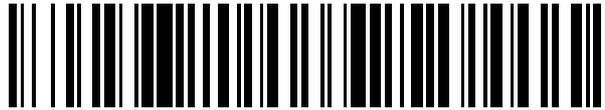


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 546 404**

51 Int. Cl.:

C07D 403/12 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **23.09.2009 E 09783322 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **29.07.2015 EP 2342196**

54 Título: **Compuestos de pirazol para el control de plagas invertebradas**

30 Prioridad:

24.09.2008 US 99784 P

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

23.09.2015

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

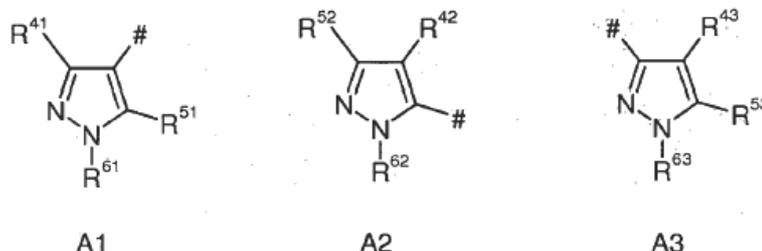
**GROSS, STEFFEN;
KÖRBER, KARSTEN;
VON DEYN, WOLFGANG;
KAISER, FLORIAN;
DESHMUKH, PRASHANT;
DICKHAUT, JOACHIM;
LE VEZOUET, RONAN;
SÖRGEL, SEBASTIAN;
POHLMAN, MATTHIAS;
ANSPAUGH, DOUGLAS D.;
CULBERTSON, DEBORAH L. y
OLOUMI-SADEGHI, HASSAN**

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

ES 2 546 404 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).



denota el sitio de enlazamiento al resto de las fórmulas I o II, y en donde R^{41} , R^{42} , R^{43} y R^{51} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo y C_2 - C_{10} -alquinilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, o en donde R^{41} , R^{42} , R^{43} y R^{51} son seleccionados además de OR^a , SR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , S(O)R^d , $\text{S(O)}_2\text{R}^d$, NR^eR^f , $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, hetarilo, heterociclilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_5 - C_{10} -cicloalquenilo y fenilo, en donde los cinco últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de los radicales R^y y R^x , y en donde R^{52} , R^{53} son seleccionados de hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo y C_2 - C_{10} -alquinilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, o en donde R^{52} , R^{53} son seleccionados además de OR^a , SR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , S(O)R^d , $\text{S(O)}_2\text{R}^d$, NR^eR^f , $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, hetarilo, heterociclilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_5 - C_{10} -cicloalquenilo y fenilo, en donde los cinco últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de los radicales R^y y R^x , y en donde R^{61} , R^{62} , R^{63} son seleccionados de hidrógeno, CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo y C_2 - C_{10} -alquinilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, o en donde R^{61} , R^{62} , R^{63} son seleccionados además de OR^a , SR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , S(O)R^d , $\text{S(O)}_2\text{R}^d$, NR^eR^f , $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, $\text{S(O)}_m\text{NR}^e\text{R}^f$, $\text{C(Y)NR}^i\text{NR}^e\text{R}^f$, C_1 - C_5 -alquilen- OR^a , C_1 - C_5 -alquilen-CN, C_1 - C_5 -alquilen- C(Y)R^b , C_1 - C_5 -alquilen- C(Y)OR^c , C_1 - C_5 -alquilen- NR^eR^f , C_1 - C_5 -alquilen- $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, C_1 - C_5 -alquilen- $\text{S(O)}_m\text{R}^d$, C_1 - C_5 -alquilen- $\text{S(O)}_m\text{NR}^e\text{R}^f$, C_1 - C_5 -alquilen- $\text{NR}^i\text{NR}^e\text{R}^f$, heterociclilo, hetarilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_5 - C_{10} -cicloalquenilo, heterociclilo- C_1 - C_5 -alquilo, hetarilo- C_1 - C_5 -alquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquil- C_1 - C_5 -alquilo, C_5 - C_{10} -cicloalquenilo- C_1 - C_5 -alquilo, fenil- C_1 - C_5 -alquilo y fenilo, en donde los anillos de los diez últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^y idénticos o diferentes;

m es 0, 1 o 2;

