

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 472 918**

51 Int. Cl.:

C07D 403/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

A01N 43/58 (2006.01)

A01N 43/76 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **01.07.2010 E 10730150 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.04.2014 EP 2451804**

54 Título: **Compuestos de piridazina para controlar plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

06.07.2009 US 223100 P

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

03.07.2014

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

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

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 472 918 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos de piridazina para controlar plagas de invertebrados

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

Antecedentes de la invención

- 10 Las plagas de invertebrados y, en particular, de artrópodos y de nematodos, destruyen los cultivos en crecimiento y recolectados y atacan a las estructuras de viviendas y comerciales, lo que produce grandes pérdidas económicas en el suministro de alimentos y a los propietarios. Aunque se conoce una gran cantidad de agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas diana de desarrollar resistencias a dichos agentes existe la necesidad constante de
15 agentes nuevos para combatir las plagas de invertebrados tales como insectos, arácnidos y nematodos. Por tanto, es un objeto de la presente invención proporcionar compuestos que tienen una buena actividad pesticida y que muestran un amplio espectro de actividad contra un gran número de diferentes plagas d einvertebrados, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos difíciles de controlar.

El documento EP 0419944 describe ácidos de oxaxol y tiozolescrboxílicos y se menciona su uso como herbicida.

- 20 Los documentos WO 2007/068373, WO 2007/068375 and WO 2007/068377 describen derivados de N-arilo y N-heteroarilamidas derivados de ácidos carboxílicos que comprenden un carbociclo o heterociclo de 5 o 6 miembros. Se ha mencionado que estos compuestos son útiles para controlar los microorganismos.

Los documentos WO 2005/074686 and WO 2005/075411 describen derivados de N-arilamidas que se ha mencionado que son útiles en el control de microorganismos, tales como hongos, bacterias en fitoprotección.

- 25 Los documentos WO 2004/106324, WO 2004/035545 y WO 2005/040152 describen derivados de N-arilo y N-heteroarilamidas derivados de ácidos carboxílicos que comprenden un heterociclo de 5 miembros. Se ha mencionado que estos compuestos son útiles como herbicidas.

El documento WO 2006/074445 describe análogos de heteropirrol biológicamente activos, tales como imidazoles, tiazoles, oxazoles y pirazoles; se mencionan su preparación farmacéutica y sus procedimientos de administración terapéutica.

- 30 Los documentos WO 2003/106427, WO 2004/046129 y JP 2007-77106 describen derivados de N-arilamidas, derivados de ácidos carboxílicos de piridazina. Se ha mencionado que estos compuestos son útiles para combatir las plagas de invertebrados.

- 35 El documento WO 2001/068373, describe derivados de N-arilo y N-heteroarilamidas derivados de ácidos carboxílicos que comprenden un heterociclo de 5 o 6 miembros portador de una función derivada de amida adicional en posición orto. Se ha mencionado que estos compuestos son útiles como insecticidas.

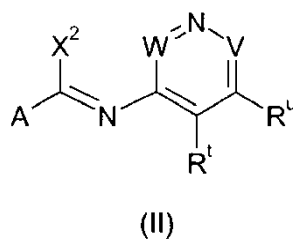
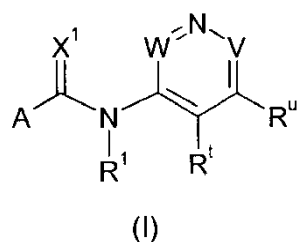
El documento WO 2005/073165 describe derivados de N-arilo o N-heteroarilamidas derivados de ácidos carboxílicos que comprenden fenilo o un heterociclo, en el que el ciclo unido a N pota una función derivada de amida adicional en posición meta. Se ha mencionado que estos compuestos son útiles como insecticidas.

- 40 El documento WO2009/027393 A2 describe N-piridilamidas sustituidas de ácidos carboxílicos de pirazol, que son útiles para controlar las plagas de invertebrados.

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

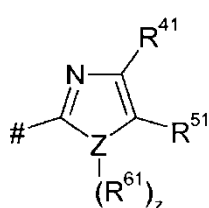
- 45 Se ha descubierto que estos objetivos se pueden conseguir con compuestos de las fórmulas I y II, como se define más adelante, y con sus sales y N-óxidos, en particular sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

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

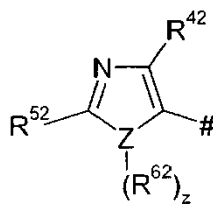


en las que

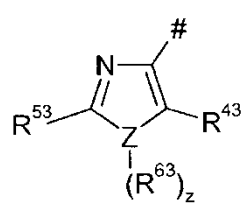
A Es un radical oxazol o tiazol o imidazol de fórmulas A1, A2 o A3 oxazol, tiazol o imidazol, en las que



A1



A2



A3

en las que

indica el sitio de unión al resto de las fórmulas I o II, y en las que

R^{41} , R^{42} , R^{43} y R^{51} se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alqueno $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ y alquino $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, en los que los últimos 3 radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes o en los que R^{41} , R^{42} , R^{43} y R^{51} se seleccionan además de OR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , $\text{S(O)}_m\text{R}^d$, NR^eR^f , heterociclilo, heteroarilo, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$, cicloalqueno $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ y fenilo, en los que los cinco últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, en los que m es 0, 1, 2 y en los que

R^{52} y R^{53} se seleccionan de hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alqueno $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ y alquino $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, en el que los últimos 3 radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes o en los que R^{52} , R^{53} , R^{43} y R^{51} se seleccionan además de OR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , $\text{S(O)}_m\text{R}^d$, NR^eR^f , heterociclilo, heteroarilo, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$, cicloalqueno $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ y fenilo, en los que los cinco últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, en los que m es 0, 1 o 2 y en los que

R^{61} , R^{62} , R^{63}

si están presentes se seleccionan de hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$, alqueno $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ y alquino $\text{C}_2\text{-C}_{10}$, en el que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes o en los que R^{61} , R^{62} , R^{63} si están presentes se seleccionan además de OR^aOR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , $\text{S(O)}_m\text{R}^d$, NR^eR^f , $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, $\text{S(O)}_m\text{NR}^e\text{R}^f$, $\text{C(Y)NR}^i\text{NR}^j\text{R}^k$, heterociclilo, heterociclilo-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_5$, heteroarilo, heteroariloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_5$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_{10}$, cicloalqueno $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ alquilo $\text{C}_1\text{-C}_5$, cicloalqueno $\text{C}_5\text{-C}_{10}$, cicloalqueno $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ alquilo- $\text{C}_1\text{-C}_5$, fenilo, fenil-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_5$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-OR}^a$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-CN}$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-C(Y)R}^b$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-C(Y)OR}^c$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-NR}^e\text{R}^f$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-C(Y)NR}^g\text{R}^h$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-S(O)}_m\text{R}^d$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-S(O)}_m\text{NR}^e\text{R}^f$, alquilen $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-C(Y)NR}^i\text{NR}^j\text{R}^k$, en los que los últimos diecinueve radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x o R^y idénticos o diferentes y en los que m es 0, 1 o 2

Z es O o S para $z = 0$ o Z es N para $z = 1$;

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

W es C(R^w) o N.

con la condición de que V o W sea N;

5 R^t, R^u, R^v y R^w se seleccionan cada uno de forma independiente entre sí de hidrógeno, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₃, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₃, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ o alcoxi C₁-C₄alquilo-C₁-C₄;

10 X¹ es S, O or NR^{1a}, en la que R^{1a} se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₁₀, cialoalquilmetilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₄, OR^a, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, heterocicliil-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos seis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

15 X² es OR^{2a}, NR^{2b}R^{2c}, S(O)_mR^{2d}, en la que m es 0, 1 o 2, en la que

20 R^{2a} se selecciona de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, fenil-alquilo C₁-C₄, hetaril-alquilo C₁-C₄, heterocicliil-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos seis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, y en las que

25 R^{2b}, R^{2c} se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₂-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilo, heteroarilcarbonilo, heteroarilsulfonilo, heterociclilo, heterociclicarbonilo, heterocicliisulfonilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄ y heterocicliil-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos doce radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, o

35 R^{2b} y R^{2c} junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros saturados o insaturados, que pueden portar un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y N como átomo del miembro del anillo y en el que el heterociclo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, de forma independiente uno de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, en los que

40 R^{2d} se selecciona de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, heterocicliil-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos seis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

50 R¹ es hidrógeno, CN, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₃-C₁₀, 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)NRⁱNR^eR^f, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, alquilen C₁-C₅-OR^a, alquilen C₁-C₅-CN, fenil-alquilo C₁-C₅, heteroaril-alquilo C₁-C₅, heterocicliil-alquilo C₁-C₅, cicloalquil C₃-C₁₀-alquilo C₁-C₅, alquilen C₁-C₅-C(Y)NR^b, alquilen C₁-C₅-C(Y)OR^c, alquilen C₁-C₅-NR^eR^f, alquilen C₁-C₅-C(Y)NR^gR^h, alquilen C₁-C₅-S(O)₂R^d, alquilen C₁-C₅-S(O)_mNR^eR^f, alquilen C₁-C₅-C(Y)NRⁱNR^eR^f, en los que los últimos dieciséis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x o R^y idénticos o diferentes y en los que m es 0, 1 o 2;

55 Y es O o S.

R^a, R^b, R^c se seleccionan de forma independiente unos de otros de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo

- 5 C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilmetilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, heterocicli-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos seis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 10 R^d se selecciona de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilmetilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, heterocicli-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos seis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 15 R^e, R^f se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilmetilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₂-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilo, heteroarilcarbonilo, heteroarilsulfonilo, heterociclilo, heterociclicarbonilo, heterociclisulfonilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄ y heterocicli-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos doce radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, o
- 20 R^e y R^f junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros saturados o insaturados, que pueden portar un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y N como átomo del miembro del anillo y en el que el heterociclo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, de forma independiente uno de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 25 R^g, R^h se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, heterocicli-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos seis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 30 Rⁱ se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilmetilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, heterociclilo, fenil-alquilo C₁-C₄, donde el anillo de fenilo en los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 35 R^x se seleccionan cada uno de forma independiente entre sí de ciano, nitro, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, heterociclilo de 5 a 7 miembros, fenilo, cicloalcoxi C₃-C₆, heterociclioxi de 3 a 6 miembros y fenoxi, en los que los últimos 6 radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^y; y en los que
- 40 R^y se selecciona de halógeno, cuano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, S(O)_mR^d, S(O)_mNR^eR^f, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄ y alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄.
- 50

55 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un procedimiento para controlar plagas de invertebrados en el que el procedimiento comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su terreno de cría o una planta, semilla, suelo, área o material o ambiente en el que las plagas crecen o pueden crecer o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios para proteger del ataque o infestación de plagas con una cantidad plaguicidamente eficaz de un compuesto de piridazina de fórmula I o II de acuerdo con la presente invención o una sal o N-óxido del mismo.

Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un procedimiento para proteger el material de

propagación y/o las plantas que crecen a partir del mismo, en el que el procedimiento comprende tratar el material de propagación con una cantidad plaguicidamente eficaz de un compuesto de piridazina de fórmula I o II de acuerdo con la presente invención o una sal agrícolamente aceptable o N-óxido del mismo.

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

10 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un compuesto para usar en un procedimiento para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por parásitos que comprende poner en contacto el animal con una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de fórmula I o II de acuerdo con la presente invención o una sal veterinariamente aceptable o N-óxido del mismo. Poner en contacto el animal con el compuesto I o II, su sal o la composición veterinaria de la invención significa aplicarlos o administrarlos al animal.

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

15 Los radicales unidos a la estructura de los compuestos de fórmula I o II pueden contener uno o más centros de quiralidad. En este caso, los compuestos de fórmula I o II están presentes en forma de enantiómeros o diastereómeros 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 todos los posibles estereoisómeros de los compuestos de fórmula I o II, es decir a enantiómeros o diastereómeros, así como a mezclas de los mismos.

20 Los compuestos de fórmula I o II pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que 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 fórmulas I o II, mezclas de diferentes estados cristalinos del compuesto I o II respectivo, así como sales amorfas o cristalinas del mismo.

25 Las sales de los compuestos de fórmula I o II son preferiblemente sales agrícola y veterinariamente aceptables. Pueden formarse por un procedimiento habitual, por ejemplo haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I o II tiene una funcionalidad básica.

30 Las sales agrícolamente útiles de los compuestos de fórmula I o II abarcan especialmente as sales de adición de ácidos de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efectos adversos sobre la acción de los compuestos de las fórmulas I o II.

35 Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de ácidos alcanoicos C₁-C₄, preferentemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reaccionar un compuesto de fórmulas I y II con un ácido del correspondiente anión, preferentemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

40 Sales veterinariamente aceptables de los compuestos de 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 para uso veterinario. Sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo formadas por compuestos de fórmulas I o II que contienen un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos, y sales de ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético, ácido maleico, por ejemplo las sales de monoácidos o sales de diácido de ácido maleico, ácido dimaleic, ácido fumárico, por ejemplo las sales de monoácidos o sales de diácido de ácido fumárico, ácido difumárico, ácido sulfónico de metano, ácido metano sulfónico, y ácido succínico.

45 El término "N-óxido" incluye cualquier compuesto de fórmulas I o II que tiene al menos un átomo de nitrógeno terciario que se oxida a un resto N-óxido.

50 El término "plaga de invertebrado" como se usa en el presente documento abarca poblaciones animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos, que pueden atacar plantas causando así un daño sustancial a las plantas atacadas, así como ectoparásitos que pueden infestar animales, en particular animales de sangre caliente tales como, por ejemplo, mamíferos o aves, u otros animales superiores tales como reptiles, anfibios o peces, causando así un daño sustancial a los animales infestados.

55 La expresión "material de propagación vegetal" como se usa en el presente documento incluye todas las partes generativas de la planta tales como semillas y material vegetativo vegetal tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que pueden usarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, vástagos y otras partes de plantas. Pueden incluirse también plántulas y plantas jóvenes, que han de transplantarse después de la germinación o después de la emergencia del suelo. Estos materiales de propagación vegetal pueden tratarse profilácticamente con un compuesto de protección vegetal al

plantar o transplantar o antes.

El término “plantas” comprende cualquier tipo de plantas, incluyendo “plantas no cultivadas” y en particular “plantas cultivadas”.

5 El término “plantas no cultivadas” hace referencia a cualquier especie de tipo silvestre o especie relacionada o genero relacionado de una planta cultivada.

10 El término “plantas cultivadas” como se usa en el presente documento incluye plantas que se han modificado por cultivo, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas modificadas genéticamente son plantas cuyo material genético se ha modificado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante de tal modo que en circunstancias naturales no puedan obtenerse fácilmente por cultivo cruzado, mutaciones o recombinación natural. Típicamente, se han integrado uno o más genes en el material genético de una planta modificada genéticamente para mejorar ciertas propiedades de la planta. Dichas modificaciones genéticas incluyen también, pero sin limitación, modificación postraducciona

15 l dirigida de proteína o proteínas (oligopéptidos o polipéptidos), por ejemplo mediante glucosilación o adiciones de polímero tales como restos prenilados, acetilados o farnesilados o restos de PEG (por ejemplo, como se da a conocer en Biotechnol Prog. 2001 Jul-Aug;17(4):720-8., Protein Eng Des Sel. 2004 Jan;17(1):57-66, Nat. Protoc. 2007;2(5):1225-35., Curr. Opin. Chem. Biol. 2006 Oct;10(5):487-91. Epub 2006 Aug 28., Biomaterials. 2001 Mar; 22(5):405-17, Bioconj. Chem. 2005 Jan-Feb;16(1):113-21).

20 El término “plantas cultivadas” como se usa en el presente documento incluye adicionalmente plantas que se han vuelto tolerantes a aplicaciones de clases específicas de herbicidas tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD) ; inhibidores de acetolactato sintasa (ALS) tales como sulfonilureas (véanse, por ejemplo, los documentos US 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 US 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 de enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS) tales como glifosato (véase, por ejemplo, el documento WO 92/00377) ; inhibidores de glutamina sintetasa (GS) tales como glufosinato (véanse, por ejemplo, los documentos EPA-0242236, EP-A-242246) o herbicidas de oxinilo (véase, por ejemplo, el documento US 5.559.024) como resultado de procedimientos convencionales de cultivo o ingeniería genética. Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a herbicidas mediante procedimientos convencionales de cultivo (mutagénesis), por ejemplo, colza de verano Clearfield® (Canola) que es tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox. Se han usado procedimientos de ingeniería genética para volver plantas cultivadas, tales como soja, algodón, maíz, remolachas y colza, tolerantes a herbicidas tales como glifosato y glufosinato, algunas de las cuales están comercialmente disponibles con los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato).

35 El término “plantas cultivadas” como se usa en el presente documento incluye adicionalmente plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente aquellas conocidas del género bacteriano Bacillus, particularmente de Bacillus thuringiensis, tales como endotoxinas δ , por ejemplo, Cr y IA (b), Cr y IA (c), Cr y IF, Cr y IF (a2), Cr y -IIA (b), Cr y IIIA, Cr y IIIB (b1) o Cr y 9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo, Photorhabdus spp. o Xenorhabdus spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnido, toxinas de avispa u otras neurotoxinas específicas de insecto; toxinas producidas por hongos tales como toxinas de Streptomyces, lectinas vegetales tales como lectinas de guisante o cebada; aglutininas; inhibidores de proteínasa tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serinproteínasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosoma (RIP) tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saponina o briodina; enzimas del metabolismo esteroideo tales como 3hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glucosil transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisona o HMG-CoA reductasa; bloqueantes de canal iónico tales como bloqueantes de canales de sodio o calcio; esterasa de hormona juvenil; receptores de hormona diurética (receptores de helicoquinina) ; estilbeno sintasa, bibencilo sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas o toxinas insecticidas se entienden expresamente también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o modificadas de otro modo. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios proteicos (véase, por ejemplo, el documento WO 02/015701). Se dan a conocer ejemplos adicionales de dichas toxinas o plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar dichas toxinas, por ejemplo, en los documentos EP-A 374.753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427529, EP-A 451878, WO 03/018810 y WO 03/052073. Los procedimientos para producir dichas plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por el especialista en la materia y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente confieren a las plantas productoras de estas proteínas protección ante plagas dañinas de ciertos grupos taxonómicos de insectos artrópodos, particularmente escarabajos (coleópteros), moscas (dípteros) y mariposas y polillas (lepidópteros) y ante nematodos parasitarios de plantas (nematodos).

60 El término “plantas cultivadas” como se usa en el presente documento incluye adicionalmente plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de estas plantas ante patógenos bacterianos, víricos o fúngicos. Son ejemplos de dichas proteínas las denominadas “proteínas relacionadas con la patogénesis” (proteínas PR véase, por ejemplo el

documento EP-A 0.392.225), genes de resistencia a enfermedades vegetales (por ejemplo, variedades cultivadas de patata que expresan genes de resistencia que actúan contra *Phytophthora infestans* derivadas de la patata silvestre mexicana *Solanum bulbocastanum*) o lisozima T4 (por ejemplo, variedades cultivadas de patata capaces de sintetizar estas proteínas con resistencia aumentada ante bacterias tales como *Erwinia amylovora*). Los procedimientos para producir dichas plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por el especialista en la materia y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

El término "plantas cultivadas" como se usa en el presente documento incluye adicionalmente plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, de sintetizar una o más proteínas para aumentar la productividad (por ejemplo, la producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteína), la tolerancia a sequía, salinidad u otros factores ambientales limitantes del crecimiento o la tolerancia ante plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o víricos de esas plantas.

El término "plantas cultivadas" como se usa en el presente documento incluye adicionalmente plantas que contienen, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de sustancias contenidas, o nuevas sustancias contenidas, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo, cultivos oleaginosos que producen ácidos grasos omega 3 o ácidos grasos omega 9 de cadena larga promotores de la salud (por ejemplo, colza Nexera®).

El término "plantas cultivadas" como se usa en el presente documento incluye adicionalmente plantas que contienen, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, una cantidad modificada de sustancias contenidas, o nuevas sustancias contenidas, específicamente para mejorar la producción de material bruto, por ejemplo patatas que producen cantidades aumentadas de amilopectina (por ejemplo, patata Amflora®).

Los restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son, como el término halógeno, términos colectivos para listados individuales de los miembros de grupo individuales. El prefijo C_n-C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

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

El término "alquilo" como se usa en el presente documento y en los restos alquilo de alcoxilo, alcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo y alcoxialquilo hace referencia en cada caso a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 10 átomos de carbono, confrecuencia de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono y en particular de 1 a 3 átomos de carbono. 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-dimetilbutil, 1, 2-dimetilbutil, 1,3-dimetilbutil, 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.

El término "alquilenos" (o alcanodiolo) tal como se utiliza en el presente documento en cada caso representa un radical alquilo como se define anteriormente, en el que un átomo de hidrógeno en cualquier posición de la cadena principal de carbono se sustituye por un sitio de unión adicional, formando de esta manera un resto bivalente.

El término "haloalquilo" tal como se utiliza en el presente documento y en los restos haloalquilo de haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilcarbonilo, haloalquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo, denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene generalmente de 1 a 10 átomos de carbono, con frecuencia de 1 a 6 átomos de carbono, en el que los átomos de hidrógeno de este grupo se reemplazan parcialmente o totalmente con átomos de halógeno. Restos haloalquilo preferidos se seleccionan de haloalquilo C₁-C₄, más preferentemente de haloalquilo C₁-C₂, en particular de fluoroalquilo C₁-C₂, tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, y similares.

El término "alcoxi" tal como se utiliza aquí denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que está unido a través de un átomo de oxígeno y tiene por lo general de 1 a 10 átomos de carbono, con frecuencia de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono. Ejemplos de un grupo alcoxi son metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, n-butiloxi, 2-butiloxi, iso-butiloxi, terc-butiloxi, y similares.

El término "haloalcoxi" como se utiliza en el presente documento denota en cada caso un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, con frecuencia de 1 a 4 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 3 átomos de carbono, en el que los átomos de hidrógeno de este grupo se sustituyen parcial o totalmente con átomos de halógeno, en particular átomos de flúor. Restos haloalcoxi preferidos incluyen haloalcoxi C₁-C₄, en particular fluoroalcoxi C₁-C₂, tal 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.

El término "cicloalquilo" tal como se utiliza en el presente documento y en los restos cicloalquilo de cicloalcoxi y

cicloalquilmetilo denota en cada caso un radical cicloalofático mono o bicíclico que tiene por lo general de 3 a 10 átomos de carbono o de 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.

El término "halocicloalquilo", como se usa en el presente documento y en los restos halocicloalquilo de halocicloalquilmetilo denota en cada caso un radical cicloalofático mono o bicíclico que tiene por lo general de 3 a 10 átomos de carbono o de 3 a 6 átomos de carbono, en el que al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 de los átomos de hidrógeno están reemplazados por halógeno, en particular por flúor o cloro. Ejemplos son 1 - y 2 - fluorociclopropilo, 1,2 - , 2,2 - y 2,3-difluorociclopropilo, 1,2,2-trifluorociclopropil, 2,2,3,3-tetrafluorocyclopropyl, 1 - y 2 - clorociclopropil, 1,2 - , 2,2 - y 2,3-diclorociclopropilo, 1,2,2-triclorociclopropilo, 2,2,3,3-tetraclorociclopropilo, 1 - , 2 - y 3 - fluorociclopentilo, 1,2 - , 2, 2 - , 2,3 - , 3,3 - , 3,4 - , 2,5-difluorociclopentilo, 1 - , 2 - y 3-clorociclopentilo, 1,2 - , 2,2 - , 2,3 - , 3,3 - , 3,4 - , 2,5-diclorociclopentilo y similares.

