3-il]metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.14), 4-[[6-cloropirid-3-il]metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.15), 4-[[6-cloropirid-3-il]metil](metil)amino}furan-2(5H)-on (M.22.16), éster 1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bs)-4-[[2-ciclopropilacetil)oxi]metil]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-12-hidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,1H-nafto[2.1-b]bipirano[3.4-e]piran-3,6-diilo del ácido ciclopropanoacético (M.22.17), 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-metil-fenoxi)-3-(6-metil-piridacin-3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (M.22.18);

30 M.23. N-R'-2,2-dihalo-1-R''-ciclopropanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)hidrazona, en la que R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo;

35 M.24. Antranilamidas: clorantraniliprol, ciantraniliprol, [4-ciano-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazolo-3-carboxílico (M.24.1), [2-cloro-4-ciano-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazolo-3-carboxílico (M.24.2), [2-bromo-4-ciano-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazolo-3-carboxílico (M.24.3), [2-bromo-4-cloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazolo-3-carboxílico (M.24.4), [2,4-dicloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazolo-3-carboxílico (M.24.5), [4-cloro-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazolo-3-carboxílico (M.24.6);

40 M.25. Compuestos malononitrilo:  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ , (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo),  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$ , (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,7,7-dodecafluoroheptil)-2-(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo),  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_2)_5\text{F}$ , (2-(3,4,4,4-tetrafluoro-3-trifluorometil-butil)-2-(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo),  $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$  (2,2-bis-(2,2,3,3,4,4,5,5,-octafluoropentil)malononitrilo),  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$  (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-nonafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo),  $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$  (2-(2,2,3,3,4,4-heptafluorobutil)-2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropropil)malononitrilo),  $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$  (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(2,2,3,3,3-pentafluoropropil)malononitrilo),  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$  (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)malononitrilo),  $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$  (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluorobutil)malononitrilo);

M.26. Interruptores microbianos: *Bacillus thuringiensis* sbsp. *Israelensi*, *Bacillus sphearicus*, *Bacillus thuringiensis* sbsp. *Aizawai*, *Bacillus thuringiensis* sbsp. *Kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* sbsp. *Tenebrionis*

Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 14th Edition, British Crop Protection Council (2006), entre otras publicaciones.

55 Las tioamidas de fórmula M.6.1 y su preparación han sido descritas en el Documento WO 98/28279. La Lepimectina se la conoce del Agro Project, PJB Publications Ltd., (Noviembre 2004). El Benclorhiaz y su preparación ha sido

descrito en el Documento EP-A1 454621. El Methidathion y Paraoxon y su preparación ha sido descrita en el Farm Chemical Handbook, vol. 88, Meister Publishing Company, (2001). El Acetoprol y su preparación ha sido descrito en el Documento WO 98/28277. El Metaflumizone y su preparación ha sido descrito en el Documento EP-A1 462 456. El Flupyrazofos ha sido descrito en Pesticide Science, vol. 54, pág. 237-243, (1988) y en la Patente de EE.UU. 4 822 779. El Pyrafluprole y su preparación ha sido descrito en el Documento JP 2002193709 y en el Documento WO 01/00614. El Pyriprole y su preparación ha sido descrito en el Documento WO 98/45274 y la Patente de EE.UU. 6 335 357. El Amidoflumet y su preparación ha sido descrito en la Patente de EE.UU. 6 221 890 y JP 21010907. El Flufenimerim y su preparación ha sido descrito en los Documentos WO 03/007717 y WO 03/007718. El AKD 1022 y su preparación ha sido descrito en la Patente de EE.UU. 6 300 348. El Chloranthraniliprole ha sido descrito en los Documentos WO 01/70671, WO 03/015519 y WO 05/118552. El Cyantraniliprole ha sido descrito en los Documentos WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. Las antranilamidas M.24.1 a M.24.8 han sido descritas en los Documentos WO 2008/72743 y WO 2008/72783. La ftalamida M.21.1 se la conoce del Documento WO 2007/101540. El Cyflumetofen y su preparación ha sido descrito en el Documento WO 04/080180. El compuesto aminoquinazolona Pirifluquinazon ha sido descrito en el Documento EP-A 109 7932. La sulfoximina Sulfoxaflor ha sido descrita en los Documentos WO 2006/060029 y WO 2007/149134. El compuesto alquililéter M.22.1 se describe, por ejemplo, en el Documento JP 2006131529. Los compuestos de azufre orgánicos han sido descritos en el Documento WO 2007060839. El compuesto carboxamida M.22.2 se conoce del Documento WO 2007/83394. Los compuestos oxazolino M.22.3 a M.22.6 han sido descritos en el Documento WO 2007/074789. Los compuestos furanona M.22.7 a M.22.16 han sido descritos, por ejemplo, en el Documento WO 2007/115644. El derivado piripropeño M.22.17 ha sido descrito en los Documentos WO2008/66153 y WO 2008/108491. El compueswto pirdacina M.22.18 ha sido descrito en el Documento JP 2008/115155. Los compuestos malononitrilos han sido descritos en los Documentos WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694.