R^t , R^u , R^v y R^w son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, halógeno, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_3 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_3 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_3 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_3 -haloalquilsulfonilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_3 -haloalquilsulfonilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo o C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo;

X^1 es S, O o NR^{1a} , en donde R^{1a} es seleccionado de hidrógeno, C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilmetilo, C_3 - C_{10} -halocicloalquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -haloalquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_1 - C_{10} -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, OR^a , heterociclilo, heterociclilo- C_1 - C_4 -alquilo, fenilo, hetarilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, o 4 sustituyentes que independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi;

X^2 es OR^{2a} , $\text{NR}^{2b}\text{R}^{2c}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^{2d}$; en donde R^{2a} es seleccionado de C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, heterociclilo, heterociclilo- C_1 - C_4 -alquilo, fenilo, hetarilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, o 4 sustituyentes que independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi, y en donde R^{2b} , R^{2c} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alquenilo, C_2 - C_4 -haloalquenilo, C_2 - C_4 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -alquilcarbonilo, C_1 - C_4 -haloalquilcarbonilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilocarbonilo, hetarilosulfonilo, heterociclilo, heterociclicarbonilo, heterocicilosulfonilo, heterociclilo- C_1 - C_4 -alquilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, donde el anillo en los últimos doce radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi, o R^{2b} y R^{2c} junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros, saturado o insaturado, que puede llevar un átomo adicional seleccionado de O, S y N como átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi, y en donde R^{2d} es seleccionado de C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -

haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi; R¹ es hidrógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₃-C₁₀-halocicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-haloalqueno, C₂-C₁₀-alquino, C₃-C₁₀-haloalquino, C₁-C₅-alquilen-CN, OR^a, C₁-C₅-alquilen-OR^a, C(Y)R^b, C₁-C₅-alquilen-C(Y)R^b, C(Y)OR^c, C₁-C₅-alquilen-C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, C₁-C₅-alquilen-NR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, C₁-C₅-alquilen-C(Y)NR^gR^h, S(O)_mNR^eR^f, C(Y)NRⁱNR^eR^f, C₁-C₅-alquilen-S(O)₂R^d, C₁-C₅-alquilen-S(O)_mNR^eR^f, C₁-C₅-alquilen-C(Y)NRⁱNR^eR^f; fenilo, heterociclilo, hetarilo, fenil-C₁-C₅-alquilo, C₃-C₁₀-cicloalquil-C₁-C₅-alquilo, heterociclilo-C₁-C₅-alquilo y hetarilo-C₁-C₅-alquilo en donde los anillos de los últimos siete radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de los radicales R^y y R^x;

Y es O o S;

R^a, R^b, R^c son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, o 4 sustituyentes que independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R^d es seleccionado de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R^e, R^f son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, heterociclicarbonilo, heterociclilo-C₁-C₄-sulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilocarbonilo, hetarilosulfonilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, donde el anillo en los últimos doce radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R^e y R^f junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros, saturado o insaturado, que puede llevar un átomo adicional seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R^g, R^h son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, o 4 sustituyentes los cuales son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R_i es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenil y fenilo-C₁-C₄-alquilo en donde el anillo de fenilo en los últimos dos radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R^x son independientemente uno de otro seleccionados de ciano, nitro, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, S(O)_mR^d, S(O)_mNR^eR^f, C₁-C₁₀-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, heterociclilo de 5- a 7- miembros, hetarilo de 5- o 6- miembros, fenilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, heterociclioxi y fenoxi de 3- a 6- miembros, en donde los 7 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^y; y en donde

R^y es seleccionado de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi;

C₁-C₄-haloalcoxi, S(O)_mR^d, S(O)_mNR^eR^f, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo.