El término "alqueno" tal como se utiliza en el presente documento denota en cada caso un radical hidrocarburo únicamente insaturado que tiene generalmente de 2 a 10, preferentemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo, vinilo, alilo (2-propen-1-ilo), 1-propen-1-ilo, 2-propen-2-ilo, metililo (2-metil-prop-2-en-1-il), 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-ethylprop-2-en-1-ilo y similares.

El término "alquino" tal como se utiliza en el presente documento denota en cada caso un radical hidrocarburo únicamente insaturado que tiene generalmente de 2 a 10, preferentemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo etinilo, propargilo (2-propin-1-il), 1-propin-1-ilo, 1-metil-prop-2-in-1-il), 2-butin-1-ilo, 3-butin-1-ilo, 1-il 1-pentin-1-ilo, 3-pentin-1-ilo, 4-pentin-1-il, 1-metilbut-2-in-1-ilo, 1-etilprop-2-in-1-ilo y similares.

El término "alcoxialquilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un alquilo que comprende generalmente de 1 a 4 átomos de carbono, en el que 1 átomo de carbono lleva un radical alcoxi que comprende por lo general 1 a 10, en particular de 1 a 4, átomos de carbono como se ha definido anteriormente. Ejemplos son CH_2OCH_3 , $\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$, N-propoximetilo, $\text{CH}_2\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$, N-butoximetilo, (1-metilpropoxi)-metilo, (2-metilpropoxi)-metilo, $\text{CH}_2\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, 2 - (metoxi) etilo, 2 - (etoxi) etilo, 2 - (n-propoxi)-etilo, 2 - (1-metil-etoxi)-etilo, 2 - (n-butoxi) etilo, 2 - (1-metilpropoxi) -etilo, 2 - (2-metilpropoxi)-etilo, 2 - (1,1-dimetil-etoxi)-etilo, 2 - (metoxi)-propilo, 2 - (etoxi)-propilo, 2 - (n-propoxi) - propilo, 2 - (1-metil-etoxi)-propilo, 2 - (n-butoxi)-propilo, 2 - (1-metilpropoxi)-propilo, 2 - (2-metilpropoxi)-propilo, 2 - (1,1-dimetil-etoxi) -propilo, 2 - (1,1-dimetil-etoxi) -propilo, 3 - (metoxi)-propilo, 3 - (etoxi)-propilo, 3 - (n-propoxi)-propilo, 3 - (1-metil-etoxi)-propilo, 3 - (n-butoxi)-propilo, 3 - (1-metilpropoxi)-propilo, 3 - (2-metilpropoxi)-propilo, 3 - (1,1-dimetil-etoxi)-propilo, 2 - (metoxi)-butilo, 2 - (etoxi)-butilo, 2 - (n-propoxi)-butilo, 2 - (1-metil-etoxi)-butilo, 2 - (n-butoxi)-butilo, 2 - (1-metilpropoxi)-butilo, 2 - (2-metilpropoxi)-butilo, 2 - (1,1-dimetil-etoxi)-butilo, 3 - (metoxi)-butilo, 3 - (etoxi)-butilo, 3 - (n-propoxi)-butilo, 3 - (1-metil-etoxi)-butilo, 3 - (N -butoxi)-butilo, 3 - (1-metilpropoxi)-butilo, 3 - (2-metilpropoxi)-butilo, 3 - (1,1-dimetil-etoxi)-butilo, 4 - (metoxi)-butilo, 4 - (etoxi) -butilo, 4 - (n-propoxi)-butilo, 4 - (1-metil-etoxi)-butilo, 4 - (n-butoxi)-butilo, 4 - (1-metilpropoxi)-butilo, 4 - (2-metilpropoxi) -butilo, 4 - (1,1-dimetil-etoxi)-butilo y similares.

El término "alquilcarbonilo" (alquilo-C (= O) -), tal como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= alquilcarbonilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquilcarbonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$) unido a través del átomo de carbono del grupo carbonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

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

El término "alquiltio" (también alquilsulfanilo o alquil-S-) "tal como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal ramificada que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= alquiltio $\text{C}_1\text{-C}_{10}$), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquiltio $\text{C}_1\text{-C}_4$) como se define anteriormente, que está unido a través de un átomo de azufre en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquiltio" tal como se usa en el presente documento se refiere a un grupo alquiltio tal como se define anteriormente en el que los átomos de hidrógeno están parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y / o yodo.

El término "alquilsulfonilo" (también alquilsulfoxilo o alquil-S (= O) -), tal como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada como se define anteriormente, que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$) unido a través del átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquilsulfonilo" tal como se usa en el presente documento se refiere a un grupo alquilsulfonilo tal como se define anteriormente en el que los átomos de hidrógeno están parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y / o yodo.

El término "alquilsulfonilo" (también alquil-S (= O)₂-) como se utiliza aquí, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$), como se define anteriormente, que está unido a través del

átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquilsulfonilo" tal como se usa en el presente documento se refiere a un grupo alquilsulfonilo tal como se define anteriormente en el que los átomos de hidrógeno están parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y / o yodo.

- 5 El término "heterociclilo" incluye, en general, radicales heterocíclicos monocíclicos de 5 -, 6 -, 7 - u 8 miembros y radicales heterocíclicos bicíclicos de 8 a 10 miembros, los radicales mono y bicíclicos pueden estar saturados, parcialmente insaturados o insaturados. Los radicales heterocíclicos mono y bicíclicos comprenden por lo general 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros del anillo.

- 10 Ejemplos de radicales heterocíclicos de 5 o 6 miembros saturados o insaturados comprenden anillos heterocíclicos no aromáticos saturados o insaturados, tales como pirrolidinilo, pirazolinilo, pirazolidinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, dioxolenilo, tiolanilo, dihidrotienilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, tiazolinilo, isotiazolinilo, tiazolidinilo, isotiazolidinilo, oxatiolanilo, piperidinilo, piperazinilo, piranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, 1,3- and 1,4-dioxanilo, tiopiranilo, dihidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiazinil y similares. Ejemplos de anillo heterocíclico que también comprenden 1 o 2 grupos carbonilo como miembros de anillo comprenden pirrolidin-2-onilo, pirrolidin-2,5-dionilo, imidazolidin-2-onilo, oxazolidin-2-onilo, tiazolidin-2-onilo y similares.

- 20 El término "hetarilo" incluye radicales heteroaromáticos monocíclicos de 5 o 6 miembros que comprenden como miembros de anillo 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S. Ejemplos de radicales de 5 o 6 miembros incluyen piridilo, es decir 2-, 3-, o 4-piridilo, pirimidinilo, es decir 2-, 4- o 5-pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, es decir 3- o 4-piridazinilo, tienilo, es decir 2- o 3-tienilo, furilo, es decir 2- or 3-furilo, pirrolilo, es decir 2- o 3-pirrolilo, oxazolilo, es decir 2-, 3- o 5-oxazolilo, isoxazolilo, es decir 3-, 4- o 5-isoxazolilo, tiazolilo, es decir 2-, 3- o 5-tiazolilo, isotiazolilo, es decir 3-, 4- o 5-isotiazolilo, pirazolilo, es decir 1-, 3-, 4- o 5-pirazolilo, es decir 1-, 2-, 4- o 5-imidazolilo, oxadiazolilo, por ejemplo 2- o 5-[1,3,4]oxadiazolilo, 4- o 5-(1,2,3-oxadiazol)ilo, 3- o 5-(1,2,4-oxadiazol)ilo, 2- o 5-(1,3,4-tiadiazol)ilo, tiadiazolilo, por ejemplo 2- o 5-(1,3,4-tiadiazol)ilo, 4- o 5-(1,2,3-tiadiazol)ilo, 3- o 5-(1,2,4-tiadiazol)ilo, triazolilo, por ejemplo 1 H-, 2H- o 3H-1,2,3-triazol-4-ilo, 2H-triazol-3-ilo, 1 H-, 2H-, o 4H-1,2,4-triazolil and tetrazolilo, es decir 1 H- o 2H-tetrazolilo.

- 30 El término "hetarilo" también incluye radicales heteroaromáticos bicíclicos de 8 a 10 miembros que comprenden como miembros de anillo 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, en los que un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros se condensa con un anillo fenilo o con un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros. Ejemplos de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros condensado a un anillo fenilo o a un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros incluyen benzofuranilo, benzotienilo, indolilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzoxatiazolilo, benzoxadiazolilo, benzotiadiazolilo, benzoxazinilo, chinolinilo, isochinolinilo, purinilo, 1,8-naftiridilo, pteridilo, pirido[3,2-d]pirimidilo o piridoimidazolilo y similares. Estos radicales hetarilo condensados pueden estar unidos al resto de la molécula a través de cualquier átomo del anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o mediante un átomo de carbono del resto fenilo condensado.

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

- 40 Los términos "heterocicilalquilo" y "hetarilalquilo" hace referencia a heterociclilo o hetarilo, respectivamente, como se ha definido anteriormente, que están unidos a través de un grupo alquilo, en particular un grupo metilo (=heterocicilmetilo o hetarilmetilo, respectivamente), al resto de la molécula.

- 45 Las observaciones realizadas a continuación respecto a realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmulas I o II son válidas por sí mismas así como preefentemente en combinación entre sí Las observaciones realizadas a continuación respecto a realizaciones preferidas de las variables también son válidas en referencia a compuestos de fórmulas I o II así como a usos y procedimientos según la invención y la composición de acuerdo con la presente invención.

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

- 50 Entre los compuestos de fórmula I se da preferencia a los compuestos en los que X¹ es oxígeno. En lo sucesivo en el presente documento, estos compuestos se denominan compuestos de fórmula I'.

- 55 Entre los compuestos de fórmula I se da preferencia adicional a los compuestos en los que R¹ es hidrógeno, CN, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₄, alquilenilo C₁-C₄-CN, OR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c o S(O)₂R^d Preferentemente R¹ is hidrógeno, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, alquilenilo C₁-C₄-CN, heterociclilo-alquilo C₁-C₅, hetarilo alquilo C₁-C₅, alquilenilo C₁-C₅OR^a o cicloalquilo C₃-C₁₀-alquilo C₁-C₅. Más preferentemente R¹ es hidrógeno, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, o alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄. En particular, R¹ es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃.

Otra realización de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula II, a sus sales y a sus N-óxidos. En los compuestos de fórmula II se da preferencia a los compuestos en los que X^2 en la fórmula II es OR^{2a} o SR^{2a} . En estos compuestos R^{2a} es, preferentemente, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 , cicloalquilmetilo C_3-C_6 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_{10} .

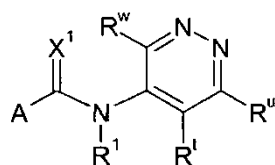
Otra realización de la invención se refiere a compuestos de la fórmula II, en la que X^2 es $NR^{2b}R^{2c}$. En estos compuestos, R^{2b} y R^{2c} se seleccionan, preferentemente, de forma independiente uno de otro, de alquilo C_1-C_6 , cicloalquilmetilo C_3-C_6 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo- C_1-C_{10} o R^{2b} y R^{2c} , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo saturado de 5 o 6 miembros unidos a nitrógeno que puede comprender un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y N, por ejemplo siendo $NR^{2b}R^{2c}$ 1-pirrolidinilo, 1-piperidinilo, 1-piperazinilo, 4-morfolinilo o 4-tiomorfolinilo.

Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia a los compuestos en los que R^u se selecciona de hidrógeno, halógeno,

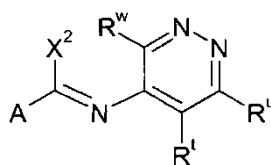
alquilo C_1-C_4 , haloalquilo- C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo alqueno- C_2-C_4 , haloalqueno- C_2-C_4 , alquino- C_2-C_4 y alcoxi- C_1-C_4 .

Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia a los compuestos en los que R^t se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo- C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alqueno- C_2-C_4 , haloalqueno- C_2-C_4 , alquino- C_2-C_4 y alcoxi- C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 .

Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia adicional a los compuestos seleccionados de compuestos sustituidos con 4-piridazina de fórmulas I.A o II.A.



(I.A)

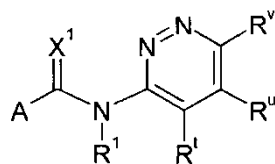


(II.A)

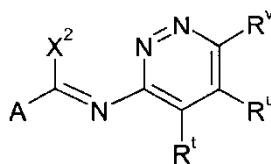
en las que A, X^1 , X^2 , R^1 , R^t , R^u y R^w independientemente una de otra son como se ha definido anteriormente.

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

Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia adicional a los compuestos seleccionados de compuestos sustituidos con 4-piridazina de fórmulas I.B o II.B.



(I.B)



(II.B)

en las que A, X^1 , X^2 , R^1 , R^t , R^u y R^w independientemente una de otra son como se ha definido anteriormente.

Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia adicional a los compuestos en los que V es CR^v , siendo R^v hidrógeno, es decir V es CH.

Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia adicional a los compuestos en los que R^t , R^u and R^v , si están presentes, se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi. Más preferentemente, se da preferencia a compuestos en los que al menos dos de los radicales R^t , R^u , R^v o R^w , si están presentes, son hidrógeno.

Lo más particularmente, se da preferencia a los compuestos en los que R^t , R^u , R^v o R^w , si están presentes, son hidrógeno.

Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmulas I y II, a sus sales y a sus N-óxidos, 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 compuestos de la fórmula I, en los que X^1 , R^1 , R^t , R^u , R^v y R^w son como se ha definido anteriormente y, en particular, tienen uno de los significados preferidos.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A1, se da preferencia a los compuestos en los que R^{41} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ en los que R^{41} se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

Preferentemente, R^{41} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Preferentemente, R^{41} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Más preferentemente, R^{41} se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Lo más preferentemente, R^{41} se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₅. Incluso más preferentemente, R^{41} es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃. En particular, R^{41} es hidrógeno.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A1, se da preferencia adicional a los compuestos en los que R^{51} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ en los que R^{51} se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

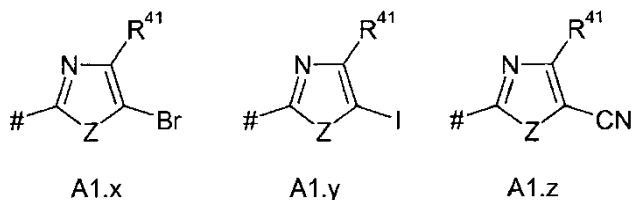
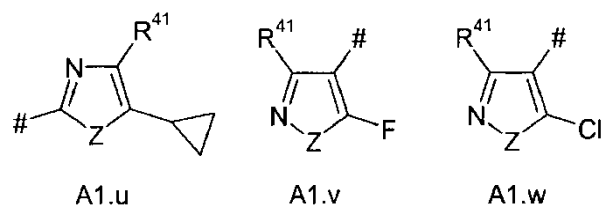
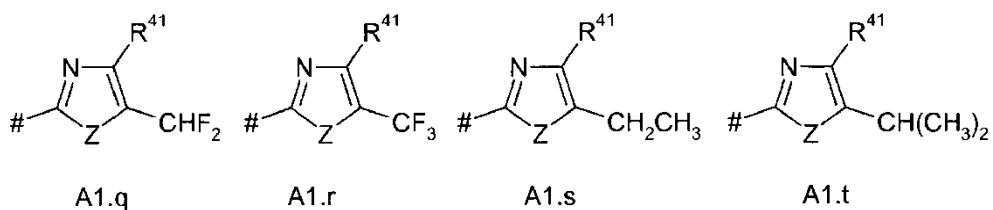
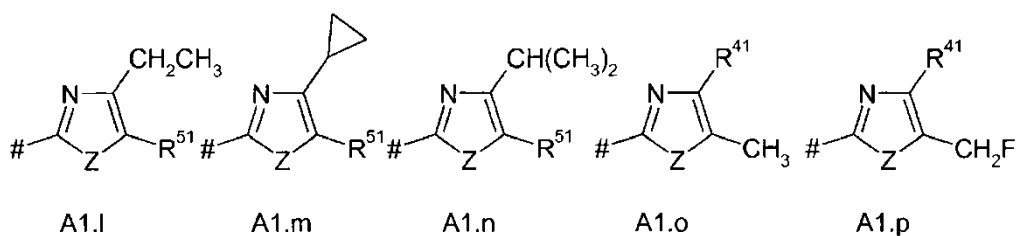
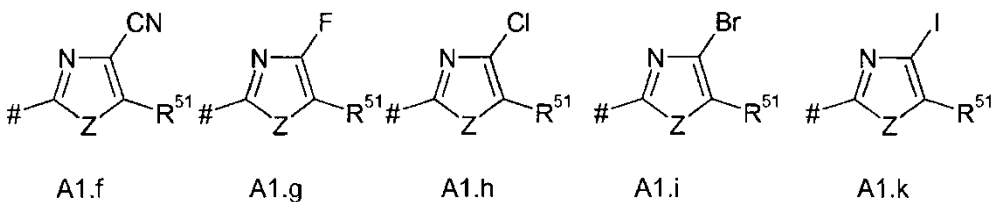
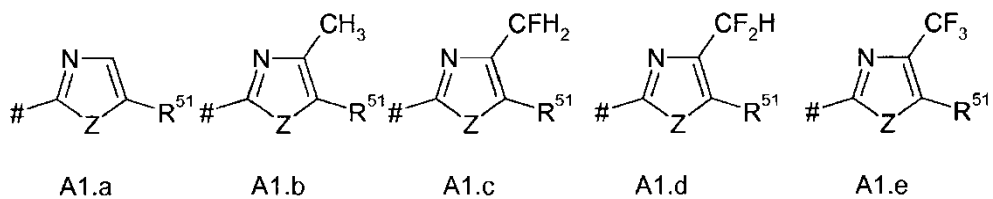
Preferentemente, R^{51} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Preferentemente, R^{51} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Más preferentemente, R^{51} se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Lo más preferentemente, R^{51} se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₅. Incluso más preferentemente, R^{51} es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃. En particular, R^{51} es hidrógeno.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A1, se da preferencia adicional a los compuestos en los que R^{61} , si está presente, se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ en los que R^{61} , si está presente, se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

Preferentemente, R^{61} se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclilo-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄-y alquilo C₁-C₄-CN. Preferentemente, R^{61} se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Más preferentemente, R^{61} , si está presente, hidrógeno, alquilo-C₁-C₄ o haloalquilo-C₁-C₄. En particular, R^{61} , si está presente, es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃.

Ejemplos de radicales A1 adecuados son los radicales de 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 las que Z es O

y R^{51} , R^{41} es un radical como se define en una línea de la tabla A (radicales A1.a1 - A1.a81 a A1.z1 - A1.z81):



Línea	Radical $R^{51}/R^{51}/R^{41}/$ $R^{62}/R^{52}/R^{53}/R^{63}$
1	H
2	CH ₃
3	CH ₂ CH ₃
4	CH ₂ CH ₂ CH ₃

Línea	Radical $R^{51}/R^{51}/R^{41}/$ $R^{62}/R^{52}/R^{53}/R^{63}$
8	C ₆ H ₅
9	4-Cl-C ₆ H ₄
10	4-F-C ₆ H ₄
11	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃

5	CH(CH ₃) ₂
6	CH ₂ CF ₃
7	C(CH ₃) ₃

12	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄
13	2-piridilo
14	5-cloro-2-piridilo

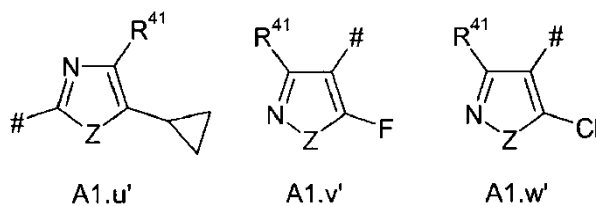
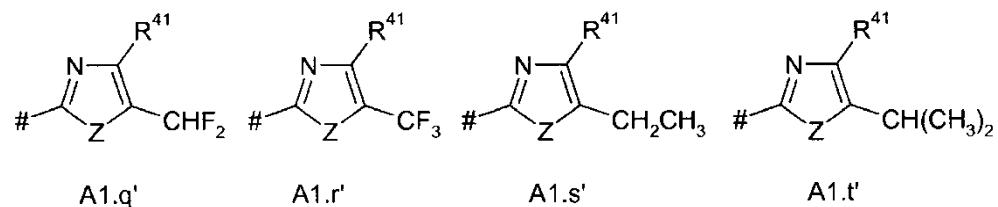
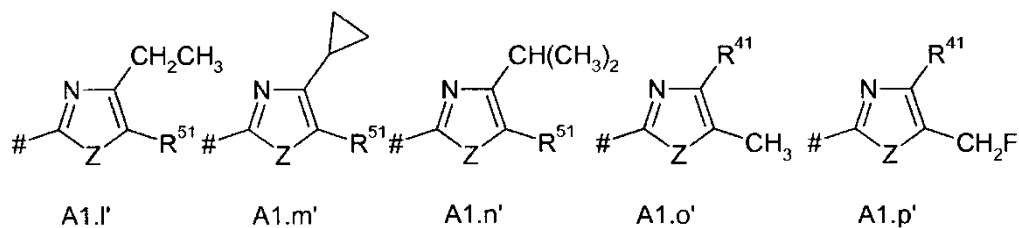
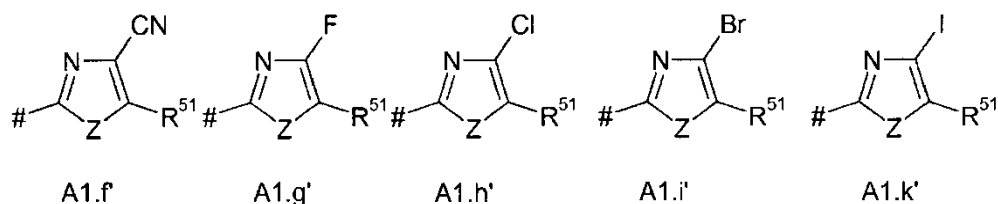
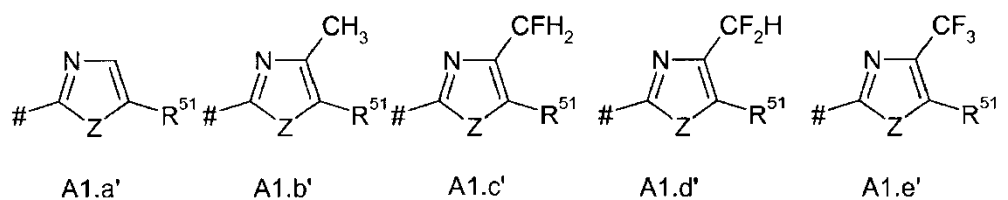
Línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵¹ /R ⁴¹ / R ⁶² /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
15	C ₂ -C ₆ H ₅
16	4-(OCF ₃)-C ₆ H ₄
17	4-(SCF ₃)-C ₆ H ₄
18	4-(OCF ₂)-C ₆ H ₄
19	4-(CF(CF ₃) ₂)-C ₆ H ₄
20	4-(SO ₂ C ₃)-C ₆ H ₄
21	2,6-Cl-4-CF ₃ -C ₆ H ₂
22	3-cloro-5-trifluoro- metilpiridin-2-ilo
23	3-piridilo
24	4-piridilo
25	2-tiazolilo
26	4,5-dimetil-tiazol-2-ilo
27	4-tiazolilo
28	5-tiazolilo
29	4-trifluormetil-tiazol-2-ilo
30	4-metiltiazol-2-ilo
31	4-feniltiazol-2-ilo
32	5-triazolilo
33	3-metil-triazol-5-ilo
34	4-clorobenzilo
35	4-nitro-1-pirazolil-metilo
36	2-imidazolilo
37	4-imidazolilo
38	5-imidazolilo
39	2-oxazolilo
40	4-oxazolilo
41	5-oxazolilo