Las parejas de mezclas fungicidas son, en particular, las seleccionadas entre el grupo que consiste en acilalaninas tales como benalaxyl, metalaxyl, ofurace, oxadixyl, derivados de amina tales como aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamin, tridemorph, anilino pirimidinas tales como pyrimethanil, mepanipyrim, o cyrodinil, antibióticos tales como cycloheximid, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin o estreptomycin, azoles tales como bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propioconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutiafol, dicarboximidazoles tales como iprodion, myclozolin, procymidon, vinclozolin, ditiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram, zineb, compuestos heterocíclicos tales como anilazine, benomyl, boscalid, carbendazim, carboxin, oxycarboxin, cyazomamid, dazomet, dithianon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pyrifenoxy, pyroquilon, quinoxifen, silthiofom, thiabendazole, thifluzamid, thiophanate-methyl, tiadinil, tricyclazole, triforine, fungicidas de cobre tales como mezcla de Burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico, derivados de nitrofenilo tales como binapacryl, dinocap, dinobuton, nitroftalisopropilo, fenilpirroles tales como fenpiclonil o fludioxonil, azufre, otros fungicidas tales como acibenzolar-S-methyl, benthialicarb, carpropamid, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, diclomezin, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin-acetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fesetyl, fosetyl-aluminum, iprovalicarb, hexachlorobenceno, metrafenon, pencycuron, propamocarb, ftalida, tolclofos-methyl, quintozone, zoxamid, estrobilurinas tales como azostrobin, dimoxystrobin, enestroburin, floxastrobin, kresoximmethyl, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, pyrebenrab o trifloxystrobin, derivados de ácidos sulfenico tales como captafol, captan, dichlofluanid, folpet, tolyfluanid, cinnemamidas y análogos tales como dimethomorph, flumetover oflumorph.

La plaga de invertebrados, es decir, artrópodos y nematodos, la planta, suelo o agua en el cual está creciendo la planta, puede estar en contacto con el compuesto(s) de las fórmulas I o II o composición(es) que les contienen mediante cualquier procedimiento de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "contacto" incluye tanto contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga de invertebrados o planta, típicamente al follaje, tallo, o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga de invertebrados o planta).

Además, las plagas de invertebrados pueden controlarse poniendo en contacto la plaga diana, su suministro alimenticio, habitat, terreno de reproducción o su locus, con una cantidad eficaz pesticidamente de compuestos de las fórmulas I o II. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del locus, de cultivos en crecimiento, o de cultivos recolectados por la plaga.

"Locus" en general, significa un hábitat, terreno de reproducción, plantas cultivadas, material de propagación de plantas (tal como semillas), suelo, áreas, material o medioambiente, en el cual una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

En general "cantidad eficaz pesticidamente" significa la cantidad de ingrediente activo necesario para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, o eliminación, destrucción, o de cualquier otra forma que disminuya la incidencia y actividad del organismo diana. La cantidad eficaz pesticidamente puede variar por los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad eficaz pesticidamente de las composiciones variará igualmente de acuerdo con las condiciones prevalentes tales

como el efecto y duración del pesticida deseado, tiempo meteorológico, especies diana, locus, modo de aplicación y similares.

- 5 Los compuestos de las fórmulas I o II y las composiciones de comprenden dichos compuestos, pueden usarse para la protección de materiales de madera tales como árboles, cercos de madera, travesaños, etc., y construcciones tales como casas, dependencias accesorias, fábricas, pero también para materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, hilos y cables eléctricos, etc., de hormigas y/o termitas, y para el control de hormigas y termitas del daño a los cultivos o los seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden las viviendas e instalaciones públicas). Los compuestos se aplican no solamente a la superficie del suelo circundante o dentro del subsuelo con el fin de proteger los materiales de madera, sino que además pueden aplicarse a artículos de madera de construcción tales como superficies del cemento del subsuelo, retretes, vigas, contrachapados, muebles, etc., artículos de madera, tales como aglomerados, tableros, etc., y artículos de vinilo tales como hilos eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante eléctrico tales como espumas de estireno, etc. En el caso de aplicación contra hormigas dañinas para los cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al hormiguero o similar.
- 10
- 15 Los compuestos de las fórmulas I o II pueden igualmente aplicarse de manera preventiva a lugares en los cuales es de esperar la incidencia de las plagas.

- Los compuestos de las fórmulas I o II pueden igualmente usarse para proteger a las plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas mediante el contacto de la planta con una cantidad eficaz pesticidamente de compuestos de las fórmulas I o II. Como tal, "contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o la planta, típicamente al follaje, tallo, o raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).
- 20

En el caso del tratamiento del suelo o de aplicación al lugar en que habitan las plagas u hormigueros, la cantidad de ingrediente activo varía desde 0,0001 a 500 g por 100 m<sup>2</sup>, preferiblemente desde 0,001 hasta 20 g por 100 m<sup>2</sup>.

- 25 Las proporciones de aplicación usuales en la protección de materiales son, por ejemplo, desde 0,01 g hasta 1000 g de compuesto activo por m<sup>2</sup> de material tratado, de manera deseable desde 0,1 g hasta 50 g por m<sup>2</sup>.

Las composiciones insecticidas para uso en la impregnación de materiales típicamente contienen desde 0,001 hasta 95% en peso, preferiblemente desde 0,1 hasta 45% en peso, y más preferiblemente desde 1 hasta 25% en peso, de al menos un repelente y/o insecticida.

- 30 Para uso en composiciones para cebo, el contenido típico de ingrediente activo es desde 0,001% en peso hasta 15% en peso, de manera deseable desde 0,001% en peso hasta 5% en peso de compuesto activo.

Para uso en composiciones para pulverización, el contenido típico de ingrediente activo es desde 0,001 hasta 80% en peso, preferiblemente desde 0,01 hasta 50% en peso y los más preferiblemente desde 0,01 hasta 15% en peso.

- 35 Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la proporción de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar dentro del intervalo de 0,1 g hasta 4000 g por hectárea, de manera deseable desde 25 g hasta 600 g por hectárea, más deseablemente desde 50 g hasta 500 g por hectárea.