- 5 Un aspecto adicional de la presente invención se relaciona con un método para controlar plagas invertebradas, método que comprende el tratamiento de las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o sus terrenos de crianza o una planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en los cuales las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que van a ser protegidos del ataque de plagas o infestación con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de pirazol de fórmula I o II según la presente invención o una sal o un N-óxido del mismo.
- 10 Un aspecto adicional de la presente invención se relaciona con un método para proteger el material de propagación de las plantas y/o las plantas que crecen del mismo, cuyo método comprende tratar el material de propagación de las plantas con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola o un N-óxido del mismo.
- 15 Un aspecto adicional de la presente invención se relaciona con material de propagación vegetal, que comprende al menos un compuesto de fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola o un N-óxido del mismo.
- 20 Un aspecto adicional de la presente invención se relaciona con un método para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por parásitos que comprende poner en contacto al animal con una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención o una sal aceptable desde el punto de vista veterinario o un N-óxido del mismo. Poner en contacto al animal con el compuesto I o II, su sal o la composición veterinaria de la invención significa aplicarlo o administrarlo al animal.
- Un aspecto adicional de la presente invención se relaciona con una composición agrícola que contiene al menos un compuesto de fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola o un N-óxido del mismo y al menos un vehículo líquido o sólido.
- 25 Los radicales unidos al esqueleto de los compuestos de fórmulas I o II pueden contener uno o más centros de quiralidad. En este caso los compuestos de las fórmulas I o II están presentes en la forma de diferentes enantiómeros o diastereómeros, dependiendo de los sustituyentes. Los compuestos de fórmula II, adicionalmente, existen como isómeros cis o trans con respecto al eje N=C. La presente invención se relaciona con todos los posibles estereoisómeros de los compuestos de fórmulas I o II, esto es, enantiómeros o diastereómeros individuales,
- 30 así como a mezclas de los mismos.
- Los compuestos de fórmulas I o II pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más diferentes estados cristalinos (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas tales como estabilidad o mostrar diferentes propiedades biológicas tales como actividades. La presente invención se relaciona con compuestos amorfos y cristalinos de las fórmulas I o II, mezclas de diferentes estados cristalinos del compuesto I o II respectivo, así como
- 35 las sales amorfas o cristalinas de los mismos.
- Las sales de los compuestos de las fórmulas I o II son preferiblemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola y veterinario. Se pueden formar de una manera habitual, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmulas I o II tiene una funcionalidad básica.
- 40 Sales útiles desde el punto de vista agrícola de los compuestos de fórmulas I y II abarcan especialmente las sales de adición ácida de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción pesticida de los compuestos de fórmulas I o II.
- Los aniones de sales de adición ácida útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos C₁-C₄-alcanoicos, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Se
- 45 pueden formar haciendo reaccionar compuestos de fórmulas I y II con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.
- Sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los compuestos de fórmulas I y II abarcan especialmente las sales de adición ácida que son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso veterinario. Sales de adición ácida adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmulas I o II que contienen un átomo
- 50 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, sales de monoácidos o sales de diácido de ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, por ejemplo, las sales de monoácidos o sales de diácido de ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metano sulfénico, ácido metano sulfónico, y ácido succínico.

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 una unidad estructural de N-óxido.

5 El término "plaga de invertebrados" tal como se usa aquí abarca las poblaciones de animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos. Estas plagas pueden atacar las plantas causando de esta manera daños considerables a las plantas atacadas. El término "plaga animal" tal como se usa aquí también incluye ectoparásitos que pueden infestar animales, en particular los animales de sangre caliente, como por ejemplo, mamíferos o aves u otros animales superiores tales como reptiles, anfibios o peces, causando daños considerables a los animales infestados.

10 El término "material de propagación vegetal", tal como se usa aquí incluye todas las partes generativas de la planta tales como semillas y material vegetativo de la planta tales como esquejes y tubérculos (por ejemplo patatas), que pueden utilizarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, tallos, brotes y otras partes de plantas. También se pueden incluir las plántulas y plantas jóvenes, que son para ser trasplantados después de la germinación o después de emerger de la tierra. Estos materiales de propagación de las plantas pueden ser tratados de forma profiláctica con un compuesto de protección de las plantas, bien sea en o antes de la siembra o trasplante.

15 El término "plantas" comprende cualquier tipo de plantas, incluyendo "las plantas no cultivadas" y, en particular, las "plantas cultivadas"

El término "plantas no cultivadas" se relaciona con cualquier especie de tipo silvestre o especies relacionadas o géneros relacionados de una planta cultivada.