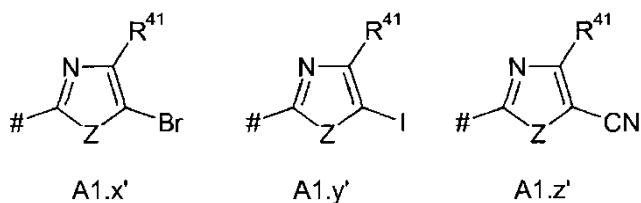
línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵¹ /R ⁴¹ / R ⁶² /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
50	4-NO ₂ -C ₆ H ₄
51	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
52	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
53	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
54	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
55	4-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄
56	3-Cl-C ₆ H ₄
57	3-F-C ₆ H ₄
58	2-F-C ₆ H ₄
59	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
60	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
61	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
62	3-Cl-4-F-C ₆ H ₃
63	3-NO ₂ -C ₆ H ₄
64	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
65	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
66	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
67	2-phenyl-C ₆ H ₄
68	3-phenyl-C ₆ H ₄
69	2-F-4-Cl-C ₆ H ₃
70	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
71	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
72	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃
73	CH ₂ F
74	CHF ₂
75	CF ₃
76	CH ₂ CHF ₂
77	CH ₂ Cl

42	3-isoxazolilo
43	4-isoxazolilo
44	5-isoxazolilo
45	3-metilisoxazol-5-ilo
46	5-metilisoxazol-3-ilo
47	3-pirazolilo
48	[1,3,4]tiadiazol-2-ilo
49	5-tetrazolilo

78	CHCl ₂
79	CCl ₃
80	CH ₂ CHCl ₂
81	CH ₂ CCb
82	Br
83	Cl
84	F

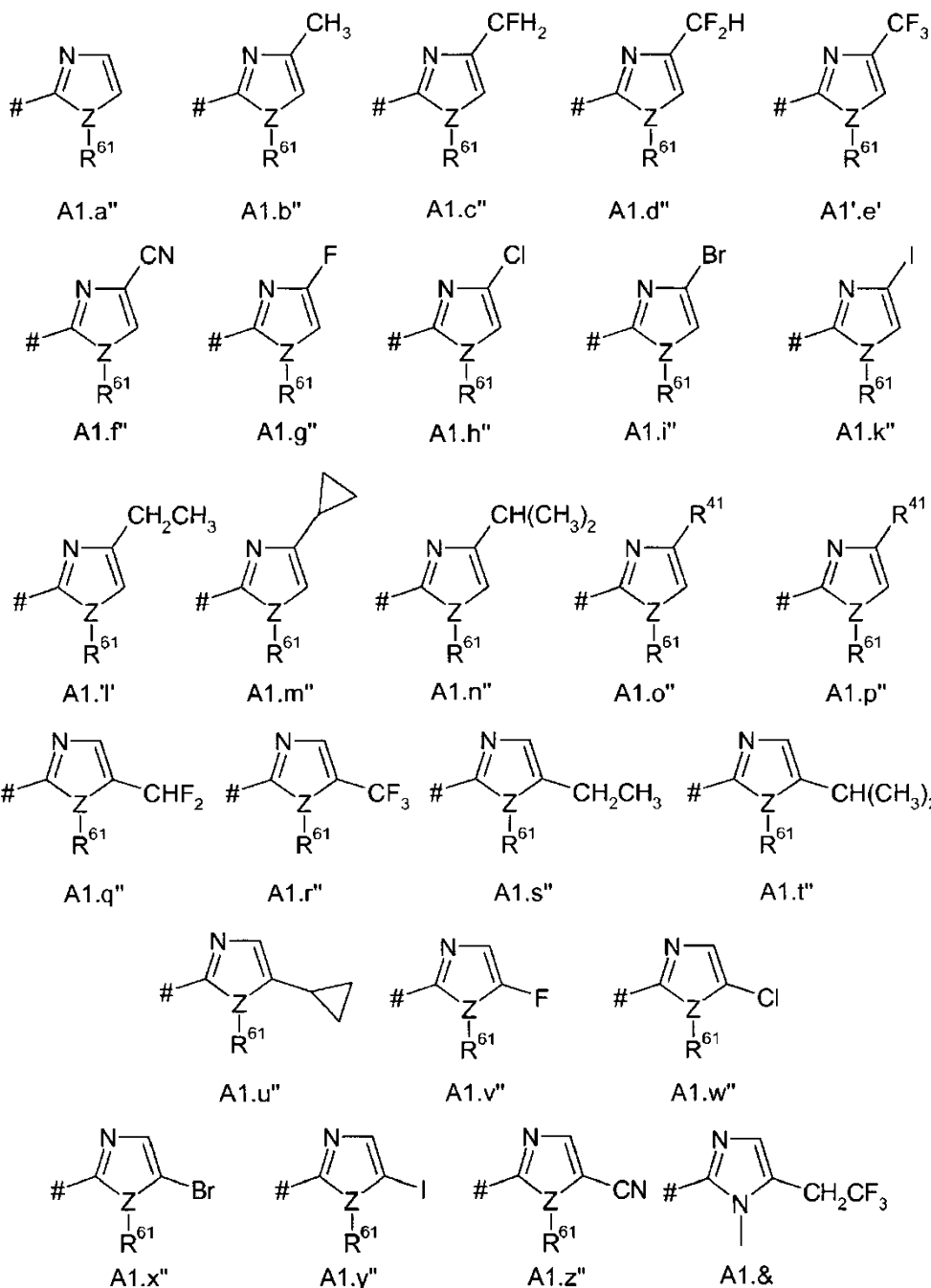
Análogo a las estructuras indicadas anteriormente, ejemplos de radicales A1 adecuados son los radicales de fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d, A1.e, A1.f, A1.g, A1.h, A1.i, A1.k, A1.l, A1.m, A1.n, A1.o, A1.p, A1.q, A1.r, A1.s, A1.t, A1.u, A1.v, A1.w, A1.x, A1.y y A1.z, en las que Z es O y R⁵¹, R⁴¹ es un radical como se define en una línea de la tabla A (radicales A1.a' 1 - A1.a' 81 a A1.z' 1-A1.z' 81):





Análogo a las estructuras indicadas anteriormente, ejemplos de radicales A1 adecuados son los radicales de fórmulas A1.a' ' A1.b'', A1.c'', A1.d'', A1.e'', A1.f'', A1.g'', A1.h'', A1.i'', A1.k'', A1.l'', AA1.m'', A1.n'', A1.o'', A1.p'', AA1.q'', A1.r'', A1.s'', A1.t'', A1.u'', A1.v'', A1.w'', A1.x'', A1.y'' and A1.z'', en las que Z es N, R^{61} is H, y R^{61} es un como se define en una línea de la Tabla A (radicales A1.a'' 1-A1.a'' 81 a A1.z'' 1-A1.z'' 81): Un ejemplo adicional del radical A 1 es el radical numerado A1.&

5



10

Una realización adicional preferida de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmulas I y II, a sus sales y a sus N-óxidos, y a los procedimientos y usos de dichos compuestos, en los que A es un radical A2. Entre los compuestos de las fórmulas I y II, en las que A es un radical A2, se da preferencia a compuestos de la fórmulas I o II, en las que X¹, R¹, R², R^u, R^v y R^w son como se ha definido anteriormente y, en particular, tienen uno de los significados preferidos.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A2, se da preferencia a los compuestos en los que R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ o en los que R⁴² se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A2, se da preferencia a los compuestos en los que R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₃ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ o en los que R⁴² se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃ y haloalquilsulfonilo C₁-C₃. Preferentemente, R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃; en particular, R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆.

Preferentemente, R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Preferentemente, R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Más preferentemente, R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Lo más preferentemente, R⁴² se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃ y cicloalquilo C₃-C₅. Incluso más preferentemente, R⁴² es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃. En particular, R⁴² es hidrógeno.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A2, se da preferencia adicional a los compuestos en los que R⁵² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ o en los que R⁵² se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

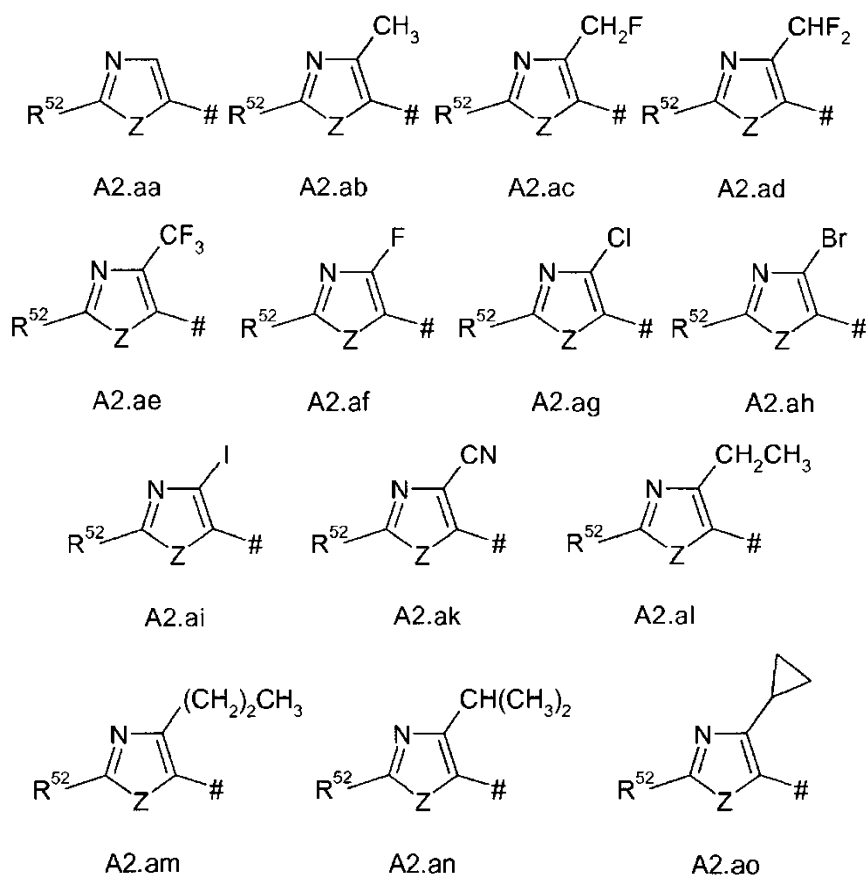
Preferentemente, R⁵² se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Preferentemente, R⁵² se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Lo más preferentemente, R⁵² se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃ y cicloalquilo C₃-C₅. Más preferentemente, R⁵² es hidrógeno, alquilo-C₁-C₄ o haloalquilo-C₁-C₄. Incluso más preferentemente, R⁵² es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃. En particular, R⁵² es hidrógeno.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A2, se da preferencia adicional a los compuestos en los que R⁶², si está presente, se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ o en los que R⁶², si está presente, se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales

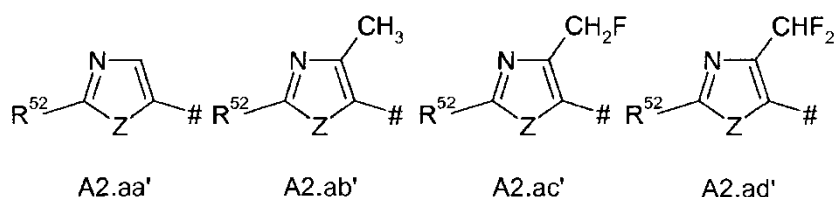
mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

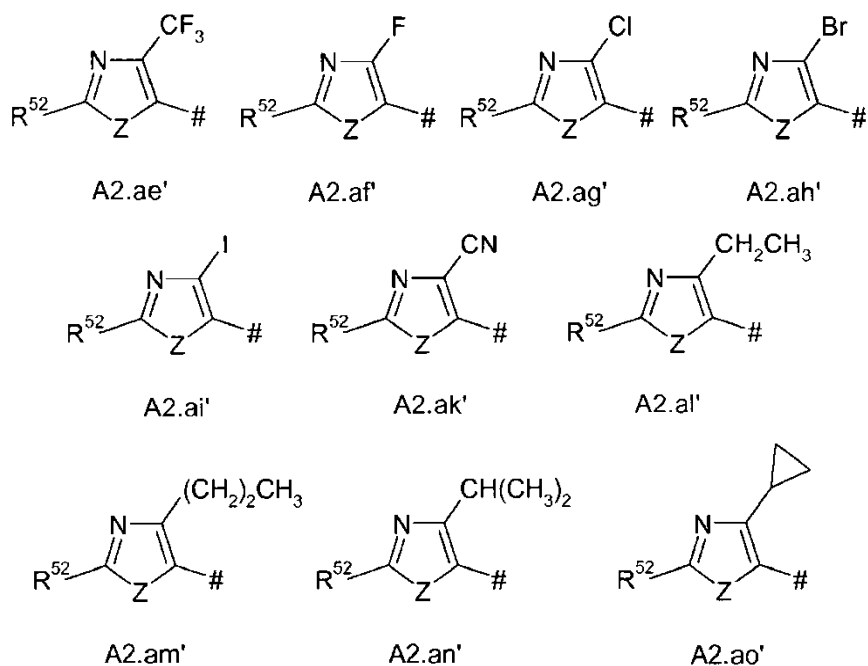
Preferentemente, R⁶² se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclilo-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄-y alquilo C₁-C₄-CN. Preferentemente, R⁶², si está presente, se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Más preferentemente, R⁶², si está presente, se selecciona de hidrógeno, CN, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. En particular, R⁶², si está presente, es hidrógeno.

Ejemplos de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2A2.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 las que Z es O y R⁵² es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A2.aa1-A2.aa81 a A2.ao1 - A2.ao81):



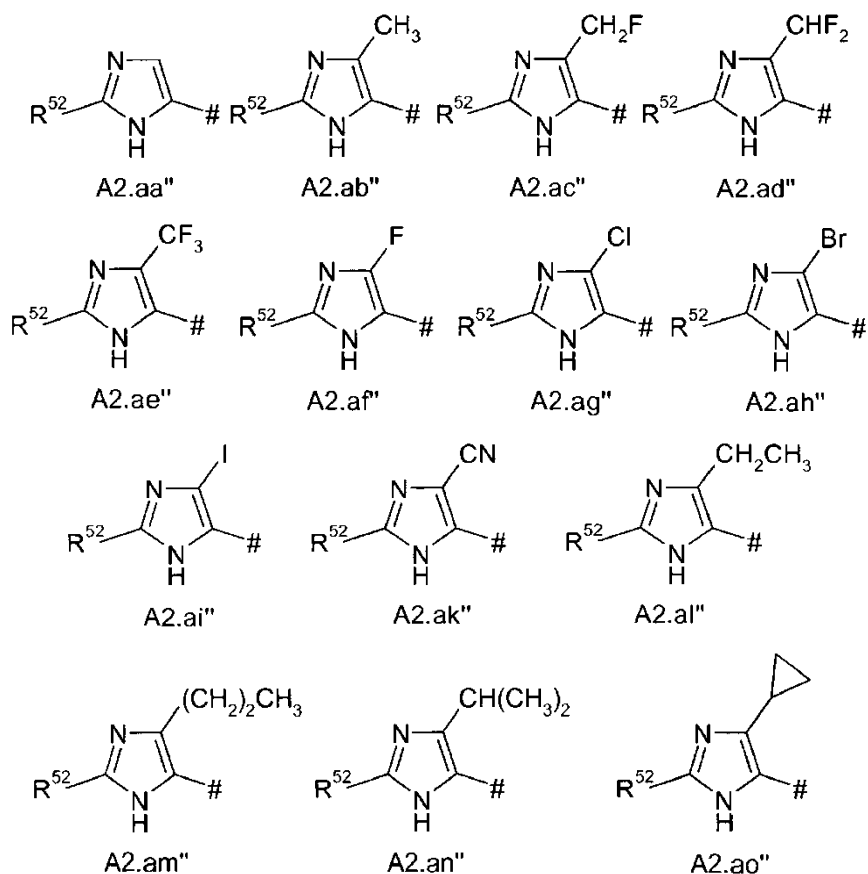
Análogos a las estructuras indicadas anteriormente, ejemplos de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.aa', A2.ab', A2.ac', A2.ad', A2.ae', A2.af', A2.ag', A2.ah', A2.ai', A2.ak', A2.al', A2.am', A2.an' y A2.ao', en las que Z es S y R⁵² es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A2.aa' 1 - A2.aa' 81 a A2.ao' 1 - A2.ao' 81).





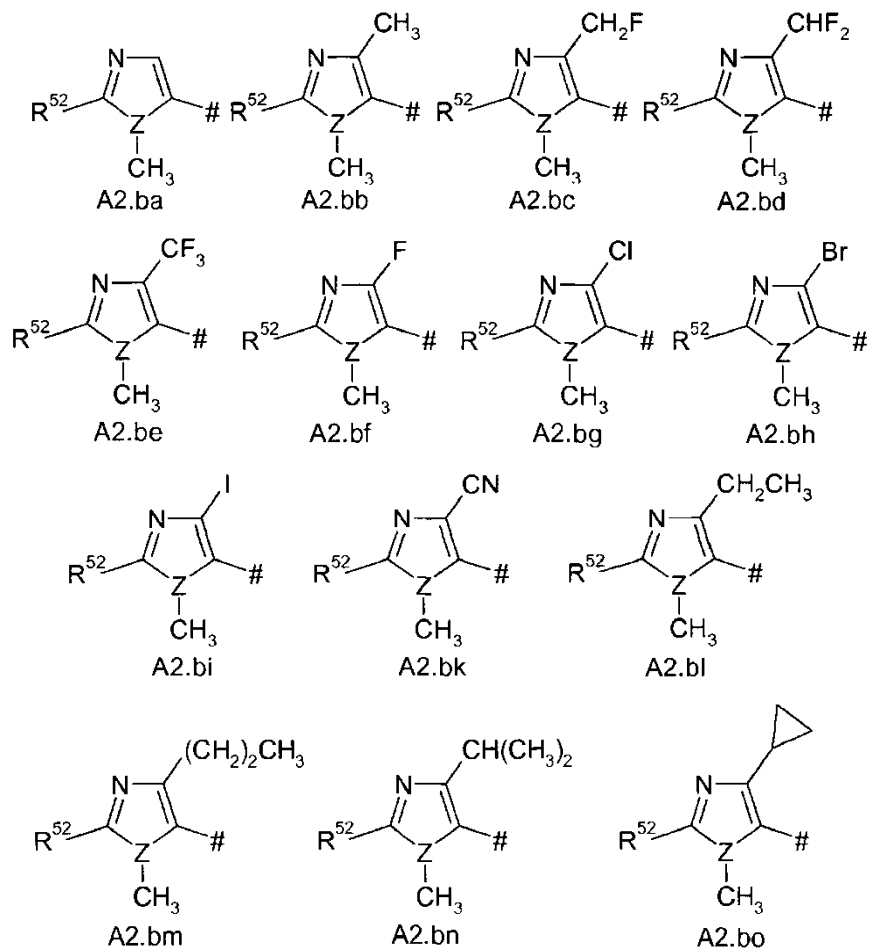
- 5 Análogos a las estructuras indicadas anteriormente, ejemplos de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.aa", A2.ab", A2.ac", A2.ad", A2.ae", A2.af", A2.ag", A2.ah", A2.ai", A2.ak", A2.al", A2.am", A2.an" y A2.ao", en las que Z es NH y R^{52} es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A2.aa" 1 - A2.aa" 81 a A2.ao" 1 - A2.ao" 81).