En el tratamiento de semillas, las proporciones de aplicación de los ingredientes activos son generalmente desde 0,1 g hasta 10 kg por 100 kg de semillas, preferiblemente desde 1 g hasta 5 kg por 100 kg de semillas, en particular desde 1 g hasta 200 g por 100 kg de semillas.

La presente invención se ilustra a continuación con mayor detalle mediante los ejemplos siguientes.

#### 40 **I. Ejemplos de preparación**

Los procedimientos descritos en los Ejemplos de preparación siguientes se usaron para preparar compuestos adicionales de las fórmulas I y II mediante la apropiada modificación del material de partida. Los compuestos resultantes, conjuntamente con los datos físicos, se listan en la Tabla C más adelante.

Los productos se caracterizaron mediante HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Eficacia).

- 45 Espectrometría de masa. La HPLC se llevó a cabo usando una columna RP-18 analítica (Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania), operada a 40°C. El acetonitrilo con 0,1% en volumen de una mezcla de ácido trifluoroacético/agua y 0,1% en volumen de ácido trifluoroacético sirvió como fase móvil; velocidad de flujo: 1,8 ml/min y volumen de inyección: 2 µl.

**Ejemplo 1:** Piridacin-4-ilamida del ácido 3-ciclopropil-isoxazol-4-carboxílico (Ejemplo 4 en la Tabla C)

- 50 Acido 3-ciclopropil-isoxazol-4-carboxílico

Se agregaron lentamente 5,6 g (31 mmol) de éster etílico del ácido 3-ciclopropil-isoxazol-4-carboxílico a una solución de 6,1 g (93 mmol, 85% de pureza) de hidróxido potásico en etanol/agua (1:3, 100 ml) a 0°C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con agua, se acidificó (pH = 2) con HCl acuoso al 20% y se extrajo con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato sódico, se filtraron y el disolvente se eliminó, proporcionando 4,7 g (94%, 95% de pureza) del compuesto del epígrafe, el cual no necesitó purificación adicional.

#### Piridacin-4-ilamida del ácido 3-ciclopropil-isoxazol-4-carboxílico

Se suspendieron 400 mg (2,6 mmol) de ácido 3-ciclopropil-isoxazol-4-carboxílico en 10 ml de tolueno y a la mezcla se agregó una gota de dimetilformamida. Se agregaron 0,24 ml de cloruro de tionilo (3,3 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó a 65°C durante dos horas. Después de la eliminación del disolvente, se agregó tolueno y se repitió la evaporación. A continuación, el residuo obtenido se disolvió en 5 ml de diclorometano y la solución se agregó gota a gota a una solución que contenía 248 mg de piridazin-4-ilamina (2,6 mmol) y 0,45 ml de trietilamina (3,3 mmol) en 5 ml de diclorometano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y el disolvente se eliminó bajo vacío. El aceite de color pardo obtenido se purificó mediante cromatografía de columna ultrarrápida (sílice, gradiente de elución ciclohexano → acetato de etilo → metanol) y el disolvente se eliminó bajo vacío. El residuo se disolvió en diclorometano, se lavó con agua, se secó sobre sulfato sódico, se filtró y el disolvente se eliminó, proporcionando 230 mg (29%, 95% de pureza) del compuesto del epígrafe.

#### **Ejemplo 2:** Metil-piridacin-4-ilamida del ácido 3-ciclopropil-isoxazol-4-carboxílico (Ejemplo 5 en la Tabla C)

Se suspendieron 400 mg (2,6 mmol) de ácido 3-ciclopropil-isoxazol-4-carboxílico en 10 ml de tolueno y a la mezcla se agregó una gota de dimetilformamida. Se agregaron 0,24 ml de cloruro de tionilo (3,3 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó a 65°C durante dos horas. Después de la eliminación del disolvente, se agregó tolueno y se repitió la evaporación. A continuación, el residuo obtenido se disolvió en 5 ml de diclorometano y la solución se agregó gota a gota a una solución que contenía 285 mg de metil-piridazin-4-ilamina (2,6 mmol) y 0,45 ml de trietilamina (3,3 mmol) en 5 ml de diclorometano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y el disolvente se eliminó bajo vacío. El aceite de color pardo obtenido se purificó mediante cromatografía de columna ultrarrápida (sílice, gradiente de elución ciclohexano → acetato de etilo → metanol), proporcionando 400 mg (60%, 95% de pureza) del compuesto del epígrafe.

#### **Ejemplo 3:** 3-terc-butilamida 4-piridacin-4-ilamida del ácido isoxazol-3,4-dicarboxílico (Ejemplo 6 en la Tabla C)

Se suspendieron 600 mg (2,8 mmol) de ácido 3-terc-butilcarbamoil-isoxazol-4-carboxílico en 20 ml de tolueno y a la mezcla se agregaron dos gotas de dimetilformamida. Se agregaron 0,26 ml de cloruro de tionilo (3,5 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó a 65°C durante dos horas. Después de la eliminación del disolvente, se agregó tolueno y se repitió la evaporación. A continuación, el residuo obtenido se disolvió en 10 ml de diclorometano y la solución se agregó gota a gota a una solución que contenía 247 mg de piridazin-4-ilamina (2,6 mmol) y 0,43 ml de trietilamina (3,1 mmol) en 40 ml de diclorometano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y el disolvente se eliminó bajo vacío. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía de columna ultrarrápida (sílice, gradiente de elución ciclohexano → acetato de etilo → metanol), proporcionando 275 mg (32%, 95% de pureza) del compuesto del epígrafe.