20 El término "plantas cultivadas" tal como se usa aquí incluye las plantas que han sido modificadas mediante el cruce, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas modificadas genéticamente son plantas, cuyo material genético ha sido modificado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que bajo circunstancias naturales no pueden ser fácilmente obtenidas por cruzamiento, las mutaciones o recombinación natural. Típicamente, uno o más genes se han integrado en el material genético de una planta modificada genéticamente con el fin de mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales modificaciones genéticas también incluye pero no se limitan a la modificación post-transicional específica de las proteínas (oligo o polipéptidos), por ejemplo, por glicosilación o adiciones de polímeros tales como unidades estructurales preniladas, acetiladas o farnesiladas o unidades estructurales de PEG (por ejemplo, como se describe 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, *Bioconjug. Chem.* 2005 Jan-Feb;16(1):113-21).

30 El término "plantas cultivadas" tal como se usa aquí incluye además las plantas que se han vuelto tolerantes a las aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonil ureas (véase, por ejemplo 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 (véase por ejemplo 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 el glufosato (véase por ejemplo WO 92/00377); inhibidores de la glutamina sintetasa (GS), tales como glufosinato (véase por ejemplo EP-A-0242236, EP-A-242246) u oxinil herbicidas (véase, por ejemplo US 5,559,024) como resultado de métodos convencionales de cruzamiento o de ingeniería genética. Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a los herbicidas por métodos convencionales de cruzamiento (mutagénesis), colza de verano Clearfield® (canola) que es tolerante a imidazolinonas, por ejemplo imazamox. Se han utilizado métodos de ingeniería genética para hacer que las plantas cultivadas, tales como la soja, el algodón, el maíz, la remolacha y la colza, sean tolerantes a los herbicidas, como el glifosato y glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente bajo el nombre comercial RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato).

45 El término "plantas cultivadas" tal como se usa aquí incluye además las plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente las conocidas del género bacteriano bacillus, particularmente de *Bacillus thuringiensis*, tales como endotoxinas, por ejemplo CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nemátodos, por ejemplo *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnidos, toxinas avispa, u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de *Streptomyces*, lectinas vegetales, tales como lectinas de guisantes o cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, patatina, inhibidores de cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de esteroides, tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdieteroide-IDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisona o HMG-CoA-reductasa; bloqueadores de los canales de iones, tales como bloqueadores de los canales de sodio o calcio; esterasa de la hormona juvenil; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); estilben sintasa, bibencil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención estas proteínas o toxinas insecticidas han de entenderse

expresamente también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o de otra manera modificadas. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios de la proteína, (véase, por ejemplo WO 02/015701). Ejemplos adicionales de tales toxinas o plantas genéticamente modificadas capaces de sintetizar tales toxinas se divulgan, por ejemplo, en el documento EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/018810 y WO 03/052073. Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente confieren a las plantas que producen estas proteínas protección contra las plagas perjudiciales de ciertos grupos taxonómicos de insectos artrópodos, en particular de los escarabajos (Coleoptera), moscas (Diptera), y las mariposas y polillas (Lepidoptera) y de nematodos parasíticos de plantas (Nematoda).

El término "plantas cultivadas" tal como se usa aquí incluye además las plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para incrementar la resistencia o tolerancia de esas plantas a patógenos bacterianos, virales o fúngicos. Ejemplos de tales proteínas son las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo EP-A 0 392 225), genes de resistencia a enfermedades de las plantas (por ejemplo cultivares de patata, que expresan genes de resistencia que actúan contra *Phytophthora infestans* derivada de la patata silvestre mexicana silvestre *Solanum bulbocastanum*) o lisozima T4- (por ejemplo, cultivares de patata capaces de sintetizar estas proteínas con una resistencia incrementada contra las bacterias tales como *Erwinia amylovora*). Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

El término "plantas cultivadas" tal como se usa aquí incluye además las plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinantes capaces de sintetizar una o más proteínas para incrementar la productividad (por ejemplo, la producción de biomasa, el rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteínas), la tolerancia a la sequía, salinidad o otros factores de crecimiento ambientales que limitan el crecimiento o la tolerancia a plagas, hongos, patógenos bacterianos o virales de esas plantas.

El término "plantas cultivadas" tal como se usa aquí incluye además las plantas que contienen por el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo cultivos oleosos que producen ácidos grasos omega 3 de cadena larga que promueven la salud o ácidos grasos omega-9 insaturados (por ejemplo colza de Nexera®).