10



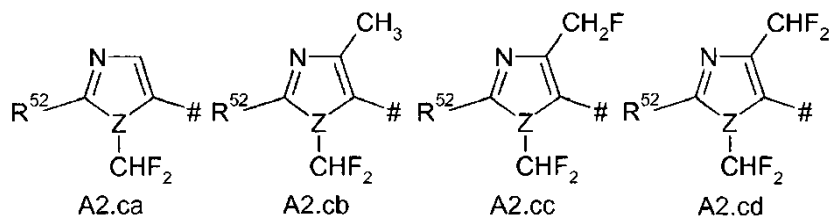
Otros ejemplos de radicales A2 adecuados son los restos de las fórmulas A2.ba, A2.bb, A2.bc, A2.bd, A2.be, A2.bf, A2.bg, A2.bh, A2.bi, A2.bk, A2.bl, A2.bm, A2.bn y A2.bo, en la que Z es N, R^{52} es CH_3 y R^{52} es un radical como se define en una línea de la tabla A (radicales A2.ba1-A2.ba81 a A2.bo1 - A2.bo81):

5

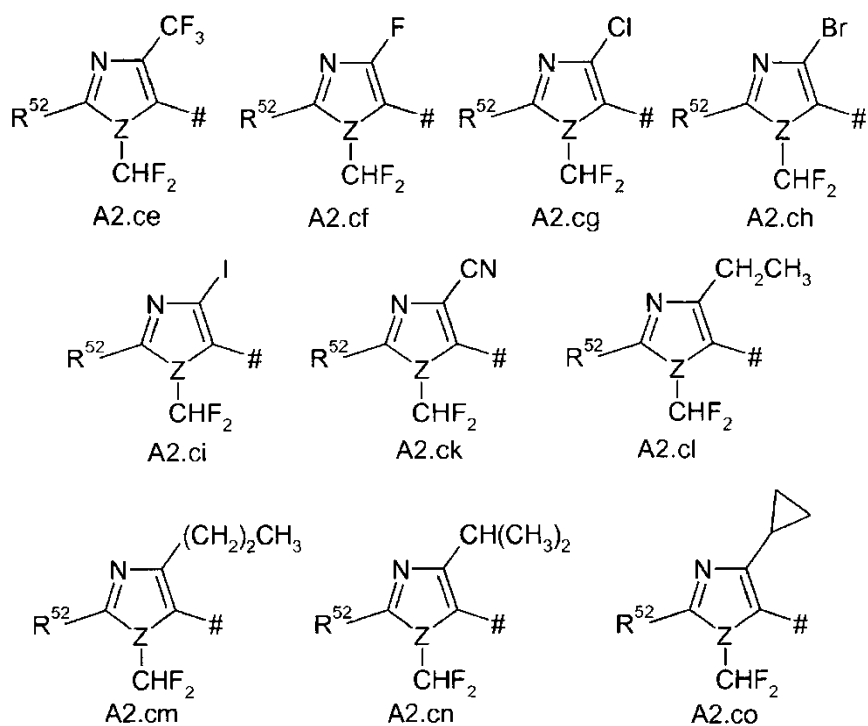


10

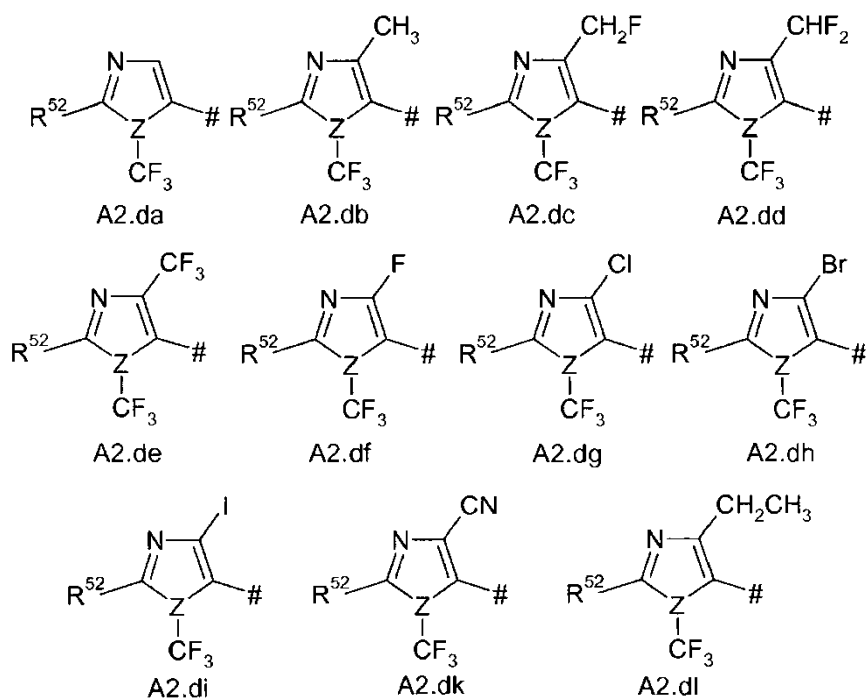
Otros ejemplos de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.ca, A2.cb, A2.cc, A2.cd, A2.ce, A2.cf, A2.cg, A2.ch, A2.ci, A2.cj, A2.cl, A2.cm, A2.cn y A2.co, en la que Z es N, R^{52} es CHF_2 y R^{52} es un radical como se define en una línea de la tabla A (radicales A2.ca1 - A2.ca81 a A2.co1 - A2.co81):

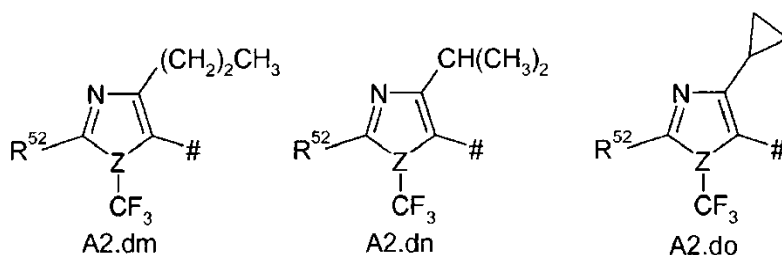


15

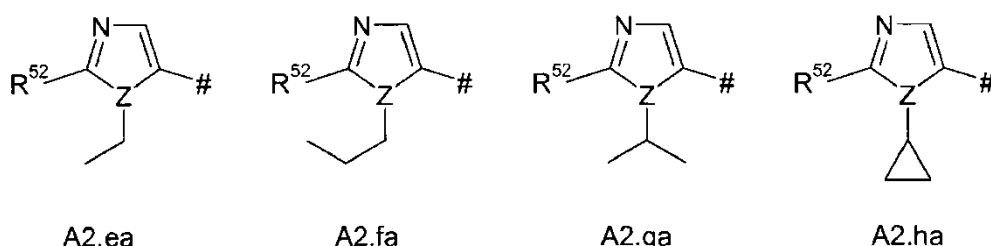


- 5 Otros ejemplos de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.da, A2.db, A2.dc, A2.dd, A2.de, A2.df, A2.dg, A2.dh, A2.di, A2.dk, A2.dl, A2.dm, A2.dn y A2.do, en la que Z es N, R⁶² es CF₃ y R⁵² es un radical como se define en una línea de la tabla A (radicales A2.da1-A2.da81 a A2.do1 - A2.do81):





Otros ejemplos de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.ea, A2.fa, A2.ga, A2.ha, en las que Z es N, R⁵² es como se define en una línea de la tabla A (radicales A2.ea1 - A2.ea81, A2.fa1 - A2.fa81, A2.ga1 - A2.ga81, y A2.ha1 - A2.ha81):



Una realización adicional preferida de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmulas I y II, a sus sales y a sus N-óxidos, y a los procedimientos y usos de dichos compuestos, en los que A es un radical A3. Entre los compuestos de las fórmulas I y II, en las que A es un radical A3, se da preferencia a compuestos de las fórmulas I o II, en las que X¹, R¹, R^t, R^u, R^v y R^w son como se ha definido anteriormente y, en particular, tienen uno de los significados preferidos.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A3, se da preferencia a los compuestos en los que R⁴³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ o en los que R⁴³ se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

Preferentemente, R⁴³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Más preferentemente, R⁴³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Más preferentemente, R⁴³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Lo más preferentemente, R⁴³ se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Incluso más preferentemente, R⁴³ es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃. En particular, R⁴³ es hidrógeno.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A3, se da preferencia adicional a los compuestos en los que R⁵³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ o en los que R⁵³ se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

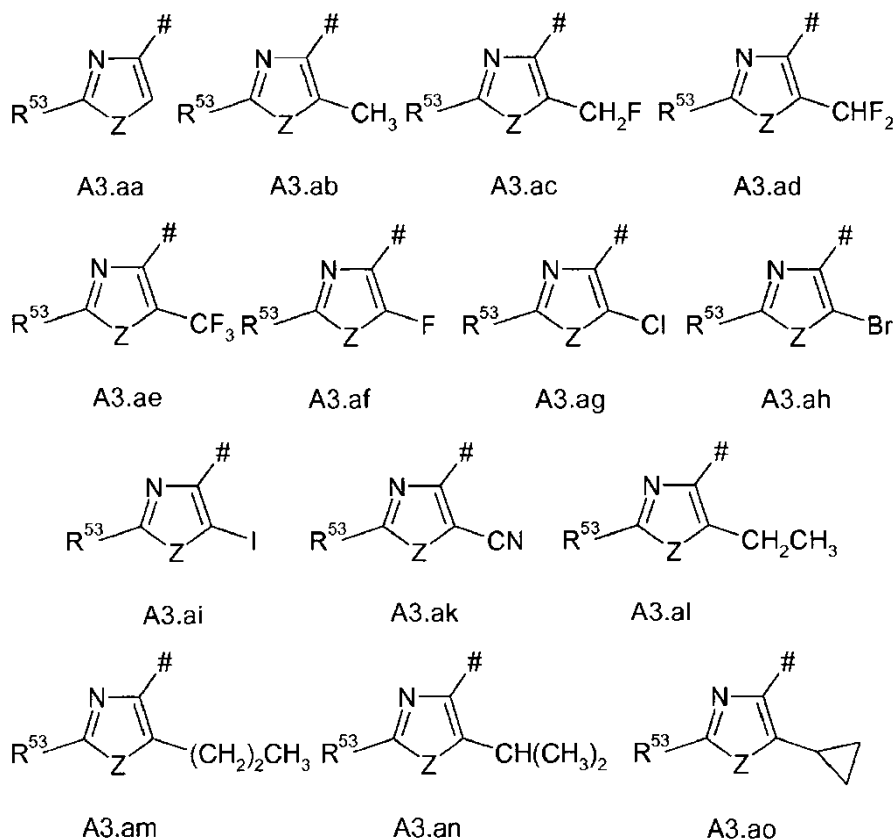
Preferentemente, R⁵³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆,

halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Preferentemente, R⁵³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Más preferentemente, R⁵³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆. Lo más preferentemente, R⁵³ se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃ y cicloalquilo C₃-C₅. Incluso más preferentemente, R⁵³ es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃. En particular, R⁵³ es hidrógeno.

Entre los compuestos de fórmulas I y II, en los que A es A3, se da preferencia adicional a los compuestos en los que R⁶³, si está presente, se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₄ y alqueno C₂-C₁₀, en los que los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo, fenilo y fenoxi, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, C₁-C₄-alquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo C₁-C₄ en los que R⁶³, si está presente, se selecciona adicionalmente de cicloalquilo C₃-C₆, hetarilo C₅-C₆ y fenilo, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo C₁-C₄.

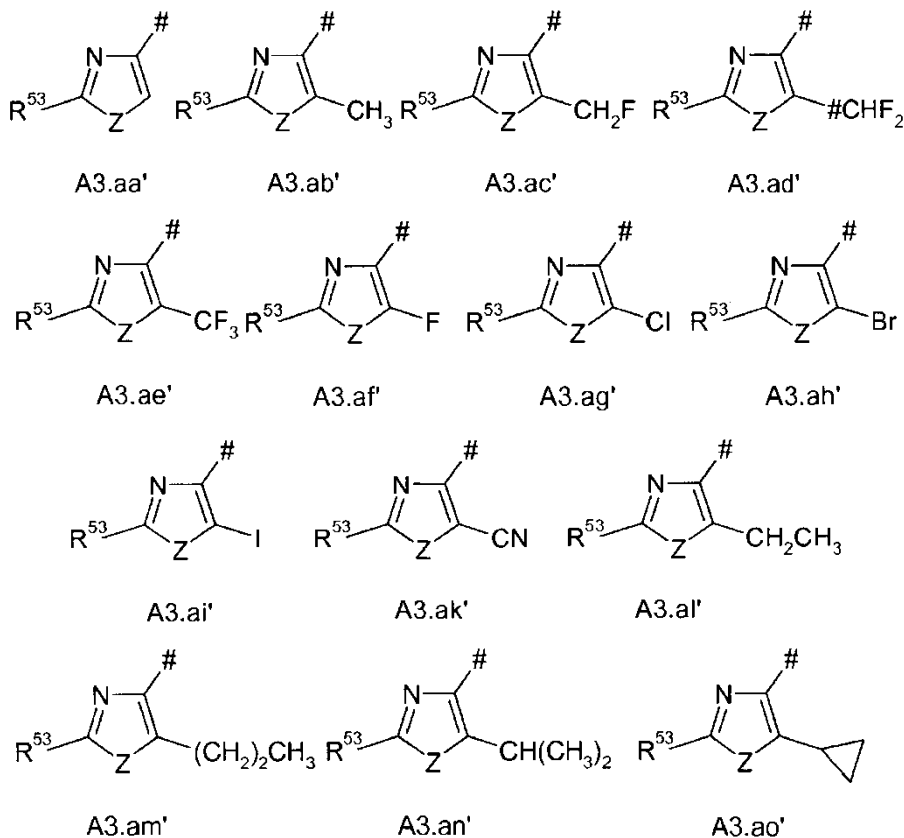
Preferentemente, R⁶³ se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclilo-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄-y alquilo C₁-C₄-CN. Preferentemente, R⁶³, si está presente, se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ y fenilo, en el que fenilo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄. Más preferentemente, R⁶³, si está presente, hidrógeno, alquilo-C₁-C₄ o haloalquilo-C₁-C₄. En particular, R⁶³, si está presente, es hidrógeno o alquilo-C₁-C₃.

Ejemplos de radicales A3 adecuados son los radicales de las fórmulas A3.aa, A3.ab, A3.ac, A3.ad, A3.ae, A3.af, A3.ag, A3.ah, A3.ai, A3.ak, A3.al, A3.am, A3.an y A3.ao, en las que Z es O y R⁵³ es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.aa1-A3.aa81 a A3.ao1 - A3.ao81):

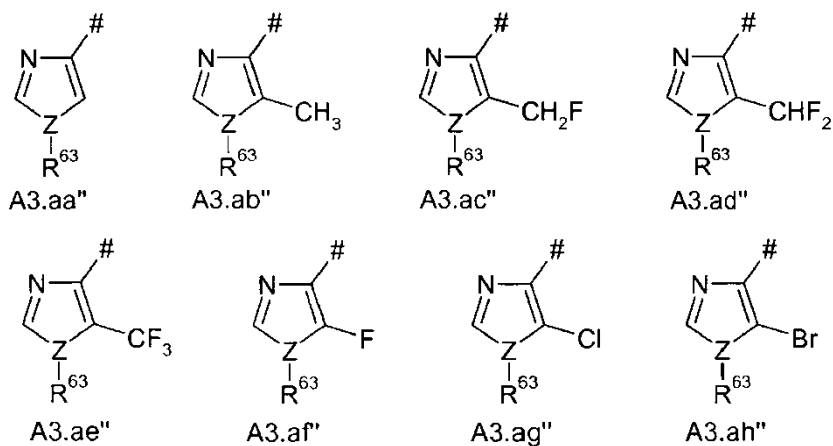


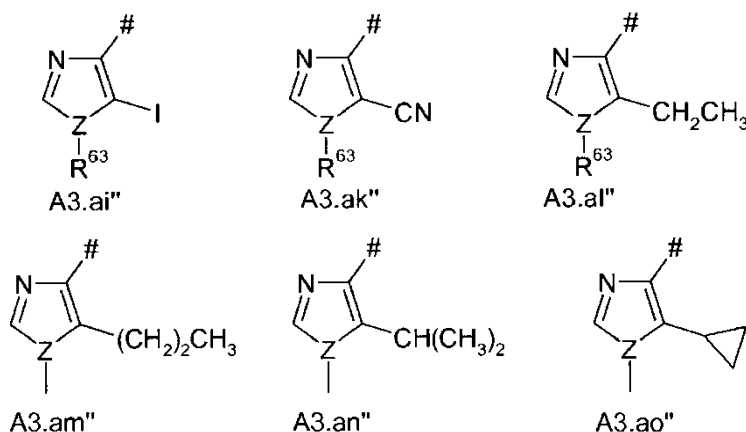
Análogos a las estructuras indicadas anteriormente, ejemplos de radicales A3 adecuados son los radicales de las fórmulas A3.aa', A3.ab', A3.ac', A3.ad', A3.ae', A3.af', A3.ag', A3.ah', A3.ai', A3.ak', A3.al', A3.am', A3.an' y A3.ao',

en las que Z es S y R^{53} es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.aa' 1 - A3.aa' 81 a A3.ao' 1 - A3.ao' 81).

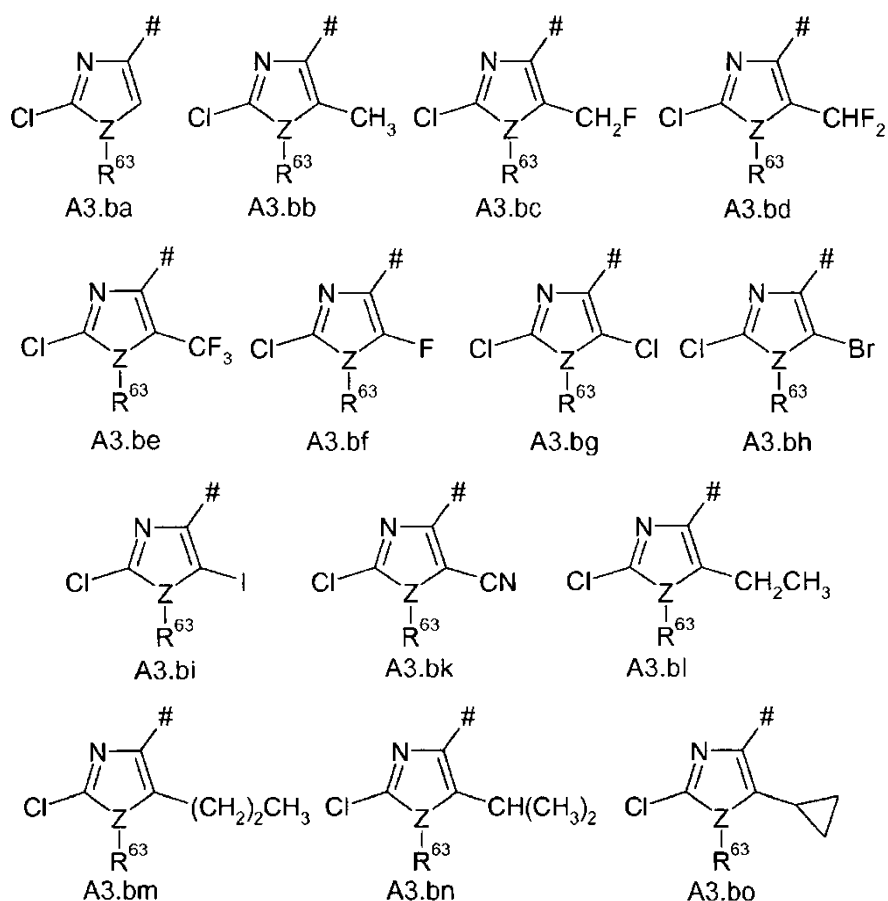


Otros ejemplos de radicales A3 adecuados son los radicales de las fórmulas A3.aa'', A3.ab'', A3.ac'', A3.ad'', A3.ae'', A3.af'', A3.ag'', A3.ah'', A3.ak'', A3.al'', A3.am'', A3.an'' y A3.ao'', en las que Z es N y R^{53} es H y R^{63} es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.aa'' 1-A3.aa'' 81 a A3.ao'' 1 - A3.ao'' 81).





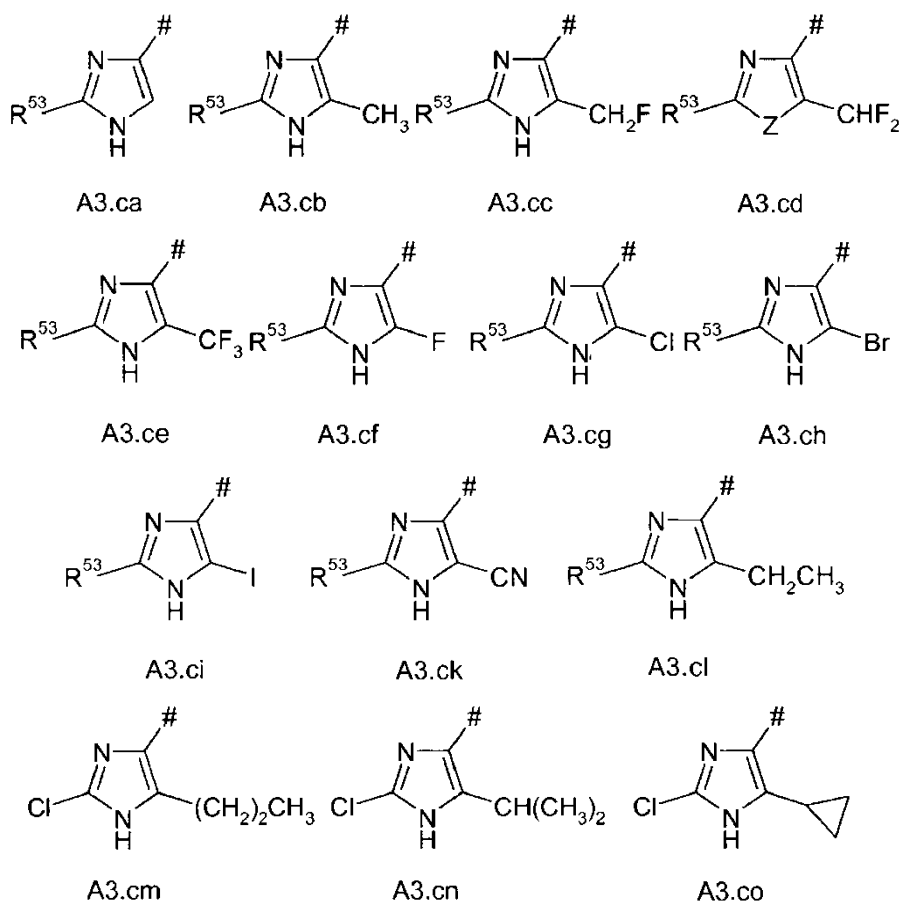
5 Otros ejemplos de radicales A3 adecuados son los radicales de las fórmulas A3A3.ba, A3.bb, A3.bc, A3.bd, A3.be, A3.bf, A3.bg, A3.bh, A3.bi, A3.bk, A3.bl, A3.bm, A3.bn y A3.bo, en la que Z es N, R⁶³ es Cl y R⁵³ es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.ba1 - A3.ba81 a A3.bo1 - A3.bo81):



10

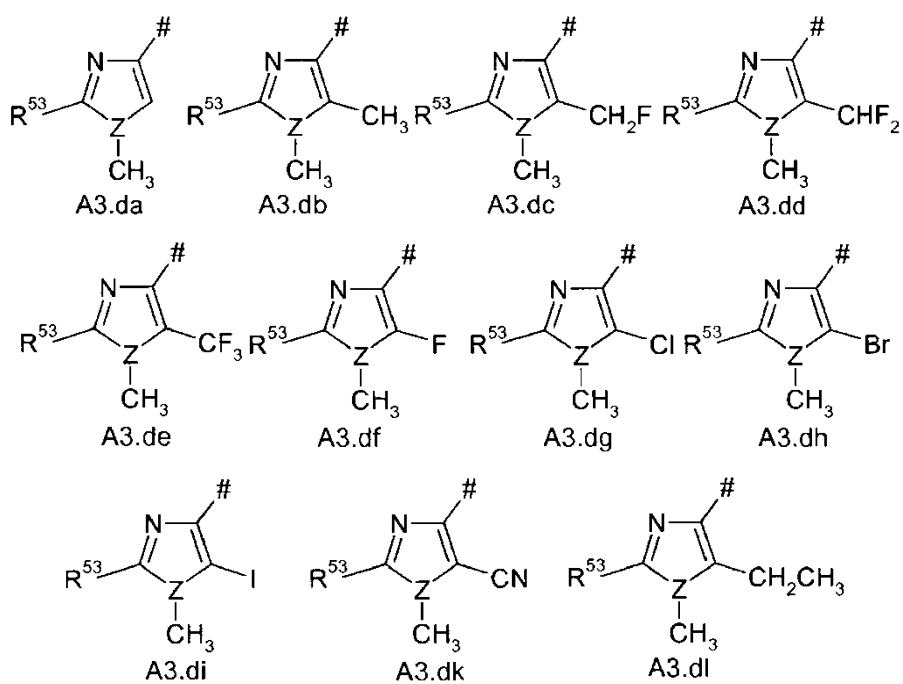
15

Otros ejemplos de radicales A3 adecuados son los restos de las fórmulas A3.ca, A3.cb, A3.cc, A3.cd, A3.ce, A3.cf, A3.cg, A3.ch, A3.ci, A3.ck, A3.cl, A3.cm, A3.cn y A3.co, en las que R⁵³ es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.ca1 - A3.ca81 a A3.co1 - A3.co81):

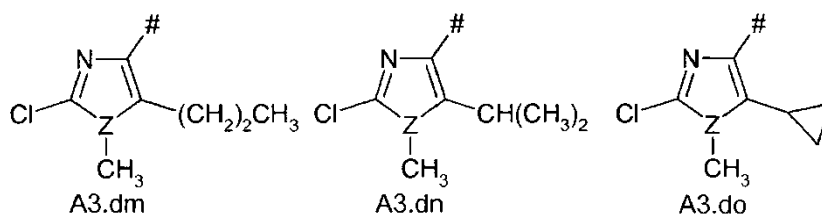


5

Otros ejemplos de radicales A3 adecuados son los restos de las fórmulas A3.da, A3.db, A3.dc, A3.dd, A3.de, A3.df, A3.dg, A3.dh, A3.di, A3.dk, A3.dl, A3.dm, A3.dn y A3.do, en la que Z es N, R⁵³ es CH₃ y R⁵³ es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.da1 - A3.da81 a A3.do1 - A3.do81):