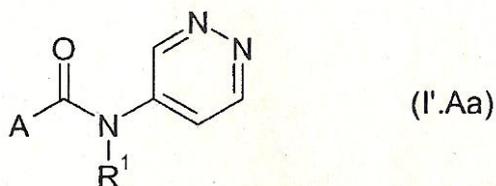
#### **Ejemplo 4:** 3-terc-butilamida 4-(metil-piridacin-4-ilamida) del ácido isoxazol-3,4-dicarboxílico (Ejemplo 3 en la Tabla C)

Se suspendieron 600 mg (2,8 mmol) de ácido 3-terc-butilcarbamoil-isoxazol-4-carboxílico en 20 ml de tolueno y a la mezcla se agregaron dos gotas de dimetilformamida. Se agregaron 0,26 ml de cloruro de tionilo (3,5 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó a 65°C durante dos horas. Después de la eliminación del disolvente, se agregó tolueno y se repitió la evaporación. A continuación, el residuo obtenido se disolvió en 10 ml de diclorometano y la solución se agregó gota a gota a una solución que contenía 247 mg de metil-piridazin-4-ilamina (2,3 mmol) y 0,43 ml de trietilamina (3,1 mmol) en 40 ml de diclorometano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y el disolvente se eliminó bajo vacío. El residuo obtenido se purificó mediante cromatografía de columna ultrarrápida (sílice, gradiente de elución ciclohexano → acetato de etilo → metanol), proporcionando 180 mg (20%, 95% de pureza) del compuesto del epígrafe.

#### **Ejemplo 5:** Piridacin-4-ilamida del ácido 3,5-dimetil-isoxazol-4-carboxílico (Ejemplo 2 en la Tabla C)

Se suspendieron 600 mg (4,3 mmol) de ácido 3,5-dimetil-isoxazol-4-carboxílico en 5 ml de tolueno y a la mezcla se agregaron dos gotas de dimetilformamida. Se agregaron 0,39 ml de cloruro de tionilo (5,3 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó a 65°C durante tres horas. Después de la eliminación del disolvente, se agregó tolueno y se repitió la evaporación. A continuación, el residuo obtenido se disolvió en 5 ml de diclorometano y la solución se agregó gota a gota a una solución que contenía 367 mg de piridazin-4-ilamina (3,8 mmol) y 1,6 g (5,2 mmol) de diisopropil etil amina unida a polímero (resina PL-DIPAM, Polymer Laboratories) en 16 ml de diclorometano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. A continuación, el polímero se eliminó mediante filtración y se lavó con metanol. La solución obtenida después del lavado contenía 600 mg (58%, 90% de pureza) del compuesto del epígrafe, el cual no necesitó purificación adicional.

Los compuestos de la fórmula I y las sales o los N-óxidos de los mismos, en los que  $R^t$ ,  $R^u$  y  $W$  son CH,  $V$  es N y  $X^1$  es O, se denominan en la presente invención en adelante como compuestos I'.Aa.



- 5 Los compuestos de la fórmula I'.Aa preparados de acuerdo con el procedimiento anteriormente mencionado, conjuntamente con sus datos fisicoquímicos, están recogidos en la Tabla C a continuación.  $R^1$  y  $A$  en cada caso tienen los significados dados en la línea correspondiente de la Tabla C.

Tabla C. Compuestos de fórmula I'.Aa preparados de acuerdo con el procedimiento anteriormente mencionado

Ejemplo	$R^1$	A	Datos fisicoquímicos: t.r. [min]
1	H	3-metilisoxazol-4-ilo	1,331
2	H	3,5-dimetilisoxazol-4-ilo	1,339
3	metilo	3-(N-terc-butilcarbamoil)isoxazol-4-ilo	1,792
4	H	3-ciclopropilisoxazol-4-ilo	1,712
5	metilo	3-ciclopropilisoxazol-4-ilo	1,613
6	H	3-(N-terc-butilcarbamoil)isoxazol-4-ilo	2,097
7	metilo	3-metilisoxazol-4-ilo	1,212
8	H	3-metil-5-fenilisoxazol-4-ilo	2,166
9	metilo	3-metil-5-fenilisoxazol-4-ilo	2,182
10	H	3-(4-fluorofenil)-5-metilisoxazol-4-ilo	2,361
11	metilo	3-(4-fluorofenil)-5-metilisoxazol-4-ilo	2,201
12	H	3-etilisoxazol-4-ilo	1,647
13	metilo	3-etilisoxazol-4-ilo	1,559
14	H	3-trifluorometilisoxazol-4-ilo	1,776
15	Me	3-trifluorometilisoxazol-4-ilo	1,816
16	H	3-trifluorometilisotiazol-4-ilo	1,930
17	H	5-etilisotiazol-4-ilo	1,869
18	Me	5-etilisotiazol-4-ilo	1,744
19	H	5-metilisotiazol-4-ilo	1,494
20	Me	5-metilisotiazol-4-ilo	1,396
21	H	3-metilisotiazol-4-ilo	1,458
22	H	3-etilisotiazol-4-ilo	1,762
23	Me	3-etilisotiazol-4-ilo	1,676
24	Me	3-trifluorometilisotiazol-4-ilo	1,837

25	Me	3-metilisotiazol-4-ilo	1,354
t.r. = tiempo de retención de HPLC			

## II. Evaluación de la actividad pesticida

### II.1 Actividad contra Afido del algodón (*Aphis gossypii*, fases de vida mezcladas)

5 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1,3 ml. Estos tubos se insertaron dentro un pulverizador electrostático automático equipado con una boquilla de atomización y se sirvieron en soluciones madre para las cuales se habían hecho diluciones inferiores en acetona al 50%:agua al 50% (v/v). En la solución se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) a un volumen del 0,01% (v/v).