El término "plantas cultivadas" tal como se usa aquí incluye además las plantas que contienen por el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la producción de materias primas, por ejemplo patatas que producen cantidades incrementadas de amilopectina (por ejemplo patata Amflora®).

Las unidades estructurales orgánicas mencionadas en las definiciones anteriores de las variables son - como el término halógeno - términos colectivos para listados individuales de los miembros individuales del grupo. El prefijo C_n-C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

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

El término "alquilo" tal como se usa aquí y en las unidades estructurales de alcoxi, alquilcarbonilo, alquil-tio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo y alcoxialquilo denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene usualmente de 1 a 10 átomos de carbono, con frecuencia de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente 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, tert-butilo, n-pentilo, 1- metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2- trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, n-heptilo, 1-metilhexilo, 2-metilhexilo, 3-metilhexilo, 4-metilhexilo, 5-metilhexilo, 1-etilpentilo, 2-etilpentilo, 3-etilpentilo, 1-propilpentilo, n-octilo, 1-metiloctilo, 2-metilheptilo, 1-etilhexilo, 2-etilhexilo, 1,2-dimetilhexilo, 1-propilpentilo y 2-propilpentilo.

El término "alquileno" (o alcanodiilo) tal como se usa aquí en cada caso denota un radical alquilo como se definió anteriormente, en donde un átomo de hidrógeno en cualquier posición del esqueleto de carbono es reemplazado por un sitio de enlazamiento adicional, formando así una unidad estructural bivalente.

El término "haloalquilo", tal como se usa aquí y en las unidades estructurales haloalquilo de haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilcarbonilo, haloalquilsulfonilo y haloalquilsulfonilo, denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene usualmente de 1 a 10 átomos de carbono, con frecuencia de 1 a 6 átomos de carbono, en donde los átomos de hidrógeno de este grupo se reemplazan parcialmente o totalmente con átomos de halógeno. Las unidades estructurales haloalquilo preferidas se seleccionan de C₁-C₄-haloalquilo, más preferiblemente de C₁-

C₂-haloalquilo, en particular de C₁-C₂-fluoroalquilo tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, y similares.

5 El término "alcoxi", tal como se usa aquí denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que está enlazado 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, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono átomos. Ejemplos de un grupo alcoxi son metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, n-butiloxi, 2-butiloxi, isobutiloxi, tert-butiloxi y similares.

10 El término "haloalcoxi" tal como se usa aquí 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, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, en donde los átomos de hidrógeno de este grupo se sustituyen parcial o totalmente con átomos de halógeno, en particular átomos de flúor. Unidades estructurales haloalcoxi preferidas incluyen C₁-C₄-haloalcoxi, en particular C₁-C₂-fluoroalcoxi, tales como fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro- 2,2-difluoroetoxi, 2,2dicloro-2-fluoretoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y similares.

15 El término "cicloalquilo" tal como se usa aquí y en los unidades estructurales cicloalquilo de cicloalcoxi y cicloalquilmetilo denota en cada caso un radical mono- o bicíclico cicloalifático que tiene usualmente 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.

20 El término "halocicloalquilo", tal como se usa aquí y en las unidades estructurales halocicloalquilo de halocicloalquilmetilo denota en cada caso un radical mono- o bicíclico cicloalifático que tiene usualmente de 3 a 10 átomos de carbono o de 3 a 6 átomos de carbono, en donde al menos uno, por ejemplo, 1, 2, 3, 4 o 5 de los átomos de hidrógeno son 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-trifluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, 1- y 2-clorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-diclorobciclopropilo, 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 aquí denota en cada caso un radical hidrocarburo insaturado individualmente que tiene usualmente de 2 a 10, preferiblemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo, vinilo, alil (2-propen-1-il), 1-propen-1-ilo, 2-propen-2-ilo, metalil (2- metilprop-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-2en-1-ilo, 2- etilprop-2-en-1-ilo y similares.

30 El término "alquino" tal como se utiliza aquí denota en cada caso un radical hidrocarburo insaturado individualmente que tiene usualmente de 2 a 10, preferiblemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo, etinilo, propargil (2-propin-1-il), 1-propin-1-ilo, 1-metilprop-2-en-1-il), 2-butin-1-ilo, 3-butin-1-ilo, 1-pentin-1-ilo, 3-pentin-1-ilo, 4-pentin-1-ilo, 1-metilbut-2-en-1-ilo, 1-etilprop-2 en-1-ilo y similares.