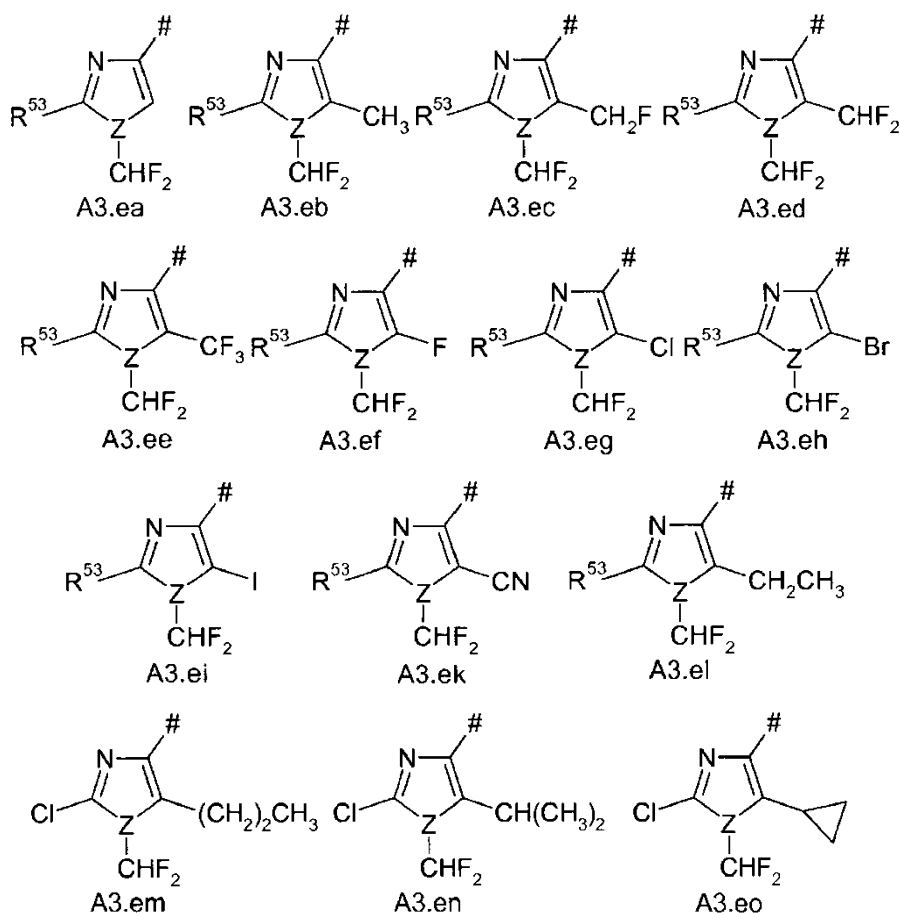


10



Otros ejemplos de radicales A3 adecuados son los restos de las fórmulas A3.ea, A3.eb, A3.ec, A3.ed, A3.ee, A3.ef, A3.eg, A3.eh, A3.ei, A3.ek, A3.el, A3.em, A3.en y A3.eo, en la que Z es N, R⁵³ es CHF₂ y R⁵³ es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.ea1 - A3.ea81 a A3.eo1 - A3.eo81):

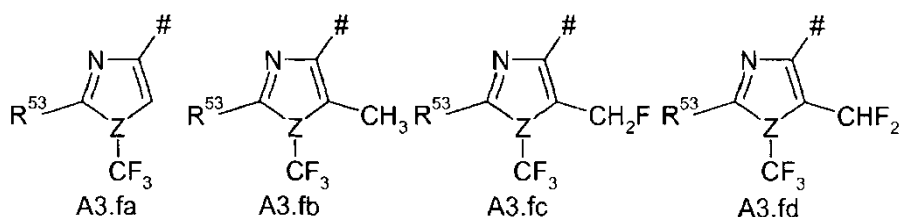
5

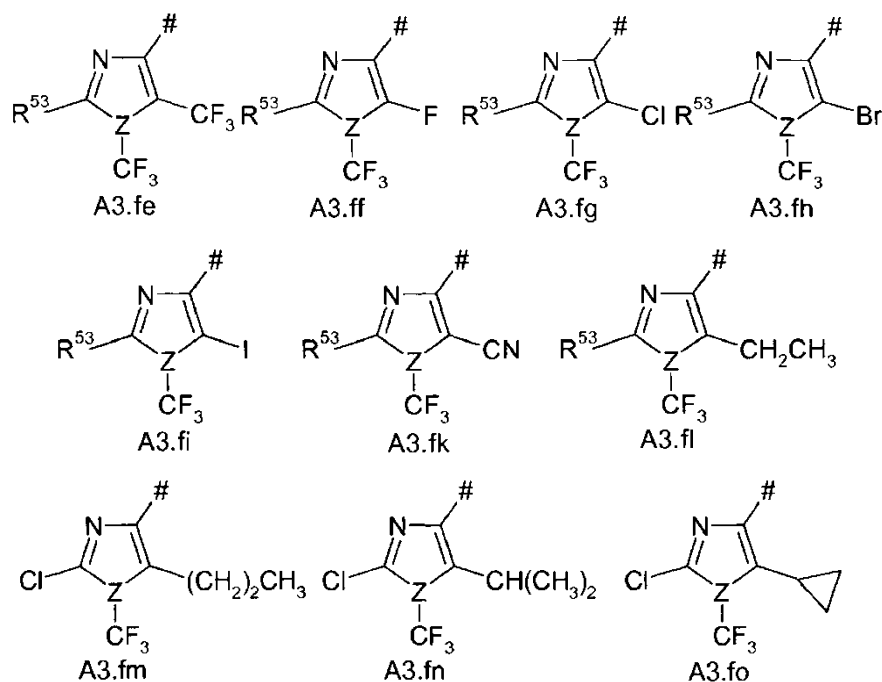


10

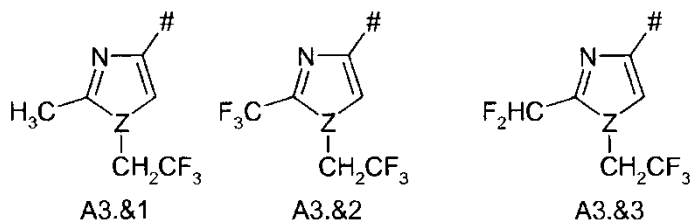
Otros ejemplos de radicales A3 adecuados son los restos de las fórmulas A3.fa, A3.fb, A3.fc, A3.fd, A3.fe, A3.ff, A3.fg, A3.fh, A3.fi, A3.fk, A3.fl, A3.fm, A3.fn y A3.fo, en la que Z es N, R⁵³ es CF₃ y R⁵³ es un radical como se define en una fila de la tabla A (radicales A3.fa1 - A3.fa81 a A3.fo1 - A3.fo81):

15

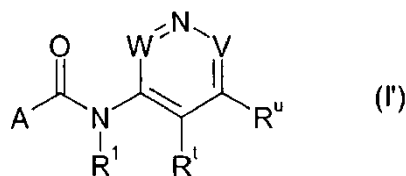




- 5 Otros ejemplos de radicales A3 adecuados son los restos de las fórmulas A3.Y 1, A3.Y 2, A3.3, en las que Z es N, R^{63} es CH_2CF_3 y R^{53} es respectivamente CH_3 , CF_3 y CHF_2 .



- 10 Una forma de realización muy preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que X^1 es O. Estos compuestos se denominan en adelante también como compuestos I'.



- 15 En la fórmula I', las variables A, R^1 , R^t , R^u , V y W son como se definen en el presente documento.

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

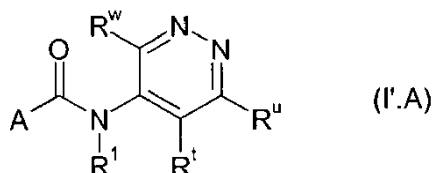
- 20 Entre los compuestos de la fórmula I', se da preferencia además a aquellos compuestos, en los que A es un radical A1, por ejemplo, un radical, seleccionado entre los radicales de oxazol A1.a' 1 a A1.z'81.

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 tiazol A1.a' 1 a A1.z'81.

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 imidazol A1.a" 1" a A1.z" 81.

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

5



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

10

R^1 es hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 o alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R^1 es más más preferiblemente propilo, iso-propilo, butilo, iso-butilo, terc-butilo, $CH_2C(CH_3)_3$, $CH_2CH=CH$, $CH_2CH=CCl_2$, $CH_2CH=CBBr_2$, CH_2CH_2F , CH_2CH_2Cl , CH_2CH_2Br , CH_2CHF_2 , $CH_2Cloroformo_2$, CH_2CHBr_2 , CH_2CF_3 , CH_2CN , CH_2OCH_3 , $CH_2OCH_2CH_3$, CH_2CH_2CN , CH_2CHCN_2 , $CH_2CH_2OCH_3$, $CH_2CH_2OCH_2CH_3$, etilciclopropano, etil-ciclobutano, 2-metil-oxetano, 3-etil-oxetano, 3-metil-tietano, 3-metil-tietano 1,1-dióxido, etil-ciclopentano, 2-etil-tetrahidro-furano, 3 - etil-tetrahidro-furano, metil-ciclopropano, ciclobutano-metil, 2-metil-oxetano, 3-metil-oxetano, 3-metil-tietano, 3-tietano 1,1-dióxido, ciclopentano, 2-metil-tetrahidro-furano, tetrahidrofurano, tolueno, 2-metil-furano, 3-metil-furano, 2-etil-tiofeno, 3-metil-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-1 H- 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-1 H-imidazol, 4-etil-1 H-imidazol, 2-metil-1 H-imidazol, 5-etil-1-metil-1H-imidazol, 2-etil-1-metil-1 H-imidazol, 1,4-dimetil-1 H-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;

15

20

25

R^t , R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t , R^u , y R^w son hidrógeno.

Ejemplos de compuestos de esta realización particularmente preferida son los compuestos indicados en las siguientes tablas 1 a 50.

30

- Tabla 1: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en la que R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de 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 la que R^1 es metilo, R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de 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 la que R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de los radicales A1.b1 a A1.b81
- Tabla 4: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en la que R^1 es metilo, R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de 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 la que R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de los radicales A1.c1 a A1.c81
- Tabla 6: Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en la que R^1 es metilo, R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de 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 la que R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de los radicales A1.d1 a A1.d81

[illegible]

R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de los radicales A1.o1 a A1.o81.

[illegible]

Tabla 49 Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en la que R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de los radicales A1.z1 a A1.z81.

Tabla 50 Compuestos de la fórmula I'.A y las sales y N-óxidos de los mismos, en la que R¹ es metilo, R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en la que A se selecciona de los radicales A1.z1 a A1.z81.

Ejemplos adicionales de compuestos de esta realización particularmente preferente, son los compuestos en analogía con los compuestos enumerados en las tablas 1 a 50, en las que R¹ es un radical representado por cada línea individual (85 a 160) de la siguiente tabla B:

5

Tabla B:

Línea	Radical R ¹
85	CH ₂ CH ₃
86	propilo
87	iso-propilo
88	butilo
89	iso-butilo
90	tert-butilo
91	CH ₂ C(CH ₃) ³
92	CH ₂ CH=CH
93	CH ₂ CH=CCl ₂
94	CH ₂ CH=CBr ₂
95	CH ₂ CH ₂ F
96	CH ₂ CH ₂ Cl
97	CH ₂ CH ₂ Br
98	CH ₂ CHF ₂
99	CH ₂ CHCl ₂
100	CH ₂ CHBr ₂
101	CH ₂ CF ₃
102	CH ₂ CN
103	CH ₂ OCH ₃
104	CH ₂ OCH ₂ CH ₃
105	CH ₂ CH ₂ CN
106	CH(Me)CH ₂ CN
107	2-metoxietilo
108	2-etoxietilo
109	ciclopropilometilo
110	ciclobutilometilo

Línea	Radical R ¹
111	ciclopentilmetilo
112	oxetan-2-ilmetilo
113	oxetan-3-ilmetilo
114	oxolan-2-ilmetilo
115	oxolan-3-ilmetilo
116	tietan-3-ilmetilo
117	1,1-dioxatietan-3-ilmetilo
118	ciclopropilo
119	ciclobutilo
120	ciclopentilo
121	oxetan-2-ilo
122	oxetan-3-ilo
123	oxolan-2-ilo
124	oxolan-3-ilo
125	tietan-3-ilo
126	1,1-dioxatietan-3-il
127	Bencilo
128	2-furilmetilo
129	3-furilmetilo
130	2-tienilmetilo
131	3-tienilmetilo
132	isotiazol-3-ilmetilo
133	isotiazol-4-ilmetilo
134	isotiazol-5-ilmetilo
135	isoxazol-3-ilmetilo
136	oxazol-2-ilmetilo

Línea	Radical R1
137	oxazol-5-ilometilo
138	oxazol-4-ilometilo
139	tiazol-2-ilometilo
140	tiazol-4-ilometilo
141	tiazol-5-ilometilo
142	1H-pirazol-3-ilometilo
143	1H-pirazol-4-ilometilo
144	2H-pirazol-3-ilometilo
145	1-metilo-1 H-pirazol-3- ilometilo
146	1-metilo-1 H-pirazol-4- ilometilo
147	2-metilo-2H-pirazol-3- ilometilo
148	1H-imidazol-2-ilometilo

Línea	Radical R1
149	1H-imidazol-4-ilmetilo
150	1H-imidazol-5-ilmetilo
151	1-metilo-1 H-imidazol-2- ilmetilo
152	1-metilo-1 H-imidazol-4-ilmetilo
153	1-metilo-1 H-imidazol-5-ilmetilo
154	oxazolin-2-ilmetilo
155	tiazolin-2-ilmetilo
156	1H-imidazolin-2-ilmetilo
157	1-metilo-1 H-imidazolin-2-ilmetilo
158	1-fenilopirazol-4-ilmetilo
159	5-metilofuran-2-ilmetilo
160	5,5-dimetilotetrahidrofuran-2-ilmetilo

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

5 A A1 es un radical, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A1, en la que R⁴¹, R⁵¹ tienen los significados preferidos, en particular, un radical tiazol de las fórmulas A1.a a A1.z, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales tiazol A1.a' 1 to A1.z' 81;

R¹ es hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂, más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

10 R¹ está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.

R^t, R^u, y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t, R^u, y R^w son hidrógeno.

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

A A1 es un radical, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A1, en la que R⁴¹, R⁵¹ tienen los significados preferidos, en particular, un radical imidazol de las fórmulas A1.a a A1.z, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales imidazol A1.a" 1 to A1.z" 81;

20 R¹ es hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂, más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R¹ está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.

25 R^t, R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t, R^u, y R^w son hidrógeno.

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

30 A es un radical A2, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A2, en la que R⁴², R⁵² tienen los significados preferidos, en particular, un radical oxazol de las fórmulas A2.aa a A2.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales oxazol A2.aa1 -A2.aa81 a A2.do1 a A2.do81;

- R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;
- R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
- 5 R^t, R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t, R^u , y R^w son hidrógeno.
- Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.A y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que
- 10 A es un radical A2, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A2, en la que R^{42}, R^{52} tienen los significados preferidos, en particular, un radical tiazol de las fórmulas A2.aa' a A2.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales tiazol A2.aa' 1 -A2.aa' 81 a A2.do' 1 a A2.do' 81;
- 15 R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;
- R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
- R^t, R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t, R^u , y R^w son hidrógeno.
- 20 Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.A y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que
- A es un radical A2, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A2, en la que R^{42}, R^{52}, R^{63} tienen los significados preferidos, en particular, un radical imidazol de las fórmulas A2.aa" a A2.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales imidazol A2.aa" 1 -A2.aa" 81 a A2.do1 a A2.do81;
- 25 R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;
- R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
- 30 R^t, R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t, R^u , y R^w son hidrógeno.
- Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.A y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que
- 35 A es un radical A3, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A3, en la que R^{43}, R^{53} tienen los significados preferidos, más particularmente, un radical oxazol de las fórmulas A3.aaaA3.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales oxazol A3.aa1-A3.aa81 a A3.do1 - A3.do81;
- 40 R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;
- R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
- 45 R^t, R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t, R^u , y R^w son hidrógeno.
- Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.A y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que
- 50 A es un radical A3, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A3, en la que R^{43}, R^{53} tienen los significados preferidos, más particularmente, un radical tiazol de las

fórmulas A3.aa' a A3.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales tiazol A3.aa' 1-A3.aa' 81 a A3.do' 1-A3.do' 81;

R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

5 R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.

R^t , R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t , R^u , y R^w son hidrógeno.

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

A es un radical A3, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A3, en la que R^{43} , R^{53} tienen los significados preferidos, más particularmente, un radical imidazol de las fórmulas A3.aa" a A3.fo, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales tiazol A3.aa" 1-A3.aa" 81 a A3.fo1 - A3.fo81;

15

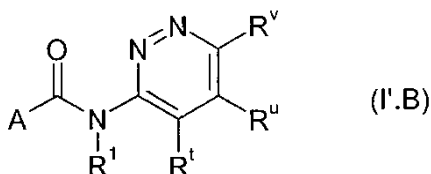
R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.

20 R^t , R^u y R^w se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t , R^u , y R^w son hidrógeno.

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

25



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

R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.

35 R^t , R^u y R^v se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^t , R^u , y R^v son hidrógeno.

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

40 A A1 es un radical, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A1, en la que R^{41} y R^{51} tienen los significados preferidos, en particular, un radical tiazol de las fórmulas A1.a a A1.z, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales tiazol A1.a' 1 a A1.z' 81;

R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

	R ¹	está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
5	R ^t , R ^u y R ^v	se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R ^t , R ^u , y R ^v son hidrógeno.
	Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.B y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que	
10	A	es un radical A2, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A1, en la que R ⁴² y R ⁵² tienen los significados preferidos, en particular, un radical oxazol de las fórmulas A2.aa a A2.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales oxazol A2.aa1 - A2.aa81 a A2.ha1 -A2.ha81;
	R ¹	es hidrógeno, alquilo C ₁ -C ₄ o alcoxi C ₁ -C ₄ -alquilo C ₁ -C ₂ , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;
15	R ¹	está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
	R ^t , R ^u y R ^v	se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R ^t , R ^u , y R ^v son hidrógeno.
20	Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.B y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que	
	A	es un radical A2, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A1, en la que R ⁴² y R ⁵² tienen los significados preferidos, en particular, un radical tiazol de las fórmulas A2.aa' a A2.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales tiazol A2.aa' 1 - A2.aa' 81 a A2.ha' 1 - A2.ha' 81;
25	R ¹	es hidrógeno, alquilo C ₁ -C ₄ o alcoxi C ₁ -C ₄ -alquilo C ₁ -C ₂ , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;
	R ¹	está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
30	R ^t , R ^u y R ^v	se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R ^t , R ^u , y R ^v son hidrógeno.
	Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.B y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que	
35	A	es un radical A3, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A3, en la que R ⁴³ y R ⁵³ tienen los significados preferidos, más particularmente, un radical oxazol de las fórmulas A3.aaaA3.do, por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales oxazol, tiazol o imidazol A3.aa1-A3.aa81 a A3.do1 - A3.do81;
	R ¹	es hidrógeno, alquilo C ₁ -C ₄ o alcoxi C ₁ -C ₄ -alquilo C ₁ -C ₂ , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;
40	R ¹	está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.
	R ^u , R ^v y R ^t	se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R ^u , R ^v y R ^t son hidrógeno.
45	Otra forma de realización particular preferida se refiere a compuestos de fórmula I'.B y a las sales y N-óxidos de los mismos, en la que	
50	A	es un radical A3, tal como se define en el presente documento, en particular un radical A3, en la que R ⁴³ y R ⁵³ tienen los significados preferidos, más particularmente, un radical tiazol de las fórmulas A3.aa' a A3.do', por ejemplo un radical seleccionado entre los radicales tiazol A3.aa' 1- A3.aa' 81 a A3.do' 1-A3.do' 81;

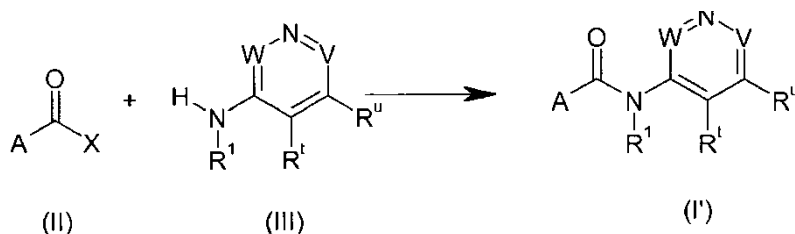
R^1 es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R^1 está además más preferentemente representado por un radical como se define en cada línea de la tabla B.

5 R^u , R^v y R^t se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en el que preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, de los radicales R^u , R^v y R^t son hidrógeno.

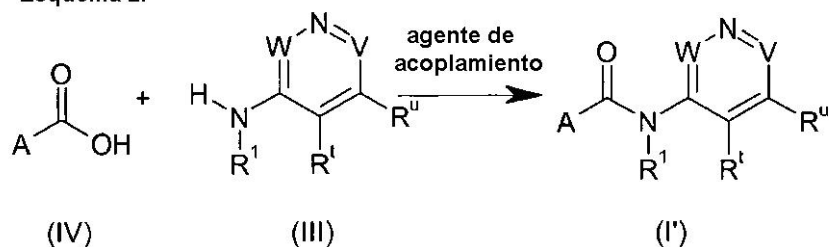
Los compuestos de la fórmula I, en la que X^1 es O o S (compuestos I'), se pueden preparar por ejemplo de acuerdo con el procedimiento representado en el Esquema 1 mediante la reacción de un derivado de ácido carboxílico oxazol, tiazol o imidazol II con una 3 - o 4-aminopiridazina, compuesto III (véase, por ejemplo Houben-Weyl: "Methoden der organ. Chemie" [Methods of Organic Chemistry], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, Volume E5, pp. 941-1045). Los derivados de ácido carboxílico oxazol, tiazol o imidazol II son, por ejemplo, haluros de acilo, ésteres activados, anhídridos, azidas de acilo, en la que X es para ex-ampleclorom flúor, bromo, para-
nitrofenoxi, pentafluorofenoxi, N-hidroxisuccinimidas, hidroxibenzotriazol- 1-ilo. En el esquema 1, los radicales A, R^1 , R^t , R^u , V y W tienen los significados mencionados anteriormente y en particular los significados mencionados como preferidos.

Esquema 1



20 Los compuestos de la fórmula I, en la que X^1 es O o S (compuestos I'), también se pueden preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar el oxazol o tiazol ácido carboxílico IV y el compuesto 3 - o 4-aminopiridazina II en presencia de un agente de acoplamiento de acuerdo con el esquema 2. En el esquema 2, los radicales A, R^t , R^u , V y W tienen los significados dados anteriormente y en particular los significados dados como preferidos.