10 Las plantas de algodón en la fase cotiledón se infestaron con áfidos antes del tratamiento colocando una hoja altamente infestada procedente de la colonia de áfidos principal sobre la parte superior de cada cotiledón. Se dejó que los áfidos se transfirieran durante una noche a fin de lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta y la hoja huésped se retiró. A continuación, las plantas infestadas se pulverizaron mediante un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización por atomización. Las plantas se secaron en la campana extractora del pulverizador, se retiraron del pulverizador y, a continuación, se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo luz fluorescente en un fotoperiodo de 24 horas a 25°C y 20-40% de humedad relativa. Después de 5 días, se determinó la mortalidad de áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad de las plantas de control no tratadas.

15 En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 7, 8, 10, 12, 13, 14, 15, 17, 19, 20, 21, 22, 24 y 25 respectivamente, a 300 ppm, mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

### 20 II.2 Actividad contra el Afido del melocotonero (*Myzus persicae*, fases de vida mezcladas)

25 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1,3 ml. Estos tubos se insertaron dentro un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla de atomización y se sirvieron en soluciones madre para las cuales se habían hecho diluciones inferiores en acetona al 50%:agua al 50% (v/v). En la solución se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) a un volumen del 0,01% (v/v).

30 Las plantas de pimienta en la fase de primera hoja real, se infestaron antes del tratamiento colocando hojas altamente infestadas procedentes de la colonia principal sobre la parte superior de las plantas de tratamiento. Se dejó que los áfidos se transfirieran durante una noche a fin de lograr una infestación de 30-50 áfidos por planta y las hojas huéspedes se retiraron. A continuación, las plantas infestadas se pulverizaron mediante un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización por atomización. Las plantas se secaron en la campana extractora del pulverizador, se retiraron y, a continuación, se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo luz fluorescente en un fotoperiodo de 24 horas a 25°C y 20-40% de humedad relativa. Después de 5 días, se determinó la mortalidad de áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad de las plantas de control no tratadas.

35 En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 7, 8, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 24 y 25 respectivamente, a 300 ppm, mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

### II.3 Actividad contra el Afido del caupí (*Aphis craccivora*)

Los compuestos activos se formularon en acetona:agua al 50:50 (v/v). La solución de ensayo se preparó el día de su uso.

40 Las plantas del caupí en tiestos colonizadas con 100 -150 áfidos de diversas fases se pulverizaron después de haberse contabilizado la población de la plaga. La reducción de la población se comprobó después de 24, 72 y 120 horas.

En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 12, 13, 14 y 15 respectivamente, a 300 ppm, mostraron una mortalidad de al menos el 90% en comparación con los controles no tratados.

### 45 II.4 Actividad contra la Mosca blanca de hoja plateada (*Bemisia argentifolii*, adulta)

50 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1,3 ml. Estos tubos se insertaron dentro un pulverizador electrostático automático equipado con una boquilla de atomización y se sirvieron en soluciones madre para las cuales se habían hecho diluciones inferiores en acetona al 50%:agua al 50% (v/v). En la solución se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) a un volumen del 0,01% (v/v).

Las plantas de algodón en la fase cotiledón (una planta por tiesto) se pulverizaron mediante un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización por atomización. Las plantas se secaron en la campana extractora del pulverizador y, a continuación, se retiraron. Cada tiesto se colocó en una cubeta de ensayo y se introdujeron 10 a 12 moscas blancas adultas (3-5 días de edad, aproximadamente). Los insectos se recolectaron usando un aspirador y una tubería de Tygon® (R-3603) no tóxica, de 0,6 cm, conectada a una punta de pipeta de barrera. A continuación, la punta, conteniendo los insectos recolectados, se insertó suavemente dentro de la tierra que contenía la planta tratada, dejando que los insectos se arrastraran fuera de la punta a fin de alcanzar el follaje para alimentarse. Las cubetas se taparon con una cubierta apantallada reutilizable (pantalla de poliéster de 150 micrómetros de malla PeCap de Telco, Inc.). Las plantas de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento a 25°C y 20-40% de humedad relativa durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) a fin de prevenir la retención de calor dentro de la cubierta. Tres días después del tratamiento, se determinó la mortalidad, en comparación con las plantas de control no tratadas.

En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 12, 14, 15, 16 y 17 respectivamente, a 300 ppm, mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

#### 15 II.5 Actividad contra Afido de la aveza (*Megoura viciae*)

Los compuestos activos se formularon en DMSO:agua una relación 1:3 (v/v) con diferentes concentraciones de compuestos formulados.

20 Los discos de hoja de judía se colocaron en microplacas rellenas con agar-agar al 0,8% y 2,5 ppm de OPUS™. Los discos de hojas se pulverizaron con 2,5 µl de la solución de ensayo y se colocaron 5 a 8 adultos dentro de las microplacas, las cuales, a continuación, se cerraron y se mantuvieron a 23±1°C y 50±5% de humedad relativa bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se comprobó en base de los áfidos reproducidos, vitales. A continuación, se comprobó visualmente la mortalidad y fecundidad de los áfidos.

En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 14, 15, 17, 19, 21 y 22 respectivamente, a una concentración de la solución de ensayo de 2500 mg/l, mostraron una mortalidad de al menos el 90%.

#### 25 II.6 Actividad contra el Afido del melocotero (*Myzus persicae*)

Para el control de evaluación del áfido de melocotonero (*Myzus persicae*) mediante medios sistémicos, la unidad de control estaba formada de placas de microvaloración de 96 pocillos que contenían dieta artificial líquida bajo una membrana artificial.