35 El término "alcoxialquilo", tal como se usa aquí, se relaciona con alquilo que comprende usualmente de 1 a 4 átomos de carbono, en donde 1 átomo de carbono lleva un radical alcoxi que comprende usualmente de 1 a 10, en particular de 1 a 4, átomos de carbono como se definió anteriormente. Ejemplos son C_{H2}OC_{H3}, C_{H2}-OC₂H₅, n-propoximetilo, C_{H2}-OCH(C_{H3})₂, n-butoximetilo, (1-metilpropoxi)-metilo, (2-metilpropoxi) metilo, C_{H2}-OC(C_{H3})₃, 2-(metoxi)etilo, 2-(etoxi)etilo, 2-(n-propoxi)-etilo, 2-(1-metiletoxi)-etilo, 2-(n-butoxi) etilo, 2-(1-metilpropoxi)-etilo, 2-(2-metilpropoxi)-etilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)-etilo, 2-(metoxi)-propilo, 2-(etoxi)-propilo, 2-(n-propoxi)-propilo, 2-(1-metiletoxi)-propilo, 2-(n-butoxi)-propilo, 2-(1-metilpropoxi)-propilo, 2-(2-metilpropoxi)-propilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)-propilo, 3-(metoxi)-propilo, 3-(etoxi)-propilo, 3-(n-propoxi)-propilo, 3-(1-metiletoxi)-propilo, 3-(n-butoxi)-propilo, 3-(1-metilpropoxi)-propilo, 3-(2-metilpropoxi)-propil; 3-(1,1-dimetiletoxi)- propilo, 2-(metoxi)-butilo, 2-(etoxi)-butilo, 2-(n-propoxi)-butilo, 2-(1-metiletoxi)-butilo, 2-(n-butoxi)-butilo, 2-(1-metilpropoxi)-butilo, 2-(2-metil-propoxi)-butilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)-butilo, 3-(metoxi)-butilo, 3-(etoxi)-butilo, 3-(n-propoxi)-butilo, 3-(1-metiletoxi)-butilo, 3-(n-butoxi)-butilo, 3-(1-metilpropoxi)-butilo, 3-(2- metilpropoxi)-butilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)-butilo, 4-(metoxi)-butilo, 4-(etoxi)-butilo, 4-(n-propoxi)-butilo, 4-(1-metiletoxi)- butilo, 4-(n-butoxi)-butilo, 4-(1-metilpropoxi)-butilo, 4-(2-metilpropoxi)-butilo, 4-(1,1-dimetiletoxi)-butilo y similares.

50 El término "alquilcarbonilo" (alquil-C (=O)-), tal como se utiliza aquí se relaciona con un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada como se definió anteriormente, que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= C₁-C₁₀-alquilcarbonilo), preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono (= C₁-C₄-alquilcarbonilo) unido a través del átomo de carbono del grupo carbonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquilcarbonilo", tal como se usa aquí se relaciona con un grupo alquilcarbonilo tal como se definió anteriormente en donde los átomos de hidrógeno son parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

55 El término "alquilitio" (también alquilsulfanilo o alquil-S-) "tal como se utiliza aquí se relaciona con un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (=C₁-C₁₀-alquilitio),

preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono (=C₁-C₄-alquiltio) como se definió anteriormente, que está unido a través de un átomo de azufre en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquiltio" tal como se utiliza aquí se relaciona con un grupo alquiltio tal como se definió anteriormente en donde los átomos de hidrógeno son parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

5 El término "alquilsulfínilo" (también alquilsulfoxilo o alquil-S(=O)-), tal como se usa aquí se relaciona con un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada como se definió anteriormente, que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (=C₁-C₁₀-alquilsulfínilo), preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono (=C₁-C₄-alquilsulfínilo) unido a través del átomo de azufre del grupo sulfínilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

10 El término "haloalquilsulfínilo" tal como se utiliza aquí se relaciona con un grupo alquilsulfínilo tal como se definió anteriormente en donde los átomos de hidrógeno son parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