Esquema 2:



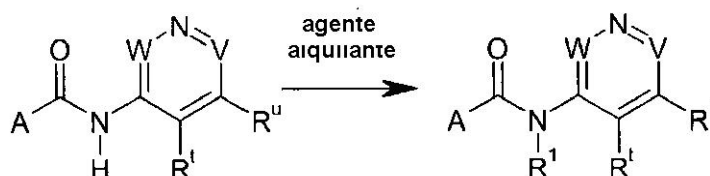
Agentes de acoplamiento adecuados son, por ejemplo

- agentes de acoplamiento basados en carbodiimidas, por ejemplo N, N'-diciohexilcarbodiimida [JC Sheehan, GP Hess, J. Am. Chem.Soc.1955, 77, 1067], N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida;
- agentes de acoplamiento que forman anhídridos mixtos con ésteres de ácido carbónico, por ejemplo, 2-etoxi-1-etoxicarbonil-1 ,2-dihidroquinolina [B. Belleau, G. Malek, J. Amer.Chem.Soc.1968, 90, 1651], 2-isobutiloxi-1-isobutiloxicarbonil-1 ,2-dihidroquinolina [Y. Kiso, H. Yajima, J. Chem.Soc., Chem.Comm.1972, 942];
- agentes de acoplamiento basados en sales de fosfonio, por ejemplo hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi) tris (dimetilamino) fosfonio [B. Castro, JR Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219], hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-il-oxi) tripirrolidinofosfonio [J. Coste et al., Tetrahedron Lett. 1990, 31, 205];

- agentes de acoplamiento a base de sales de uronio o que tiene una estructura de guanidinio N-óxido, 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. 1989, 30, 1927], tetrafluoroborato de N, N, N', N'-tetrametil-O-(benzotriazol-1-il) uronio, hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi) dipiperidinocarbenio [S. Chen, J. Xu, Tetrahedron Lett. 1992, 33, 647];
- agentes de acoplamiento que forman cloruros de ácido, por ejemplo cloruro de bis-(2-oxo-oxazolidinil) fosfínico [J. Diago-Mesequer, Síntesis 1980, 547].

Los compuestos de fórmula I, en la que X^1 es O (compuestos I') y R^1 es diferente de hidrógeno también pueden prepararse por alquilación de las amidas (en la que R^1 es hidrógeno y que puede obtenerse de acuerdo con el esquema 1 o 2) el uso de agentes alquilantes adecuados en presencia de bases.

Esquema 3:



Los ácidos carboxílicos de oxazol, tiazol o imidazol IV y sus derivados activados II, así como los compuestos 3 - o 4-aminopiridazina III, por favor compruebe si los siguientes nombres son correctos, son conocidos en la técnica o están disponibles comercialmente o pueden prepararse según procedimientos conocidos de la literatura.

Los compuestos de la fórmula I, en la que X^1 es diferente de oxígeno, se pueden preparar a partir de los compuestos de fórmula I' mediante procedimientos estándar:

Los compuestos de la fórmula I, en la que X^1 es S, se pueden preparar por ejemplo por 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 descrito por M. Jesberger et al. en Synthesis 2003, 1929.

Los compuestos de la fórmula I, en la que X^1 es NR^{1a} , Se pueden preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto I' con 2,4-bis (4-metoxifenil) 1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro para obtener la correspondiente tioamida (compuesto I, en el que X^1 es S), que después se hace reaccionar con una amina apropiada de acuerdo con el procedimiento descrito por V. Glushkov et al. en Pharmaceutical Chemistry Journal 2005, 39 (10), 533-536.

Los compuestos de fórmula II, en la que $X^2 = SR^{2a}$, se pueden preparar por alquilación de la tioamida correspondiente (compuesto I, en el que X^1 es S) por reacción con un agente de alquilación de acuerdo con el procedimiento descrito por V. Glushkov et al. en in Pharmaceutical Chemistry Journal 2005, 39(10), 533-536. De una manera similar, se pueden obtener los compuestos I, en los que X^2 es O^{2a} o $NR^{2b}R^{2c}$. Los compuestos de la fórmula II, en la que $X^2 = SOR^{2a}$ o SO^2R^{2a} se puede obtener por oxidación de los compuestos II con $X^2 = SR^{2a}$.

Los N-óxidos de los compuestos de fórmulas I y II se pueden preparar por oxidación de los compuestos I, de acuerdo con procedimientos estándar de preparación de N-óxidos heteroaromáticos, por ejemplo, por el procedimiento descrito por C. Botteghi et al. en Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31.

Como regla general, los compuestos de fórmulas I o II se pueden preparar mediante los procedimientos descritos anteriormente. Si los compuestos individuales no se pueden preparar a través de las rutas descritas anteriormente, se pueden preparar por derivatización de otros compuestos I o II o por modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos de fórmulas I o II pueden prepararse ventajosamente a partir de otros compuestos de fórmula I o II mediante hidrólisis de éster, amidación, esterificación, escisión de éter, olefinación, reducción, reacciones de acoplamiento catalizado por metal, oxidación y similares.

Las mezclas de reacción se procesan de la manera habitual, por ejemplo mezclando con agua, separando las fases y, si es apropiado, purificando los productos brutos mediante cromatografía, por ejemplo sobre gel de alúmina o sílice. Algunos de los intermedios y productos finales pueden obtenerse en forma de aceites viscosos incoloros o marrones pálidos que se liberan o purifican de componentes volátiles a presión reducida y una temperatura moderadamente elevada. Si los intermedios y productos finales se obtienen en forma de sólidos, pueden purificarse mediante recristalización o trituración.

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

De acuerdo con lo anterior, la presente invención también proporciona un procedimiento para controlar plagas de invertebrados en el que el procedimiento comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su terreno de cría o una planta cultivada, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelo, zona, material o entorno en el que las plagas crecen o pueden crecer o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación vegetal (tales como semillas), suelos, superficies o espacios para proteger del ataque o infestación de plagas con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de fórmula (I) o (II) o una sal o N-óxido del mismo o una composición como se define anteriormente.

Preferentemente, el procedimiento de la invención sirve para proteger material de propagación vegetal (tal como semillas) y a la planta que crece a partir del mismo ante el ataque o infestación de plagas, y comprende tratar el material de propagación vegetal (tal como semillas) con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de fórmulas (I) o (II) o una sal o N-óxido agrícolamente aceptable del mismo como se define anteriormente o con una cantidad plaguicida eficaz de una composición agrícola como se define anteriormente y a continuación. El procedimiento de la invención no está limitado a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación vegetal, material de suelo, etc.) que se ha tratado según la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, por tanto por ejemplo según la protección a una planta que crece a partir de materiales de propagación vegetal (tales como semillas), no habiendo sido tratada la planta misma.

En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" se seleccionan preferentemente de artrópodos y nematodos, más preferentemente de insectos dañinos, arácnidos y nematodos, y aún más preferentemente de insectos, ácaros y nematodos.

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

Dicha composición puede contener un compuesto activo único de las fórmulas I o II o una sal o N-óxido del mismo o una mezcla de varios compuestos activos I o II o sus sales según la presente invención. La composición según 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 plaguicidas que los comprenden son agentes eficaces para controlar plagas de artrópodos y nematodos. Las plagas de invertebrados controladas por los compuestos de fórmulas I o II incluyen, por ejemplo:

Insectos de la orden de los lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatilis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura 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 armigera*, *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 sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Anolis citrimea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pillariana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumetopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadensis*;

escarabajos (Coleoptera), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes 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*, *Ceratomya trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12 punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus or y zophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema or y zae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chr y socephala*, *Phyllophaga sp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*;

dípteros (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis*

- capitata, *Chr y somya bezziana*, *Chr y somya hominivorax*, *Chr y somya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia 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 (Thysanoptera), por ejemplo *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* and *Thrips tabaci*;
- himenópteros (Hymenoptera), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* y *Solenopsis invicta*;
- heterópteros (Heteroptera), 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*;
- homópteros (Homoptera), por ejemplo *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyraus*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiand*, y *Viteus vitifolii*;
- termitas (Isoptera), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* y *Termes natalensis*;
- ortópteros (Orthoptera), por ejemplo *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gr y llotarpa gr y llotarpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* y *Tachycines asynamorus*;
- Arachnoidea, tales como arácnidos (Acarina), por ejemplo de las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, 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 schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp. tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. tales como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. tales como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri* y *Oligonychus pratensis*;
- sifonápteros, por ejemplo *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.
- Las composiciones y compuestos de las fórmulas I o II son útiles para el control de nematodos, especialmente nematodos parasitarios vegetales tales como nematodos inductores de agallas, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, y otras especies de *Meloidogyne*;
- nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* y otras especies de *Heterodera*; nematodos de agalla de semilla, especies de *Anguina*; nematodos de tallo y foliares, especies de *Aphelenchoides*; nematodos de aguijón, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos de pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos anulares, especies de *Criconeuma*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconeuma*; nematodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos de punzón, especies de *Dolichodorus*; nematodos espirales, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nematodos de vaina y vainoides, especies de *Hemicyclophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos de lanza, especies de *Hoploaimus*; falsos nematodos inductores de agallas, especies de *Nacobbus*; nematodos de aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos de alfiler, especies de *Paratylenchus*; nematodos de lesión, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nematodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nematodos

reniformes, *Rotylenchus robustus* y otras especies de *Rotylenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíz gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*; nematodos del raquitismo, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos de cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos de daga, especies de *Xiphinema* y otras especies de nematodos parasitarias de plantas.

En una realización preferida de la invención, los compuestos de fórmulas I o II se usan para controlar insectos o arácnidos, en particular insectos de los órdenes Lepidoptera, Coleoptera, Thysanoptera y Homoptera y arácnidos del orden Acarina. Los compuestos de fórmulas I o II según la presente invención son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes Thysanoptera y Homoptera.

Los compuestos de fórmulas I o II o las composiciones plaguicidas que los comprenden pueden usarse para proteger a plantas y cultivos en crecimiento del ataque o infestación por plagas de invertebrados, especialmente insectos, ácaros o arácnidos, mediante la puesta en contacto de la planta/cultivo con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de fórmulas I o II. El término "cultivo" hace referencia tanto a cultivos en crecimiento como recolectados.

Los compuestos de las fórmulas I o II pueden convertirse en formulaciones habituales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos finos, polvos, pastas y gránulos.

La forma de uso depende del fin particular pretendido; en cada caso, debería asegurarse una distribución fina y uniforme del compuesto según la invención.

Las formulaciones se preparan de manera conocida (véanse, por ejemplo, para revisión los documentos US 3.060.084, EP-A 707.445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, 147-48, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes. los documentos WO 91/13546, US 472714, US 4.144.050, US 3.920.442, US 5.180.587, US 5.232.701, US 5.208.030, GB 2.095.558, US 3.299.566, Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, Hance et al., "Weed Control Handbook", 8ª 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 Academia Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo extendiendo el compuesto activo con auxiliares adecuados para la formulación de productos agroquímicos, tales como disolventes y/o portadores, si se desea emulsionantes, tensioactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, y para formulación de tratamiento de semilla, también opcionalmente colorantes y/o aglutinantes y/o agentes gelificantes.

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

Son emulsionantes adecuados los emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo éteres de alcohol graso de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Son ejemplos de dispersantes aguas residuales de lignina-sulfito y metilcelulosa.

Son tensioactivos adecuados usados las sales de metal alcalino, metal alcalinotérreo y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y glicoléteres de alcohol graso sulfatados, además condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietilenoctilfenoléter, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenolpoliglicoléteres, tributilfenilpoliglicoléter, triestearilfenilpoliglicoléter, alquilariopolietileralcoholes, condensados de alcohol y alcohol graso con óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, polioxietilenaalquiléteres, polioxipropileno etoxilado, poliglicoléteracetato de alcohol láurico, ésteres de sorbitol, aguas de desecho de lignosulfito y metilcelulosa.

Son sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleosas directamente pulverizables las fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tales como queroseno o gasolina diésel, además aceites de alquitrán de hulla y aceites de origen vegetal o 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, dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.

Pueden añadirse también a la formulación agentes anticongelantes tales como glicerina, etilenglicol, propilenglicol y bactericidas.

Son agentes antiespumantes adecuados, por ejemplo, agentes antiespumantes basados en estearato de silicio o magnesio.

Es un conservante adecuado, por ejemplo, el diclorofeno.

5 Las formulaciones de tratamiento de semilla pueden comprender adicionalmente aglutinantes y opcionalmente colorantes.

Se pueden añadir aglutinantes para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Son aglutinantes adecuados copolímeros en bloque de tensioactivos de OE/OP, pero también polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas, (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos, polivinilacetatos, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.

10 Opcionalmente, en la formulación pueden incluirse colorantes. Son colorantes o tintes adecuados para el tratamiento de semillas rodamina B, pigmento rojo C.I. 112, disolvente rojo C.I. 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48: 2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento marrón 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10 y rojo básico 108.

Un ejemplo de agente gelificante es la carragenina (Satiagel®)

20 Los polvos, materiales para dispersión y productos espolvoreables pueden prepararse mezclando o moliendo conjuntamente las sustancias activas con un vehículo sólido.

Los gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, se pueden preparar uniando los compuestos activos a vehículos sólidos.

25 Son ejemplos de vehículos sólidos tierras minerales tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, atapulgita activada, caliza, cal, creta, arcilla calcareoferruginosa, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal tales como harina de cereal, harina de corteza de árbol, polvo de madera y harina de cáscara de nuez, celulosa en polvo y otros vehículos sólidos.

30 En general, las formulaciones comprenden de 0,01 a 95% en peso, preferentemente de 0,1 a 90% en peso, del compuesto o compuestos activos. En este caso, el compuesto o compuestos activos se emplean con una pureza de 90 a 100% en peso, preferentemente de 95 a 100% en peso (según el espectro de RMN).

Con fines de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas pueden diluirse 2-10 veces, conduciendo a concentraciones en las preparaciones listas para usar de 0,01 a 60% en peso de compuesto activo, preferentemente de 0,1 a 40% en peso.

35 Los compuestos de fórmulas I o II pueden usarse como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, por ejemplo en forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones directamente pulverizables, emulsiones, dispersiones oleosas, pastas, productos espolvoreables, materiales para dispersar o gránulos, mediante pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión o vertido. Las formas de uso dependen enteramente de los fines pretendidos; se pretende asegurar en cada caso la distribución más fina posible del compuesto o compuestos activos según la invención.

40 Las formas acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos humectables (polverizables, dispersiones oleosas) añadiendo agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones oleosas, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o disolvente, se pueden homogeneizar en agua por medio del agente humectante, adhesivo, dispersante o emulsionante. No obstante, también es posible preparar concentrados que consisten en sustancia activa, agente humectante, adhesivo, dispersante o emulsionante y, si es adecuado, disolvente o aceite, y estos concentrados son adecuados para dilución con agua.

Las concentraciones de compuesto activo en las preparaciones listas para usar pueden variar dentro de intervalos relativamente amplios. En general, son de 0,0001 a 10% en peso, preferentemente de 0,01 a 1% en peso.

50 El compuesto o compuestos activos pueden usarse también exitosamente en el proceso de volumen ultrabajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más de 95% en peso de compuesto activo, o incluso aplicar el compuesto activo sin aditivos.

Los siguientes son ejemplos de formulaciones:

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

A) Concentrados hidrosolubles (SL, LS)

5 Se disuelven 10 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 90 partes en peso de agua o disolvente hidrosoluble. Como alternativa, se añaden humectantes u otros adyuvantes. El compuesto o compuestos activos se disuelven tras dilución con agua, con lo que se obtiene una formulación con 10% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

B) Concentrados dispersables (CD)

10 20 partes en peso del compuesto o compuestos activos se disuelven en 70 partes en peso de ciclohexona con la adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua da una dispersión, con lo que se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

C) Concentrados emulsionables (CE)

15 15 partes en peso del compuesto o compuestos activos se disuelven en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato cálcico y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso, 5 partes en peso). La dilución con agua da una emulsión, con lo que se obtiene una formulación con 15 % (p/p) de compuesto o compuestos activos.

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

20 25 partes en peso del compuesto o compuestos activos se disuelven en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato cálcico y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso, 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsionante (Ultraturrax) y se forma una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, con lo que se obtiene una formulación con 25 % (p/p) de compuesto o compuestos activos.

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

25 En un molino de bolas con agitación, 20 partes en peso del compuesto o compuestos activo se trituran con adición de 10 partes en peso de dispersantes y humectantes y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico, dando una suspensión fina del compuesto o compuestos activos. La dilución con agua da una suspensión estable de compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

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

30 50 partes en peso del compuesto o compuestos activos se trituran finamente con la adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se forman gránulos dispersables en agua o hidrosolubles por medio de aparatos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 50% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

35 G) Polvos dispersables en agua y polvos hidrosolubles (WP, SP, SS, WS)

75 partes en peso del compuesto o compuestos activos se trituran en molino rotor-estátor con la adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 75% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

40 H) Formulaciones en gel (GF)

45 En un molino de bolas agitado, se trituran 20 partes en peso de compuesto o compuestos activos con adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de un agente gelificante y humectantes y 70 partes en peso de agua o un disolvente orgánico, dando una suspensión fina de compuesto o compuestos activos. La dilución con agua da una suspensión estable de compuesto o compuestos activos, con lo que se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto o compuestos activos.

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

I) Polvos espolvoreables (DP, DS)

50 Se muelen finamente 5 partes en peso del compuesto o compuestos activos y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto espolvoreable que tiene 5% (p/p) de

compuesto o compuestos activos.

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

5 Se muelen finamente 0,5 partes en peso del compuesto o compuestos activos y se asocian con 95, 5 partes en peso de vehículos, con lo que se obtiene una formulación con 0,5% (p/p) del compuesto o compuestos activos. Los procedimientos actuales son extrusión, desecación por pulverización o el lecho fluidizado. Esto da gránulos para aplicar sin dilución para uso foliar.

K) Soluciones ULV (UL)

10 Se disuelven 10 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 90 partes en peso de un disolvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto da un producto que tiene un 10% (p/p) de compuesto o compuestos activos, que se aplica sin dilución para uso foliar.

15 Los compuestos de fórmulas I o II son también adecuados para el tratamiento de materiales de propagación vegetal (tales como semillas). Las formulaciones convencionales de tratamiento de semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidificables FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión espesa WS, polvos hidrosolubles SS y emulsión ES y EC y formulación en gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a las semillas diluidas o sin diluir. La aplicación de las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, directamente en las semillas o después de que ésta haya pre-germinado.

20 En una realización preferida, se usa una formulación de FS para tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación de FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de tensioactivo, de 0 a 200 g/l de agente anticongelante, de 0 a 400 g/l de aglutinante, de 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de disolvente, preferentemente agua

25 Otras formulaciones de FS preferidas de compuestos de fórmula I para tratamiento de semillas comprenden de 0,5 a 80% en peso del ingrediente activo, de 0,05 a 5% en peso de humectante, de 0,5 a 15% en peso de agente dispersante, de 0,1 a 5% en peso de espesante, de 5 a 20% en peso de agente anticongelante, de 0,1 a 2% en peso de agente antiespumante, de 1 a 20% en peso de pigmento y/o tinte, de 0 a 15% en peso de adhesivo/agente de adhesión, de 0 a 75% en peso de carga/vehículo y de 0,01 a 1% en peso de conservante.

Pueden añadirse a los ingredientes activos diversos tipos de aceites, humectantes, coadyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros plaguicidas o bactericidas, si es apropiado inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Estos agentes se mezclan habitualmente con los agentes según la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1.

30 Los compuestos de fórmulas I o II son eficaces tanto por contacto (a través de suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, partes de planta o partes de animal) como por ingestión (cebo o parte de planta).

Para uso contra hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas, los compuestos de fórmulas I o II se usan preferentemente en una composición de cebo

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

40 El cebo empleado en la composición es un producto que es suficientemente atractivo para incitar a insectos tales como hormigas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc. o cucarachas a comerlo. El atractivo puede manipularse usando estimulantes alimentarios o feromonas sexuales. Los estimulantes alimentarios se eligen, por ejemplo pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insecto, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melazas o miel. Partes frescas o descompuestas de frutos, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos pueden servir también como estimulante alimentario. Las feromonas sexuales son conocidas por ser más específicas de insectos. Se describen feromonas específicas en la bibliografía y son conocidas por los especialistas en la materia.

50 Las formulaciones de compuestos de las fórmulas I o II en forma de aerosoles (por ejemplo, en botes pulverizadores), pulverizadores de aceite o pulverizadores de bomba son altamente deseables para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las composiciones de aerosol están preferentemente compuestas por compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metiletilcetona), hidrocarburos parafinados (por ejemplo, querosenos) que tienen intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, Nmetilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua y además auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol,

55

etoxilato de oleílo que tiene 3-7 mol de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites perfumados tales como aceites de éter, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, si es apropiado estabilizantes tales como benzoato de sodio, tensioactivos anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si es necesario, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetiléter, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de pulverización de aceite difieren de las composiciones de aerosol en que no se usan propelentes.

Los compuestos de las fórmulas I o II y sus composiciones respectivas pueden usarse también en espirales antimosquitos y de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles antipolillas, pastillas antipolillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

Los procedimientos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniosis) con compuestos de las fórmulas I o II y sus composiciones respectivas comprenden también el tratamiento de superficies de cabañas y casas, la pulverización del aire e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestir, mosquiteras, trampas para mosca tsé tsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, tela, artículos tejidos, no tejidos, material o láminas de malla y toldos comprenden preferentemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Son repelentes adecuados, por ejemplo, N, N-dietil-meta-toluamida (DEET), N, N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1- (3-ciclohexan-1-ilcarbonil) -2-metilpiperina, lactona del ácido (2-hidroximetilciclohexil) acético, 2-etil-1, 3hexanodiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no usado para control de insectos tal como (+) trans-crisantemato de (+/-) -3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2- (+) -enilo (esbiotrina), un repelente derivado de o idéntico a extractos vegetales como limoneno, eugenol, (+) -eucamalol (1), (-) -1-epi-eucamalol o extractos vegetales brutos de plantas como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogon martinii, Cymbopogon citratus (hierba de limón), Cymopogan nardus (citronela). Los aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos 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 dietilénicamente insaturados tales como estireno y dienos alifáticos tales como butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteras se realiza en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones de los compuestos activos de fórmula I o pulverizándolos sobre las mallas.

Los procedimientos que pueden emplearse para tratar semillas son, en principio, todas las técnicas de tratamiento de semillas y especialmente de desinfección de semillas adecuadas conocidas en la materia, tales como recubrimiento de semillas (por ejemplo, peletización de semillas), espolvoreo de semillas e imbibición de semillas (por ejemplo, empapado de semillas). Aquí, "tratamiento de semillas" hace referencia a todos los procedimientos que ponen en contacto semillas y compuestos de fórmulas I o II entre sí, y "desinfección de semillas" a procedimientos de tratamiento de semillas que proporcionan a las semillas una cantidad de los compuestos de fórmulas I o II, es decir que generan una semilla que comprende el compuesto de fórmulas I o II. En principio, el tratamiento puede aplicarse a la semilla en cualquier momento desde 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 de "maceta". Sin embargo, el tratamiento puede llevarse a cabo también durante varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de desinfección de semillas, sin que se observe una eficacia sustancialmente reducida.

Convenientemente, el tratamiento se aplica a semilla no sembrada. Como se usa en el presente documento, el término "semilla no sembrada" pretende incluir semilla en cualquier periodo desde la recolección de la semilla a la siembra de la semilla en el terreno con fines de germinación y crecimiento de la planta.

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

Los compuestos de fórmula I o II los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos son en particular adecuados también para uso para combatir parásitos en y sobre animales.

Por tanto, un objeto adicional de la presente invención es proporcionar nuevos procedimientos para controlar parásitos en el interior y sobre los animales. Otro objeto de la invención es proporcionar plaguicidas más seguros para animales. Es otro objeto de la invención proporcionar adicionalmente plaguicidas para animales que puedan usarse a dosis menores que los plaguicidas existentes. Y es otro objeto de la invención proporcionar plaguicidas para animales que proporcionen un largo control residual de los parásitos.