30 Los compuestos se formularon usando una solución que contenía 75% (v/v) de agua y 25% (v/v) de DMSO. Las diferentes concentraciones de los compuestos formulados se pipetearon dentro de la dieta del áfido, usando un pipeteador construido ex profeso, por duplicado. Después de la aplicación, se colocaron 5 a 8 áfidos adultos sobre la membrana artificial dentro de los pocillos de la placa de microvaloración. A continuación, se dejó que los áfidos chuparan la dieta de áfido tratada y se incubaron a aproximadamente 23±1°C y aproximadamente 50±5% de humedad relativa durante 3 días. A continuación, se comprobó visualmente la mortalidad y fecundidad de los áfidos.

35 En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 14, 15, 20, 22, 23, 24 y 25 respectivamente, a 2500 ppm, mostraron un 100% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

#### II.7 Actividad contra Tripsa de Orquídea Vanda (*Dichromothrips corbettii*)

40 Los compuestos activos se formularon como una solución de acetona:agua al 50:50 (v/v). Se agregó tensioactivo (Alkamus EL 620) en una proporción del 0,1% (v/v). Los pétalos de orquídeas Vanda se limpiaron, se lavaron y se secaron al aire antes de pulverizarlos. Los pétalos se sumergieron dentro de la solución de ensayo durante 3 segundos, se secaron al aire, se colocaron dentro de un plástico re-sellable y se inocularon con 20 adultos. Los pétalos tratados se mantuvieron dentro de la cámara de mantenimiento a 28-29°C y una humedad relativa de 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

45 En este ensayo, los compuestos 4, 5, 14 y 19 respectivamente, a 500 ppm, mostraron una mortalidad de al menos el 50% en comparación con los controles no tratados.

#### II.7.1 Actividad en los ensayos hidropónicos contra Afido del melocotonero (*Myzus persicae*)

50 Las plantas de pimiento verde (*Capsicum annuum L.*, variedad "California Wonder") crecieron en el invernadero a partir de la semilla hasta la fase segunda de hoja real (BBCH 12) en Scott's Metro-Mix® 360 (1-2 plantas por 14,52 cm<sup>2</sup> de tiesto). Las hojas de cotiledones se eliminaron y las raíces se lavaron con agua corriente hasta que estuvieron libres de tierra. Las raíces se mantuvieron húmedas bajo una capa de toalla de papel húmeda hasta que todas las plantas se habían preparado.

Se preparó una solución madre de 3.400 ppm de cada compuesto de ensayo usando acetona de grado reactivo como el disolvente. A partir de esta solución madre se prepararon las posteriores diluciones de 100 y 10 ppm con diluciones finales en agua desionizada en botellas de cristal de color ámbar de 100 ml. En cada botella se colocó

una planta de raíz desnuda usando una sección de tapón de espuma a fin de asegurar centralmente el tallo en el cuello de la botella. Las raíces desnudas se sumergieron completamente en las suspensiones de ensayo. Las plantas huéspedes se colocaron en una cámara de crecimiento de plantas bajo iluminación fluorescente GroLux<sup>®</sup> continua (40 W), durante 24 horas a 25±2°C y 20-40% de humedad relativa.

- 5 Después de la exposición de las raíces desnudas a las suspensiones de ensayo, las piezas de plantas de pimiento infestadas con áfido del melocotonero (*Myzus persicae*) se colocaron sobre la parte superior del follaje de ensayo. Se dejó que los insectos se transfirieran desde las hojas huéspedes a fin de lograr una infestación de 40-50 insectos por planta. El ensayo se dejó que transcurriera durante 3 días en la misma cámara de crecimiento tal como se usó previamente. Las comprobaciones incluyen estimados de reducción de la densidad de población de áfidos con relación a la densidad promedio de áfidos sobre las plantas de control no tratadas. Al mismo tiempo, se registraron también las respuestas fitotóxicas de las plantas huéspedes.
- 10

En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 14, 21 y 22 respectivamente, a 100 ppm, mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

#### II.8 Actividad en los ensayos hidropónicos contra Afidos del algodón (*Aphis gossypii*)

- 15 Las plantas de algodón (*Gossypium hirsutum*, variedad "Sure Grow 747") crecieron en el invernadero a partir de la semilla hasta la fase segunda de hoja real (BBCH 12) en Scott's Metro-Mix<sup>®</sup> 360 (1-2 plantas por 14,52 cm<sup>2</sup> de ties-to). Las hojas de cotiledones se eliminaron y las raíces se lavacon agua corriente hasta que estuvieron libres de tierra. Las raíces se mantuvieron húmedas bajo una capa de toalla de papel húmeda hasta que todas las plantas se habían preparado.

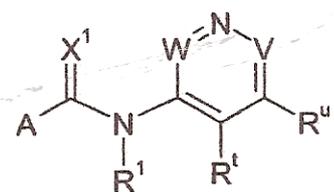
- 20 Se preparó una solución madre de 3.400 ppm de cada compuesto de ensayo usando acetona de grado reactivo como el disolvente. A partir de esta solución madre se prepararon las posteriores diluciones de 100 y 10 ppm con diluciones finales en agua desionizada en botellas de cristal de color ámbar de 100 ml. En cada botella se colocó una planta de raíz desnuda usando una sección de tapón de espuma a fin de asegurar centralmente el tallo en el cuello de la botella. Las raíces desnudas se sumergieron completamente en las suspensiones de ensayo. Las plantas huéspedes se colocaron en una cámara de crecimiento de plantas bajo iluminación fluorescente GroLux<sup>®</sup> continua (40 W), durante 24 horas a 25±2°C y 20-40% de humedad relativa.
- 25

- Después de la exposición de las raíces desnudas a las suspensiones de ensayo, las piezas de plantas de algodón infestadas con áfidos de algodón (*Aphis gossypii*) se colocaron sobre la parte superior del follaje de ensayo. Se dejó que los insectos se transfirieran desde las hojas huéspedes a fin de lograr una infestación de 40-50 insectos por planta. El ensayo se dejó que transcurriera durante 3 días en la misma cámara de crecimiento tal como se usó previamente. Las comprobaciones incluyen estimados de reducción de la densidad de población de áfidos con relación a la densidad promedio de áfidos sobre las plantas de control no tratadas. Al mismo tiempo, se registraron también las respuestas fitotóxicas de las plantas huéspedes.
- 30

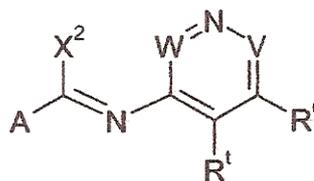
- En este ensayo, los compuestos 1, 4, 5, 7, 12, 14, 21 y 22 respectivamente, a 100 ppm, mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.
- 35

## REIVINDICACIONES

## 1. Compuestos de piridacina de las fórmulas I o II



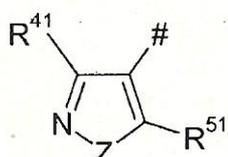
(I)



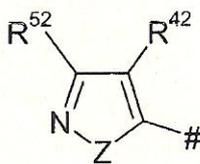
(II)

en las que

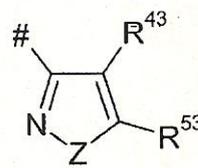
- 5 A es un radical isoxazol o isotiazol de las fórmulas A1, A2 o A3, en las que



A1



A2



A3

# indica un sitio de unión al resto de las fórmulas I ó II, y en las que

Z es O o S;

- 10  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$  y  $R^{51}$  están independientemente entre sí seleccionados entre hidrógeno, halógeno, CN,  $\text{NO}_2$ , alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ , alqueno de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  y alquino de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ , en las que los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden llevar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes  $R^x$ ,

- 15 o en las que  $R^{41}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$  y  $R^{51}$  están además seleccionados entre  $\text{OR}^a$ ,  $\text{C(Y)R}^b$ ,  $\text{C(Y)OR}^c$ ,  $\text{S(O)}_m\text{R}^d$ ,  $\text{NR}^e\text{R}^f$ , heterociclilo, heteroarilo, cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ , cicloalqueno de  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$  y fenilo, en las que los cinco últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes  $R^x$ ;

- 20  $R^{52}$ ,  $R^{53}$  están seleccionados entre hidrógeno, halógeno, CN,  $\text{NO}_2$ , alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ , alqueno de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$  y alquino de  $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ , en las que los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden llevar 1, 2 ó 3 sustituyentes idénticos o diferentes  $R^x$ , o en las que  $R^{52}$ ,  $R^{53}$  están además seleccionados entre  $\text{OR}^a$ ,  $\text{C(Y)R}^b$ ,  $\text{C(Y)OR}^c$ ,  $\text{S(O)}_m\text{R}^d$ ,  $\text{NR}^e\text{R}^f$ , heterociclilo, heteroarilo, cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ , cicloalqueno de  $\text{C}_5\text{-C}_{10}$  y fenilo, en las que los cinco últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes  $R^x$  y en las que

V es  $\text{C(R}^v)$  o N;

- 25 W es  $\text{C(R}^w)$  o N;

con la condición de que si V o W es N;

- 30  $R^t$ ,  $R^u$ ,  $R^v$  y  $R^w$  están independientemente entre sí seleccionados entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquiltio de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquiltio de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquilsulfino de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilsulfino de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , alquilsulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , haloalquilsulfonilo de  $\text{C}_1\text{-C}_3$ , cicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , halocicloalquilo de  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , alqueno de  $\text{C}_2\text{-C}_4$ , haloalqueno de  $\text{C}_2\text{-C}_4$ , alquino de  $\text{C}_2\text{-C}_4$  o alcoxi de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquilo de  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ;

$X^1$  es S, O o  $\text{NR}^{1a}$ ,

en la que  $R^{1a}$  está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ , cicloalquilmetilo de  $C_3-C_{10}$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ , alqueniilo de  $C_2-C_{10}$ , haloalqueniilo de  $C_2-C_{10}$ , alquinilo de  $C_2-C_{10}$ , alcoxi de  $C_1-C_{10}$ -alquilo de  $C_1-C_4$ ,  $OR^a$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$ , heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;

$X^2$  es  $OR^{2a}$ ,  $NR^{2b}R^{2c}$ ,  $S(O)_mR^{2d}$ ,  $R^{2a}$  está seleccionado entre alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alqueniilo de  $C_2-C_4$ , haloalqueniilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$ , heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , y en las que  $R^{2b}$ ,  $R^{2c}$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alqueniilo de  $C_2-C_4$ , haloalqueniilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , alquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilcarbonilo, heteroarilo, hetarilsulfonilo, heterociclilo, heterocicililcarbonilo, heterocicililsulfonilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en las que el anillo en los doce últimos radicales mencionados puede estar no sustituidos o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , o

$R^{2b}$  y  $R^{2c}$  conjuntamente con el átomo de átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un heterociclo saturado o no saturado, de 5 ó 6 átomos, el cual puede portar un heteroátomo adicional seleccionado entre O, S y N como un átomo de anillo y en el que el heterociclo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , y en las que

$R^{2d}$  está seleccionado entre alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alqueniilo de  $C_2-C_4$ , haloalqueniilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en el que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;