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

- La presente invención proporciona también un compuesto para usar en un procedimiento para tratar, controlar, prevenir y proteger a animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar por vía oral, tópica o parenteral a los animales una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de las fórmulas I o II los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y un vehículo o composición aceptable que los comprenda.
- La presente invención proporciona también un procedimiento no terapéutico para tratar, controlar, prevenir y proteger a animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende aplicar a un lugar una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composición o vehículo aceptable que los comprenda.
- La presente invención proporciona también un procedimiento para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir y proteger a animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende incluir una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composición o vehículo aceptable que los comprenda.
- La invención se refiere adicionalmente a compuestos de fórmula I para uso en el tratamiento, control, prevención o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos. La invención se refiere también al uso de un compuesto de las fórmulas I o II, o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y un vehículo o una composición aceptable que lo comprenda, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento terapéutico de animales contra infecciones o infestaciones por parásitos.
- La actividad de compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de endoparásitos y ectoparásitos en o sobre animales que requieran, por ejemplo, dosificaciones bajas no eméticas en el caso de aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad y un manejo seguro.
- Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que los compuestos de fórmula I son adecuados para combatir endoparásitos y ectoparásitos en y sobre animales.
- Los compuestos de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferentemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales que incluyen animales de sangre caliente (incluyendo seres humanos) y peces. Son adecuados, por ejemplo, para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado bovino, ovejas, porcinos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, monos, gamos y renos, y también en animales de peletería tales como visón, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y agua salada tales como trucha, carpa y anguilas.
- Los compuestos de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferentemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos tales como perros o gatos.
- Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero sin limitación, piojos, piojos mordedores, garrapatas, estros nasales, moscas malófagas, moscas mordedoras, moscas muscoides, moscas, larvas de mosca miasítica, chinches, jejenes, mosquitos y pulgas.
- Los compuestos de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ectoparásitos y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas etapas de desarrollo.
- 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 especies, respectivamente:
- pulgas (Siphonaptera), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Nosopsyllus fasciatus*,
- cucarachas (Blattaria -Blattodea), por ejemplo *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* y *Blatta orientalis*,
- moscas y mosquitos (Diptera), 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*, *Chr* y *somya bezziana*, *Chr* y *somya hominivorax*, *Chr* y *somya macellaria*, *Chr* y *sops discalis*, *Chr* y *sops silacea*, *Chr* y *sops 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*, *Glossina fuscipes*, *Glossina*

- 5 tachinoides, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* y *Tabanus similis*,
- piojos (Phthiraptera), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eur y sternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus s tramineus* y *Solenopotes capillatus*,
- 10 garrapatas y ácaros parásitos (Parasitiformes); garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (Mesostigmata), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,
- 15 actínidos (Prostigmata) y acarídeos (Astigmata) por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., and *Laminosioptes* spp.,
- chinchas (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. y *Arlus critatus*,
- anopluros, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp. y *Solenopotes* spp.
- 20 malofágidos (subórdenes Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp.
- nematodos gusanos redondos:
- gusanos látigo y de triquinosis (Trichosyringida), por ejemplo triquinélidos (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,
- 25 rabdítidos, por ejemplo *Rhabditis* spp., *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,
- estrongílidos, por ejemplo *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp, (anquilostoma), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*, *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp. *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Diectophyma renale*,
- 30 gusanos redondos intestinales (Ascaridida), por ejemplo *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (oxiuro), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp. y *Oxyuris equi*,
- 35 camalánidos, por ejemplo *Dracunculus medinensis* (gusano de Guinea),
- espirúridos, por ejemplo *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilaria* spp., *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi* y *Habronema* spp.;
- gusanos de cabeza espinosa (Acanthocephala), por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp,
- 40 planarios (platelmintos) :
- trematodos (Trematoda), por ejemplo *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp. y *Nanocyetes* spp,
- 45 cercomeromorfos, en particular cestodos (gusanos planos), por ejemplo *Diphyllbothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipilidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocostoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp. e *Hymenolepis* spp.
- Los compuestos de fórmulas I o II y composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes Diptera, Siphonaptera e Ixodida.
- Además, es especialmente preferido el uso de los compuestos de fórmulas I o II y composiciones que los contienen para combatir mosquitos.
- 50

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

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

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

Los compuestos de fórmulas I o II y composiciones que los contienen son particularmente útiles para combatir endoparásitos (nematodos gusanos redondos, gusanos de cabeza espinosa y planarios).

- 10 Los compuestos de fórmulas I o II y las composiciones que los contienen pueden ser eficaces tanto mediante contacto (a través de suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, mantas o partes de animal) como por ingestión (por ejemplo cebos).

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

- 15 Los compuestos de fórmulas I o II y las composiciones que los contienen pueden usarse para proteger a animales del ataque o infestación por parásitos poniéndolos en contacto con una cantidad parasitaria eficaz de compuestos de fórmulas I o II y las composiciones que los contienen. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/mezclas plaguicidas directamente sobre el parásito, que también puede incluir un contacto indirecto en su lugar y opcionalmente también administrar los compuestos/mezclas plaguicidas directamente sobre el animal) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones en el lugar del parásito). El contacto con el parásito mediante aplicación a su lugar es un ejemplo de uso no terapéutico de compuestos de fórmula I.

"Lugar P" como se define anteriormente significa el hábitat, suministro de alimento, terreno de cría, zona, material o entorno en que un parásito crece o puede crecer fuera del animal. Los compuestos de la invención pueden aplicarse también preventivamente a sitios en que se espera la aparición de plagas o parásitos.

La administración al animal puede llevarse a cabo tanto profiláctica como terapéuticamente.

- 25 La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en forma de preparaciones adecuadas, por vía oral, tópica/dérmica o parenteral.

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 alimentos animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pócimas, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos las fórmulas I o II pueden administrarse a los animales con su agua de bebida. . Para administración oral, la forma de dosificación elegida debería proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal al día de compuesto de fórmula I, preferentemente de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal al día.

- 35 Como alternativa, los compuestos de fórmulas I o II pueden administrarse a animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmulas I o II pueden dispersarse o disolverse en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Como alternativa, los compuestos de fórmulas I o II pueden formularse en un implante para administración subcutánea. . Además, los compuestos las fórmulas I o II pueden administrarse por vía transdérmica a animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación elegida debería proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal al día de compuesto de fórmulas I o II.

- 40 Los compuestos de fórmulas I o pueden aplicarse también por vía tópica a los animales en forma de baños, polvos finos, polvos, collares, medallones, pulverizadores, champús, formulaciones de tratamiento por aplicación puntual y lavado y en pomadas o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, los baños y pulverizadores contienen habitualmente de 0,5 ppm a 5.000 ppm y preferentemente de 1 ppm a 3.000 ppm de compuesto de fórmula I o II. Además, los compuestos las fórmulas I o II pueden formularse como crotales para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado bovino y ovejas.

Son preparaciones adecuadas:

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

emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;

- 50 formulaciones en que el compuesto activo se procesa en una base de pomada o en una base de emulsión de aceite en agua o agua en aceite;

preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, aglomerados, comprimidos,

bolos, cápsulas, aerosoles e inhaladores y artículos conformados que contienen el compuesto activo.

Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un disolvente adecuado y añadiendo opcionalmente ingredientes adicionales tales como ácidos, bases, sales de tamponación, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se cargan en esterilidad.

- 5 Son disolventes adecuados los disolventes fisiológicamente tolerables tales como agua, alcanoles tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de los mismos.

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

- 10 Son solubilizantes adecuados disolventes que promueven la disolución del compuesto activo en el disolvente principal o previenen su precipitación. Son ejemplos polivinilpirrolidona, polivinilalcohol, aceite de ricino polioxietilado y éster de sorbitán polioxietilado.

Son conservantes adecuados alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres de ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

- 15 Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral después de dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones orales y concentrados se preparan según el estado de la técnica y como se describe anteriormente para soluciones de inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

Las soluciones para uso sobre la piel se gotean, extienden, frotan, rocían o pulverizan.

- 20 Las soluciones para uso sobre la piel se preparan según el estado de la técnica y según lo que se describe anteriormente para soluciones de inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles.

- 25 Son disolventes adecuados adicionales polipropilenglicol, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicolalquiléter, por ejemplo dipropilenglicolmonometiléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcitol, solketal, carbonato de propileno y mezclas de los mismos.

Puede ser ventajoso añadir espesantes durante la preparación. Son espesantes adecuados espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados de celulosa, polivinilalcoholes y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

- 30 Los geles se aplican o extienden sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que se han preparado como se describe en el caso de soluciones de inyección con espesante suficiente para dar como resultado un material transparente con consistencia de tipo pomada. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.

Las formulaciones de tratamiento por vertido se vierten o pulverizan sobre zonas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo en la piel y actuando sistémicamente.

- 35 Las formulaciones de tratamiento por vertido se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsionando el compuesto activo en disolventes dermocompatibles adecuados o mezclas de disolventes. Si es apropiado, se añaden otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, fotoestabilizantes y adhesivos.

- 40 Son disolventes adecuados: agua, alcanoles, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicolalquiléteres tales como dipropilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonobutyléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, 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 metilpirrolidona, n-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, Nmetilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2, 2-dimetil-4-oximetilen-1, 3-dioxolano y glicerolformal.

- 45 Son colorantes adecuados todos los colorantes permitidos para uso en animales y que puedan disolverse o suspenderse.

- 50 Son sustancias promotoras de la absorción adecuadas, por ejemplo, DMSO, aceites formadores de película tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácido graso, triglicéridos y alcoholes grasos.

Son antioxidantes adecuados sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol y tocoferol.

Son fotoestabilizantes adecuados, por ejemplo, ácido novantisólico.

Son adhesivos adecuados, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales tales como alginatos y gelatina.

Las emulsiones pueden administrarse por vía oral, dérmica o como inyecciones.

- 5 Las emulsiones son de tipo agua en aceite o de tipo aceite en agua.

Se preparan disolviendo el compuesto activo en la fase hidrófoba o hidrófila y homogeneizando esta con el disolvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes adecuados y, si es apropiado, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizantes y agentes potenciadores de la viscosidad.

- 10 Son fases hidrófobas (aceites) adecuadas:

parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite de ricino, triglicéridos sintéticos tales como diglicérido caprílico/cáprico, mezcla de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de longitud de cadena C_8 - C_{12} u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o insaturados que contienen posiblemente también grupos hidroxilo, mono-y diglicéridos de ácidos grasos C_8 - C_{10} , ésteres de ácido graso tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, pelargonato de dipropilenglicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C_{16} - C_{18} , miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C_{12} - C_{18} , estearato de isopropilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácido graso céreos tales como grasa de glándula uropígea de pato sintética, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo y mezclas de ésteres relacionados con los últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleico y ácidos grasos tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

Son fases hidrófilas adecuadas: agua, alcoholes tales como propilenglicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

- 25 Son emulsionantes adecuados:

tensioactivos no iónicos, por ejemplo, aceite de ricino polietoxilado, monooleato de sorbitán polietoxilado, monoestearato de sorbitán, monoestearato de glicerol, esterato de polioxietilo, alquilfenolpoliglicoléter; tensioactivos anfóteros tales como N-lauril-p-iminodipropionato de disodio o lecitina; tensioactivos aniónicos tales como laurilsulfato de sodio, etersulfatos de alcohol graso, mono/dialquilpoliglicoléter, sal de monoetanolamina de éster del ácido ortofosfórico y tensioactivos catiónicos tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

- 35 Son auxiliares adicionales adecuados: sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, polivinilalcohol, copolímeros de metilviniléter y anhídrido maleico, poletilenglicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

Las suspensiones pueden administrarse por vía oral o tópica/dérmica. adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes y fotoestabilizantes.

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

Son agentes humectantes adecuados (dispersantes) los emulsionantes dados anteriormente.

- 40 Son otros auxiliares que pueden mencionarse los dados anteriormente.

Las preparaciones semisólidas pueden administrarse por vía oral o tópica/dérmica. Difieren de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solo en su mayor viscosidad.

Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada.

- 45 Los excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Los usados son sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos tales como carbonato de calcio, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice precipitada o coloidal o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, comestibles y alimentos tales como leche en polvo, harina animal, harinas de grano y grano triturado y almidones.

- 50 Son auxiliares adecuados conservantes, antioxidantes, y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

Son otros auxiliares adecuados lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la disgregación tales como almidón o polivinilpirrolidona reticulada, aglutinantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal y aglutinantes secos tales como celulosa microcristalina.

- 5 En general, "cantidad parasiticida eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para conseguir un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad parasiticida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad parasiticida eficaz de las composiciones variará también según las condiciones reinantes tales como el efecto parasiticida deseado y la duración, la especie diana, el modo de aplicación y similares.

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

En general, es favorable aplicar los compuestos de fórmula I en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg, preferentemente de 1 mg/kg a 50 mg/kg de peso corporal del animal tratado al día.

- 15 Las preparaciones listas para usar contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferentemente ectoparásitos, a concentraciones de 10 ppm a 80% en peso, preferentemente de 0,1 a 65% en peso, más preferentemente de 1 a 50% en peso, lo más preferentemente de 5 a 40% en peso.

Las preparaciones que se diluyen antes del uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos a concentraciones de 0,5 a 90% en peso, preferentemente de 1 a 50% en peso.

- 20 Además, las preparaciones comprenden los compuestos de fórmula I contra endoparásitos a concentraciones de 10 ppm a 2% en peso, preferentemente de 0,05 a 0,95 en peso, con muy particular preferencia de 0,005 a 0,25% en peso.

En una realización preferida de la presente invención, las composiciones que comprenden los compuestos de fórmulas I o II se aplican por vía dérmica/tópica.

- 25 En una realización preferida adicional, la aplicación tópica se realiza en forma de artículos conformados que contienen compuesto tales como collares, medallones, crotales, bandas para fijar en partes corporales y tiras y láminas adhesivas.

En general, es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberan compuestos de fórmula I en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferentemente de 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferentemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

- 30 Para la preparación de artículos conformados, se usan termoplásticos y plásticos flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Son plásticos y elastómeros adecuados resinas de polivinilo, poliuretano, poliácido, resinas epoxídicas, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliésteres que sean suficientemente compatibles con los compuestos de fórmula I. Se da una lista detallada de plásticos y elastómeros, así como de procedimientos de preparación para artículos conformados, por ejemplo en el documento WO 03/086075.

- 35 Las composiciones para su uso según esta invención pueden contener también otros ingredientes activos, por ejemplo, otros plaguicidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros plaguicidas o bactericidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento vegetal, protectores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales pueden usarse secuencialmente o en combinación con las composiciones anteriormente descritas, si es apropiado se añaden también solo inmediatamente antes del uso (mezcla de tanque). Por ejemplo, la planta o plantas pueden pulverizarse con una composición de esta invención antes o después de tratarse con otros ingredientes activos.

- 40 Estos agentes pueden mezclarse con los agentes usados según la invención en una relación en peso de 1:10 a 10:1. Mezclar los compuestos de fórmula I o las composiciones que los comprenden en la forma de uso como plaguicidas con otros plaguicidas da frecuentemente como resultado un espectro de acción plaguicida más amplio.

La siguiente lista M de plaguicidas junto con los cuales pueden usarse los compuestos según la invención y con los cuales podrían producirse efectos sinérgicos potenciales pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no imponer ninguna limitación:

- 50 M.1. organo (tio) fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cloretoxifos, clorfeninfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demetón-S-metilo, diazinón, diclorvos/ DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilinfos, disulfoton, EPN, etión, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentión, flupirazofos, fostiazato, heptenofos, isoxatión, malatión, mecarbam, metamidofos, metidatión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosamidona, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetafos, protiofos, piraclofos, pirdafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos,

temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfon, vamidotión.

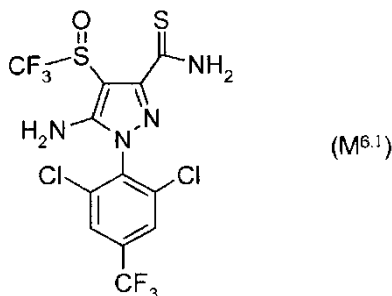
M.2. Carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimethacarb, triazamato, XMC, xililcarb, triazamato;

5 M.3. Piretroides: acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina Sciclopentenilo, biorresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, betaciflutrina, cihalotrina, λ-cihalotrina, γ-cihalotrina, cipermetrina, α-cipermetrina, β-cipermetrina, θ-cipermetrina, ζ-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, τ-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, ZXI 8901;

10 M.4. miméticos de hormona juvenil: hidropreno, cinopreno, metopreno, fenoxicarb, piriproxifeno;

M.5. compuestos agonistas/antagonistas de receptor nicotínico: acetamiprid, bensultap, clorhidrato de cartap, clotianidina, dinotefurán, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, nicotina, espinosad (agonista alostérico), espinetoram (agonista alostérico), tiacloprid, tiociclam, tiosultap-sodio y AKD1022.

15 M.6. compuestos antagonistas de los canales de cloro dependientes de GABA: clordano, endosulfán, γ-HCH (lindano) ; acetoprol, etiprol, fipronil, pirafluprol, piriprol, vaniliprol, el compuesto fenilpirazol de fórmula M6,1



20 M.7. activadores de canal de cloruro: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina.

M.8. compuestos METI I: fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenimer, rotenona;

M.9. compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnona;

M.10. desacopladores de la fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;

25 M.11. inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotina, cihexatina, diafentiurón, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifón;

M.12. alteradores de la muda: ciromazina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida;

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

M.14. compuestos bloqueantes de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

30 M.15. fumigadores: bromuro de metilo, fluoruro de cloropirinsulfurilo;

M.16. bloqueantes selectivos de alimentación: criolita, pimetrozina, flonicamid;

M.17. inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, hexitiazox, etoxazol;

M.18. inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezina, bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón.

35 M.19. inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espiroclifeno, espiromesifeno, espirotetramato;

M.20. agonistas octopaminérgicos: amitraz;

M.21. moduladores de receptor de rianodina: flubendiamida; (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);

M.22. varios: fosfuro de aluminio, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bórax, bromopropilato, cianuro, cienopirafeno, ciflumetofeno, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridililo, pirifluquinazona, azufre, compuestos organosulfúricos, tartrato de antimonio y potasio, sulfoxaflor, 4-but-2-iniloxi-6- (3, 5dimetilpiperidin-1-il) -2-fluoropirimidina (M22.1), 3-benzoilamino-N-[2, 6-dimetil-4- (1, 2, 2, 2-tetrafluoro-1trifluorometiletil) fenil]-2-fluorobenzamida (M22.2), 4-[5- (3, 5-diclorofenil) -5-trifluorometil-4, 5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-N-piridin-2-ilmetilbenzamida (M22.3), 4-[5- (3, 5-diclorofenil) -5-trifluorometil-4, 5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-N (2, 2, 2-trifluoroetil) benzamida (M22.4), 4-[5- (3, 5-diclorofenil) -5-trifluorometil-4, 5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-N-tiazol-2-ilmetilbenzamida (M22.5), 4-[5- (3, 5-diclorofenil) -5-trifluorometil-4, 5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-N- (tetrahidrofuran-2-ilmetil) benzamida (M22.6), 4-[(6-bromopirid-3-il) metil]- (2-fluoroetil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.7), 4-[(6-fluoropirid-3-il) metil]- (2, 2-difluoroetil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.8), 4-[(2-cloro-1, 3-tiazolo-5-il) metil]- (2-fluoroetil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.9), 4-[(6-cloropirid-3-il) metil]- (2-fluoroetil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.10), 4-[(6-cloropirid-3-il) metil]- (2, 2-difluoroetil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.11), 4-[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il) metil] (metil) amino}furan-2 (5H) ona (M22.12), 4-[(5, 6-dicloropirid-3-il) metil]- (2-fluoroetil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.13), 4-[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il) metil] (ciclopropil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.14), 4-[(6-cloropirid-3-il) metil] (ciclopropil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.15), 4-[(6-cloropirid-3-il) metil] (metil) amino}furan-2 (5H) -ona (M22.16), 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-12hidroxi-4, 6a, 12b-trimetil-11-oxo-9- (3-piridinil) -2H, 11H-nafto[2, 1-b]pirano[3, 4-e]piran-3, 6-dilico] del ácido ciclopropanoacético (M22.17), 8- (2-ciclopropilmetoxi-4-metilfenoxi) -3- (6-metilpiridazin-3-il) -3-azabicyclo[3.2.1]octano (M22.18),

M.23. N-R'-2,2-dihalo-1-R''ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-hidrazona, en las que R' es metilo o etilo, halógeno es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo;

M.24. antranilamidas: clorantraniliprol, ciantraniliprol, [4-ciano-2- (1-ciclopropiletilcarbamoil) -6-metilfenil]amida del ácido 5-bromo-2- (3-cloropiridin-2-il) -2H-pirazol-3-carboxílico (M24.1), [2-cloro-4-ciano-6- (1-ciclopropiletilcarbamoil) fenil]amida del ácido 5-bromo-2- (3-cloropiridin-2-il) -2H-pirazol-3-carboxílico (M24.2), [2bromo-4-ciano-6- (1-ciclopropiletilcarbamoil) fenil]amida del ácido 5-bromo-2- (3-cloropiridin-2-il) -2H-pirazol-3-carboxílico (M24.3), [2-bromo-4-cloro-6- (1-ciclopropiletilcarbamoil) fenil]amida del ácido 5-bromo-2- (3-cloropiridin-2-il) -2H-pirazol-3-carboxílico (M24.4), [2, 4-dicloro-6- (1-ciclopropiletilcarbamoil) fenil]amida del ácido 5-bromo-2- (3-cloropiridin-2-il) -2H-pirazol-3-carboxílico (M24.5), [4-cloro-2- (1-ciclopropiletilcarbamoil) -6-metilfenil]amida del ácido 5bromo-2- (3-cloropiridin-2-il) -2H-pirazol-3-carboxílico (M24.6),

M.25. compuestos de 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-trifluoro-propil)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-trifluoro-propil)-malononitrilo), $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$ (2-(3,4,4,4-Tetrafluoro-3-trifluorometil-butil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)-malononitrilo), $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ (2-(3,3,4,4,5,5,6,6,6-Nonafluoro-hexil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)-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-octafluoro-pentil)-malononitrilo), $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,5-Nonafluoro-pentil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)-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-(2,2,3,3,4,4,4-Heptafluoro-butil)-2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoro-pentil)-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-Octafluoro-pentil)-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)-malonodinitrilo), $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoro-butil)-malononitrilo);

M.26. alteradores microbianos: *Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*;

Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M pueden encontrarse en "The Pesticide Manual", 13ª edición, British Crop Protection Council (2003), entre otras publicaciones

Las tioamidas de fórmula M6.1 y su preparación se han descrito en el documento WO 98/28279. La lepimectina es conocida por "Agro Project", PJB Publications Ltd, noviembre de 2004. El benclotiaz y su preparación se han descrito en el documento EPA 1454621. El metidatión y el paraoxón y su preparación se han descrito en "Farm Chemicals Handbook", volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. La metaflumizona y su preparación se han descrito en el documento EP-A1.462.456. El flupirazofos se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988, pág. 237-243 y en el documento US 4822779. El pirafluprol y su preparación se han descrito en los documentos JP 2002193709 y WO 01/00614. El piriprol y su preparación se han descrito en los documentos WO 98/45274 y US 6335357. El amidoflumet y su preparación se han descrito en los documentos US 6221890 y JP 21010907. La flufennerima y su preparación se han descrito en los documentos WO 03/007717 y WO 03/007718. El AKD-1022 y su preparación se han descrito en el documento US 6300348. El clorantraniliprol se ha descrito en los documentos WO 01/70671, WO 03/015519 y WO 05/118552. El ciantraniliprol se ha descrito en los documentos WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. Las antranilamidas M 24.1 a M 24.6 se han descrito en los documentos WO 2008/72743 y WO

200872783. La ftalamida M 21.1 es conocida por el documento WO 2007/101540. El ciflumetofeno y su preparación se han descrito en el documento WO 04/080180. El compuesto de aminoquinazolinona pirifluquinazona se ha descrito en el documento EP-A 1097932. La sulfoximina sulfoxaflor se ha descrito en los documentos WO 2006/060029 y WO 2007/149134. El compuesto de alquililéter M22.1 se describe, por ejemplo, en el documento JP 2006131529. Los compuestos organosulfúricos se han descrito en el documento WO 2007060839. El compuesto de carboxamida M 22.2 es conocido por el documento WO 2007/83394. Los compuestos de oxazolina M 22.3 a M 22.6 se han descrito en el documento WO 2007/074789. Los compuestos de furanona M 22.7 a M 22.16 se han descrito, por ejemplo, en el documento WO 2007/115644. El derivado de piripiropeno M 22.17 se ha descrito en los documentos WO 2008/66153 y WO 2008/108491. El compuesto de piridazina M 22.18 se ha descrito en el documento JP 2008/115155. Los compuestos de malononitrilo se han descrito 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.

Los participantes de mezcla fungicidas son aquellos seleccionados del grupo consistente en acilalaninas tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo, derivados de amina tales como aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminocadina, epiroxamina, tridemorf, anilino pirimidinas tales como pirimetanilo, mepanipirim o cirodinilo; antibióticos tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomycin; azoles tales como biteranol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalil, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, procloraz, protriocanazol, tebuconazol, triadimefón, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol dicarboximidas tales como iprodión, miclozolina, procimidón, vinclozolina; ditiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb; compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomilo, boscalid, carbendazima, carboxina, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, ditianona, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fuberidazol, flutolanil, furametpir, isoprotiolano, mepronil, nuarimol, probenazol, proquinazid, pirifenox, piroquilón, quinoxifeno, siltiofam, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato-metilo, tiadinilo, triclozazol, triforina; fungicidas de cobre tales como mezcla Bordeaux, acetato de cobre, oxiclóruro de cobre, sulfato básico de cobre; derivados de nitrofenilo tales como binapacril, dinocap, dinobutón, nitroftalisopropilo; fenilpirroles tales como fenpiclonilo o fludioxonilo, azufre, otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclomezina, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, acetato de fentina, fenoxanilo, ferimzona, fluazinam, fosetilo, fosetilo-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenona, pencicurón, propamocarb, ftalida, tolclofos-metilo, quintozeno, zoxamida; estrobilurinas tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina o trifloxistrobina; derivados de ácido sulfénico tales como captafol, captán, diclofluanida, folpet, toliifluanida, cinamamidas y análogos tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

La plaga de invertebrado, concretamente artrópodos y nematodos, la planta, suelo o agua en que la planta crece puede ponerse en contacto con el presente compuesto o compuestos de las fórmulas I o II o la composición o composiciones que los contienen mediante cualquier procedimiento de aplicación conocido en la materia. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga animal o planta, típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al lugar de la plaga animal o planta).

Además, las plagas de invertebrados pueden controlarse mediante la puesta en contacto de la plaga diana, su suministro de alimento, hábitat, terreno de cría o su lugar con una cantidad plaguicida eficaz de compuestos de fórmulas I o II. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del lugar, cultivo en crecimiento o cultivo recolectado por la plaga.

"Lugar" significa el hábitat, terreno de cría, plantas cultivadas, material de propagación vegetal (tal como semillas), suelo, zona, material o entorno en que una plaga o parásito crece o puede crecer.

En general, "cantidad plaguicidamente eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para conseguir un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad plaguicidamente eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad plaguicidamente eficaz de las composiciones variará también según las condiciones reinantes tales como el efecto plaguicida deseado y la duración, el clima, la especie diana, el lugar, el modo de aplicación y similares.

Los compuestos de fórmulas I o II y sus composiciones pueden usarse para proteger materiales de madera tales como árboles, vallas de madera, traviesas, etc. y edificios tales como casas, edificios anexos, fábricas, pero también materiales de construcción, mobiliario, cueros, fibras, artículos de vinilo, hilos y cables eléctricos, etc. de hormigas y/o termitas, y para controlar que hormigas y termitas no dañen cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos se aplican no solo a la superficie del suelo circundante o al suelo bajo tierra para proteger materiales de madera, sino que pueden aplicarse también a artículos de serrería tales como superficies de hormigón bajo el suelo, postes de nicho, contrachapado, mobiliario, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, medios tableros, etc. y artículos de vinilo tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material termoaislante tal como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que dañan cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o directamente se aplica al nido de hormigas o similar.

Los compuestos de fórmulas I o II pueden aplicarse también preventivamente a sitios en que se espera la aparición de plagas.

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

En el caso de tratamiento de suelo o de aplicación al sitio de residencia o nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo está en el intervalo de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferentemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

- 10 Los índices de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m².

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

- 15 Para uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0,001% en peso a 5% en peso de compuesto activo.

Para uso en composiciones de pulverización, el contenido de ingrediente activo es de 0,001 a 80% en peso, preferentemente de 0,01 a 50% en peso y lo más preferentemente de 0,01 a 15% en peso.

- 20 Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, el índice de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el intervalo de 0,1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 25 g a 600 g por hectárea, más deseablemente de 50 g a 500 g por hectárea.

En el tratamiento de semillas, los índices de aplicación de los ingredientes activos son generalmente de 0,1 a 10 kg por 100 kg de semillas, preferentemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semillas.

- 25 La presente invención se ilustra a continuación con más detalle con los siguientes ejemplos.

I. Ejemplos de preparación

Los procedimientos descritos en los siguientes ejemplos de preparación se usaron para preparar otros compuestos de fórmulas I y II mediante la modificación apropiada del material de partida. Los compuestos resultantes, junto con datos físicos, se enumeran en la tabla C a continuación.

- 30 Los productos se caracterizaron mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución y espectrometría de masas). La HPLC se llevó a cabo usando una columna analítica RP-19 (Chromolith Speed ROD de Merck KGaA, Alemania), que funcionaba a 40°C. Servía como fase móvil acetonitrilo con 0,1% en volumen de una mezcla de ácido trifluoroacético/agua y 0,1% en volumen de ácido trifluoroacético; caudal: 1,8 ml/min y volumen de inyección: 2 µl.

- 35 **Ejemplo 1:** Ácido 2-Chloro-tiazol-4-carboxílico metil-piridazin-4-il-amida de ácido 2-Chloro-tiazol-4-carboxílico

A una solución de 11,0 g (0,17 moles, 85% de pureza) de hidróxido de potasio en etanol / agua (1:3, 200 ml) a 0 ° C se añadieron lentamente 14,0 g (73,1 mmol) de éster etílico del ácido-4-carboxílico 2-clorotiazol. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas, se diluyó con agua y se lavó dos veces con éter dietílico. La capa acuosa se acidificó (pH = 5,5) con HCl conc. y se agitó a temperatura ambiente durante tres días. El precipitado formado se recogió por filtración y se secó a 40 ° C bajo vacío para producir 7,0 g (56%, 95% de pureza) del compuesto del título como un sólido marrón.

Metil-piridazin-4-il-amida de ácido 2-Cloro-tiazol-4-carboxílico

- 45 200 mg (1,2 mmol) de ácido 2-clorotiazol-4-carboxílico y 96,1 mg (0,9 mmol) de piridazin-4-il-amina se disolvieron en 6 ml de dimetil formamida. 0,15 ml (1,1 mmoles) de trietilamina seguido de 382 mg (0,73 mmol) de hexafluorofosfato de 1H-benzotriazol-1-iloxitri-pirrolidinofosfonio (PyBOP) se añadieron y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Se añadió salmuera y la mezcla de reacción se extrajo tres veces con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y el disolvente se eliminó a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna (sílice, gradiente de elución ciclohexano → acetato de etilo → metanol) para dar 200 mg (61%, 95% de pureza) del compuesto del título.

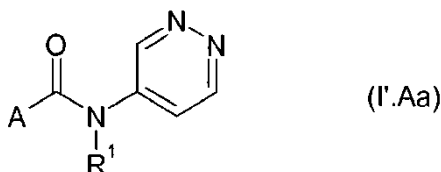
- 50 **Ejemplo 2:** Metil-piridazin-4-il-amida de ácido 2-metil-tiazol-4-carboxílico

250 mg (1,8 mmoles) de ácido 2-metil-tiazol-4-carboxílico se suspendieron en 20 ml de tolueno y dos gotas de

5 dimetilformamida se añadieron a la mezcla. 0,16 ml de cloruro de tionilo (2,2 mmol) se añadió a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó a 65 ° C durante dos horas. Después de la eliminación del disolvente, se añadió tolueno y la evaporación se repitió. Después, el residuo obtenido se disolvió en 10 ml de diclorometano y se añadió la solución gota a gota a una solución que contiene 166 mg de piridazin-4-il-amina (1,8 mmol) y 0,27 ml de trietilamina (1,9 mmol) en 40 ml de diclorometano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas y el disolvente se eliminó al vacío. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna (sílice, gradiente de elución ciclohexano → acetato de etilo → metanol) para dar 50 mg (13%, 99% de pureza) del compuesto del título.

Los compuestos de la fórmula I y las sales o N-óxidos de los mismos, en la que R^t, R^u y W son CH, V es N y X¹O se denominan en lo sucesivo en el presente documento compuestos I'.Aa.

10



Los compuestos de fórmula I'.Aa preparados de acuerdo con el procedimiento mencionado anteriormente junto con sus datos físico-químicos se recopilan en la Tabla C a continuación. R¹ y A en cada caso tienen los significados dados en la línea correspondiente de la tabla C.

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

Ejemplo	R ¹	A	datos físico-químicos: t.r. [min]
1	H	2-metil-5-trifluorometiloxazol-4-ilo	1,883
2	H	2,4-dimetiloxazol-5-ilo	1,264
3	H	2,5-dimetiloxazol-4-ilo	1,468
4	H	2,4-dimetiltiazol-5-ilo	1,465
5	metilo	2-metiltiazol-4-ilo	1,288
6	H	2-metiltiazol-4-ilo	1,090
7	H	5-bromotiazol-4-ilo	1,560
8	metilo	5-bromotiazol-4-ilo	1,430
9	H	2-feniltiazol-4-ilo	2,406
10	metilo	2-feniltiazol-4-ilo	2,315
11	H	4-metiltiazol-5-ilo	1,263
12	H	2-(4-clorofenil)oxazol-4-ilo	2,537
13	metilo	2-(4-clorofenil)oxazol-4-ilo	2,524
14	metilo	2-clorotiazol-4-ilo	1,606
15	H	5-metil-3-(2,2,2-trifluoro-etil)-3H-imidazol-4-ilo	1,278
t.r. = tiempo de retención en HPLC			

II. Evaluación de la actividad plaguicida:

II.1 Actividad contra el áfido del algodón (*aphis gossypii*, varios estadios vitales)

5 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.0000 ppm suministrada en tubos de 1,3 ml de ABgene ®. Estos tubos se introdujeron en un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones madre para las que se realizaron diluciones más bajas en 50% de acetona: 50% de agua (v / v). Un tensioactivo no iónico (Kinetic @) se incluyó en la solución a un volumen de 0,01% (v / v).

10 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón fueron infestadas con áfidos antes del tratamiento colocando una hoja fuertemente infestada de la colonia principal de áfidos en la parte superior de cada cotiledón. Se dejó que los áfidos pasaran durante la noche para lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta y se retiró la hoja huésped. Después se roció a las plantas infestadas con un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas se secaron en la campana de humos del pulverizador, se sacaron del pulverizador y después se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24-hr a 25 ° C y una humedad relativa del 20-40%. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas de control no tratadas se determinó después de 5 días.

15 En este ensayo, los compuestos 2, 4, 6 y 11, respectivamente, a 300 ppn mostraron una mortalidad de al menos un 75% en comparación con los controles no tratados.

II.2 Actividad contra el áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*, varios estadios vitales)

20 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.0000 ppm suministrada en tubos de 1,3 ml de ABgene ®. Estos tubos se introdujeron en un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones madre para las que se realizaron diluciones más bajas en 50% de acetona: 50% de agua (v / v). Un tensioactivo no iónico (Kinetic @) se incluyó en la solución a un volumen de 0,01% (v / v).

25 Plantas de pimentón en el primer estadio de hoja verdadera se infestaron antes del tratamiento introduciendo hojas muy infestadas de la colonia principal en la parte superior de las plantas de tratamiento. Se dejó que los áfidos pasaran durante la noche para lograr una infestación de 30-50 áfidos por planta y se retiró la hoja huésped. Después se roció a las plantas infestadas con un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas se secaron en la campana de humos, se sacaron del pulverizador y después se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24-hr a 25 ° C y una humedad relativa del 20-40%. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas de control no tratadas se determinó después de 5 días.

30 En este ensayo, los compuestos 2, 4 y 11, respectivamente, a 300 ppn mostraron una mortalidad de al menos un 75% en comparación con los controles no tratados.

II.3 Actividad contra el áfido negro (*aphis craccivora*)

35 Se formularon los compuestos activos en acetona:agua 50:50 (vol:vol). La solución de ensayo se preparó el día de uso.

Se pulverizaron plantas de judía de careta en tiesto colonizadas con 100-150 áfidos en diversas etapas después de registrar la población de plagas. Se valoró la reducción de la población después de 24, 72 y 120 horas.

40 En este ensayo, los compuestos 2, 3, 5, 6 y 7, respectivamente, a 300 ppn mostraron una mortalidad de al menos un 90% en comparación con los controles no tratados.

II.4 Actividad contra el áfido de la algarroba (*Megoura viciae*)

Se formularon los compuestos activos en DMSO:agua 1:3 (vol:vol) con diferentes concentraciones de los compuestos formulados.

45 Discos de hojas de la judía se colocaron en placas de microtitulación con 0,8% de agar-agar y 2,5 ppm de OPUS™. Los discos de hojas se pulverizaron con 2,5 µl de la solución de ensayo y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en las placas de microtitulación, que después se cerraron y se mantuvieron a 23 ± 1 ° C y a una humedad relativa del 50 ± 5% con luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó en base a los áfidos vitales reproducidos. La mortalidad de los áfidos y la fecundidad se evaluó visualmente.

50 En este ensayo, los compuestos 4, 6 y 7, respectivamente a una concentración de la solución de ensayo de 2.500 mg/l mostraron una mortalidad de al menos un 90%.

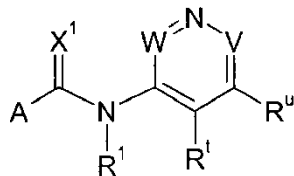
II.5 Actividad contra el áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*)

Para evaluar el control del áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*) por medios sistémicos, la unidad del ensayo consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contenían dieta artificial líquida bajo una membrana artificial.

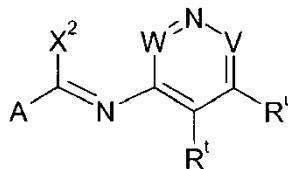
- 5 Los compuestos se formularon usando una solución que contenía 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Diferentes concentraciones de los compuestos formulados se pipetearon en la dieta del áfido usando un pipeteador integrado adaptado y con dos duplicados. Tras la aplicación, de 5 a 8 áfidos adultos se introdujeron en la membrana artificial dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Después, se dejó que los áfidos succionaran la dieta para áfidos tratados y se incubaron a aproximadamente $23 \pm 1^\circ\text{C}$ y una humedad relativa de aproximadamente $50 \pm 5\%$ durante 3 días. La mortalidad de los áfidos y la fecundidad se evaluó visualmente.
- 10 En este ensayo, los compuestos 2, 4, 6 y 7, respectivamente, a 2.500 ppm mostraron una mortalidad de un 100% en comparación con los controles no tratados.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de piridazina de fórmulas I o II



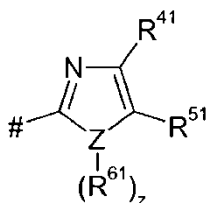
(I)



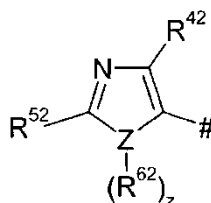
(II)

5 en las que

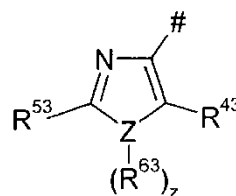
A es un radical oxazol o tiazol o imidazol de las fórmulas A1, A2 o A3 ,



A1



A2



A3

10 en las que

indica el sitio de unión al resto de las fórmulas I o II;

Z es O o S para z = 0 o Z es N para z = 1;

R⁴¹, R⁴², R⁴³ y R⁵¹ se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₁₀ y alquino C₂-C₁₀, en los que los últimos 3 radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes o en los que R⁴¹, R⁴², R⁴³ y R⁵¹ se seleccionan además de OR^a, SR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, heterociclilo, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalqueno C₅-C₁₀ y fenilo, en los que los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes;

R⁵², R⁵³ se seleccionan de hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₁₀ y alquino C₂-C₁₀, en los que los últimos 3 radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes o en los que R⁵², R⁵³ se seleccionan además de OR^a, SR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, heterociclilo, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalqueno C₅-C₁₀ y fenilo, en los que los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, y en las que

R⁶¹, R⁶², R⁶³ se seleccionan de hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₁₀ y alquino C₂-C₁₀, en los que los últimos tres radicales mencionados pueden estar no sustituidos, pueden estar parcial o completamente halogenados o pueden portar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes o en los que R⁶¹, R⁶², R⁶³ se seleccionan además de OR^a, SR^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^gNR^eR^f, heterociclilo, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalqueno C₅-C₁₀ y fenilo, en los que los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes;

V es C(R^v) o N.

W es C(R^w) o N.

con la condición de que V o W sea N;

R^t , R^u , R^v y R^w se seleccionan cada uno de forma independiente entre sí de hidrógeno, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₃, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₃, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₃, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ o alcoxi C₁-C₄alquilo-C₁-C₄;

X^1 es S, O or NR^{1a} , en las que

R^{1a} se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilmetilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₄, OR^a, fenilo, heteroarilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo en los últimos cuatro radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

X^2 es OR^{2a}, NR^{2b}R^{2c}, S(O)_mR^{2d}, en las que

R^{2a} se selecciona de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, y en los que

R^{2b} , R^{2c} se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₂-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilo, heteroarilcarbonilo, heteroarilsulfonilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, y hetaril-alquilo C₁-C₄ en los que el anillo aromático en los últimos ocho radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, o

R^{2b} y R^{2c} junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros saturados o insaturados, que pueden portar un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y N como átomo del miembro del anillo y en el que el heterociclo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, de forma independiente uno de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄, y en los que

R^{2d} se selecciona de alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, fenilo-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo aromático en los últimos seis radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

R^1 es hidrógeno, CN, alquilo C₁-C₁₀, haloalquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₁₀, halocicloalquilo C₃-C₁₀, cicloalquilmetilo C₃-C₁₀, halocicloalquilmetilo C₃-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, haloalquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, haloalquinilo C₃-C₁₀, alquilen C₁-C₄-CN, OR^a, alquilen C₁-C₄-OR^a, C(Y)R^b, alquilen C₁-C₄-C(Y)NR^b, alquilen C₁-C₄-C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, alquilen C₁-C₄-NR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, alquilen C₁-C₄-C(Y)NR^gR^h, (O)_mNR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, fenilo, hetarilo, fenil-alquilo C₁-C₄ y hetaril-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo aromático de los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes;

m es 0, 1 o 2;

Y es O o S.

R^a , R^b , R^c se selecciona de forma independiente uno de otro de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilmetilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, heteroarilo, fenil-alquilo C₁-C₄, hetarilo-alquilo C₁-C₄, heterocicil-alquilo C₁-C₄, en los que el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

- 5 R^d se selecciona de alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilmetilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , fenilo, heterociclilo, fenilo-alquilo C_1-C_4 , hetarilo-alquilo C_1-C_4 , en los que el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;
- 10 R^e , R^f se seleccionan de forma independiente entre sí de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilmetilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_4 , haloalquilcarbonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_2-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilo, heteroarilcarbonilo, heteroarilsulfonilo, fenil-alquilo C_1-C_4 , hetarilo-alquilo C_1-C_4 y heterocicilil-alquilo C_1-C_4 , en los que el anillo aromático en los últimos ocho radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;
- 15 o
- 20 R^e and R^f junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros saturados o insaturados, que pueden portar un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y N como átomo del miembro del anillo y en el que el heterociclo puede estar no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, de forma independiente uno de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;
- 25 R^g , R^h se selecciona de forma independiente uno de otro de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , fenilo, heteroarilo, fenilo-alquilo C_1-C_4 , hetarilo-alquilo C_1-C_4 , en los que el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;
- 30 R^i se selecciona de hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilmetilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , fenilo, y fenil-alquilo C_1-C_4 , en los que el anillo de fenilo en los dos últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, con independencia unos de otros, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 y haloalcoxi C_1-C_4 ;
- 35 R^x se seleccionan cada uno de forma independiente entre sí de ciano, nitro, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquilio C_1-C_4 , haloalquilio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_{10} , cicloalquilo C_3-C_6 , heterociclilo de 5 a 7 miembros, fenilo, cicloalcoxi C_3-C_6 , heterociciloxi de 3 a 6 miembros y fenoxi, en los que los últimos 6 radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^y ; y en los que
- 40 R^y se selecciona de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo- C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquilio C_1-C_4 , haloalquilio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_4 , haloalquilcarbonilo C_1-C_4 , cicloalquilo- C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo- C_2-C_4 , haloalquenilo- C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 y alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 ;
- 45 o sus sales, N-óxidos, agrícola o veterinariamente aceptables, enantiómeros o diastereómeros de los mismos.
2. Los compuestos según la reivindicación 1, en los que el compuesto de piridazina es un compuesto de fórmula I.
3. Los compuestos según la reivindicación 1 o 2, en los que X^1 es oxígeno.
4. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en los que R^1 es hidrógeno o alquilo C_1-C_3 .
5. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en los que W es CR^w siendo R^w hidrógeno.
- 50 6. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en los que R^t , R^u y R^w son hidrógeno.
7. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en los que A es un radical A1.
8. Los compuestos según la reivindicación 7, en los que R^{41} se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y halocicloalquilo C_3-C_6 .
9. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 7 a 8, en los que R^{51} se selecciona de hidrógeno,

halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆.

10. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9, en los que R⁶¹ se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclilo-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄alquilo-C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄-CN.

5 11. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en los que A es un radical A2.

12. Los compuestos según la reivindicación 11, en los que R⁴² se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆.

13. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 11 a 12, en los que R⁵² se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆.

10 14. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 11 a 13, en los que R⁶² se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclilo-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄alquilo-C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄-CN.

15. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en los que A es un radical A3.

15 16. Los compuestos según la reivindicación 15, en los que R⁴³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆.

17. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 15 a 16, en los que R⁵³ se selecciona de hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y halocicloalquilo C₃-C₆.

20 18. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 15 a 17, en los que R⁶³ se selecciona de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclilo-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄alquilo-C₁-C₄ y alquilo C₁-C₄-CN.