$R^1$  es hidrógeno, CN, alquilo de  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo de  $C_1-C_{10}$ , cicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ , alqueniilo de  $C_2-C_{10}$ , haloalqueniilo de  $C_2-C_{10}$ , alquinilo de  $C_2-C_{10}$ , haloalquinilo de  $C_2-C_{10}$ ,  $OR^a$ ,  $C(Y)R^b$ ,  $C(Y)OR^c$ ,  $S(O)_2R^d$ ,  $NR^eR^f$ ,  $C(Y)NR^gR^h$ ,  $S(O)_mNR^eR^f$ ,  $C(Y)NR^iNR^jR^k$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, alquilenilo de  $C_1-C_5-OR^a$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-CN$ , fenil-alquilo de  $C_1-C_5$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_5$ , heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_5$ , cicloalquilo de  $C_3-C_{10}$ -alquilo de  $C_1-C_5$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-C(Y)R^b$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-C(Y)OR^c$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-NR^eR^f$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-C(Y)NR^gR^h$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-S(O)_2NR^d$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-S(O)_mNR^eR^f$ , alquilenilo de  $C_1-C_5-C(Y)NR^eR^f$ , en los que los dieciseis últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes idénticos o diferentes  $R^x$  o  $R^y$ ;

m es 0, 1 ó 2;

Y es O o S;

$R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , cicloalquilometilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alqueniilo de  $C_2-C_4$ , haloalqueniilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;

$R^d$  está seleccionado entre alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , cicloalquilometilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alqueniilo de  $C_2-C_4$ , haloalqueniilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;

- 5  $R^e$ ,  $R^f$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , cicloalquilometilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , alquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilcarbonilo, hetarilsulfonilo, heterociclilo, heterocicililcarbonilo, heterocicilsulfonilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$  y heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los doce últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ; o
- 10  $R^e$  y  $R^f$  conjuntamente con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un heterociclo saturado o no saturado, de 5 ó 6 átomos, el cual puede portar un heteroátomo adicional seleccionado entre O, S y N como un átomo de anillo y en el que el heterociclo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;
- 15  $R^g$ ,  $R^h$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo, hetarilo, heterociclilo, fenil-alquilo de  $C_1-C_4$  y hetaril-alquilo de  $C_1-C_4$ , heterocicilil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo en los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;
- 20  $R^i$  está seleccionado entre hidrógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , cicloalquilometilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , fenilo y fenil-alquilo de  $C_1-C_4$ , en los que el anillo fenilo en los dos últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes, los cuales, independientemente entre sí, están seleccionados entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$  y haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ;
- 25  $R^x$  están seleccionados, independientemente entre sí, entre ciano, nitro, alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ , alquiltio de  $C_1-C_4$ , haloalquiltio de  $C_1-C_4$ , alquilsulfino de  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfino de  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfonilo de  $C_1-C_4$ , alquilcarbonilo de  $C_1-C_{10}$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , heterociclilo de 5 a 7 átomos, fenilo, cicloalcoxi de  $C_3-C_6$ , heterocicililo de 3 a 6 átomos y fenoxi, en el que los seis últimos radicales mencionados puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 ó 5 radicales  $R^y$ ;
- 30  $R^y$  está seleccionado entre halógeno, ciano, nitro, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi de  $C_1-C_4$ , haloalcoxi de  $C_1-C_4$ ,  $S(O)_mR^d$ ,  $S(O)_mNR^eR^f$ , alquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilcarbonilo de  $C_1-C_4$ , alcoxi-carbonilo de  $C_1-C_4$ , haloalcoxycarbonilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$ , halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ , alquenilo de  $C_2-C_4$ , haloalquenilo de  $C_2-C_4$ , alquinilo de  $C_2-C_4$  y alcoxi de  $C_1-C_4$ -alquilo de  $C_1-C_4$ , en las que m es 0, 1 ó 2 y  $R^d$  es tal como se ha definido anteriormente,
- 35 o sus sales, N-óxidos, enantiómeros o diastereómeros de los mismos aceptables agrícola o veterinariamente.
- 40 2. Los compuestos tal como se reivindican en la reivindicación 1, en los que el compuesto de piridacina es un compuesto de la fórmula I.
3. Los compuestos tal como se reivindican en la reivindicación 1 ó 2, en los que  $X^1$  es oxígeno.
4. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en los que  $R^1$  es hidrógeno o alquilo de  $C_1-C_3$ .
- 45 5. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en los que W es  $CR^w$  siendo  $R^w$  hidrógeno.
6. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones precedentes 1 a 5, en los que  $R^t$ ,  $R^u$  y  $R^w$  son hidrógeno.
7. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en los que A es un radical A1.
- 50 8. Los compuestos tal como se reivindican en la reivindicación 7, en los que  $R^{41}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$  y halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ .
9. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 7 a 8, en los que  $R^{51}$  está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de  $C_1-C_4$ , haloalquilo de  $C_1-C_4$ , cicloalquilo de  $C_3-C_6$  y halocicloalquilo de  $C_3-C_6$ .

10. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en los que A es un radical A2.
11. Los compuestos tal como se reivindican en la reivindicación 10, en los que R<sup>42</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.
- 5 12. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 10 a 11, en los que R<sup>52</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.
13. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en los que A es un radical A3.
- 10 14. Los compuestos tal como se reivindican en la reivindicación 13, en los que R<sup>43</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.
15. Los compuestos tal como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 13 a 14, en los que R<sup>53</sup> está seleccionado entre hidrógeno, halógeno, alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> y halocicloalquilo de C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.