15 El término "alquilsulfonilo" (también alquil-S(=O)₂-) tal como se utiliza aquí se relaciona con un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (=C₁-C₁₀-alquilsulfonilo), preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono (=C₁-C₄-alquilsulfonilo), tal como se definió anteriormente, el cual está unido a través del átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquilsulfonilo" tal como se utiliza aquí se relaciona con un grupo alquilsulfonilo como se definió anteriormente en donde los átomos de hidrógeno son parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

20 El término "heterociclilo" incluye, en general, radicales de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8 miembros, en particular, 5, 6, 7- u 8 monocíclicos heterocíclicos no aromáticos y 8 a 10 radicales de 8 a 10 miembros bicíclicos heterocíclicos no aromáticos, los radicales mono- y bicíclicos aromáticos pueden ser saturados o insaturados. Los radicales mono- y bicíclicos heterocíclicos no aromáticos usualmente comprenden 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros del anillo, donde los átomos S como miembros del anillo pueden estar presente como S, SO o SO₂.

25 El término "heteroarilo" incluye, en general, radicales de 5 o 6 miembros insaturados monocíclicos heterocíclicos y radicales de 8 a 10 miembros insaturados bicíclicos heterocíclicos que son aromáticos, esto es, que cumplen con la regla de Hückel (regla de 4n+ 2). Heterarilo usualmente comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros del anillo.

30 El término "heterarilo" incluye radicales heteroaromáticos monocíclicos de 5 o 6 miembros que comprenden como miembros del anillo 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S. Ejemplos de radicales heteroaromáticos de 5 o 6 miembros incluyen piridilo, esto es 2-, 3-, o 4-piridilo, pirimidinilo, esto es 2-, 4- o 5-pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, esto es 3- o 4-piridazinilo, tienilo, esto es 2- o 3-tienilo, furilo, esto es 2- o 3-furilo, pirrolilo, esto es 2- o 3-pirrolilo, oxazolilo, esto es 2-, 3- o 5-oxazolilo, isoxazolilo, esto es 3-, 4- o 5-isoxazolilo, tiazolilo, esto es 2-, 3- o 5-tiazolilo, isotiazolilo, esto es 3-, 4- o 5-isotiazolilo, pirazolilo, esto es 1-, 3-, 4- o 5- pirazolilo, esto es 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, 1H-, 2H-, o 4H-1,2,4-triazolilo y tetrazolilo, esto es 1 H- o 2H-tetrazolilo.

40 El término "heterarilo" incluye también radicales heteroaromáticos bicíclicos de 8 a 10 miembros que comprende como miembros del anillo 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, en donde un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros está fusionado con un anillo de fenilo o a un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros. Ejemplos de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros fusionado con un anillo de fenilo o a un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros incluyen benzofuranilo, benzotienilo, indolilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzoxatiazolilo, benzoxadiazolilo, benzotiadiazolilo, benzoxazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, purinilo, 1,8-naftiridilo, pteridilo, pirido[3,2-d]pirimidilo o piridoimidazolilo y similares. Estos radicales heterarilo fusionados pueden estar enlazados al resto de la molécula a través de cualquier átomo del anillo de anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o a través de un átomo de carbono de la unidad estructural fenilo fusionada.

50 Ejemplos de radicales heterocíclicos saturados o insaturados de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8 miembros comprenden anillos heterocíclicos saturados o insaturados, no aromáticos, tales como oxiranilo, oxetanilo, tietanilo, tietanil-S-oxid (S-oxotietanil), tietanil-S-dioxid (S-dioxotietanil), pirrolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahidrofurano, dihidrofurano, 1,3-dioxolanilo, dioxolenilo, tiolanilo, S-oxotiolanilo, S-dioxotiolanilo, dihidrotienilo, S-oxodihidrotienilo, S-dioxodihidrotienilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, tiazolinilo, isotiazolinilo, tiazolidinilo, isotiazolidinilo, oxatolanilo, piperidinilo, piperazinilo, piranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, 1,3- y 1,4- dioxanilo, tiopiranilo, S-oxotiopiranilo, S-dioxotiopiranilo, dihidrotiopiranilo, S-oxodihidrotiopiranilo, S-dioxodihidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, S-oxotetrahidrotiopiranilo, S-dioxotetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, S-oxotiomorfolinilo, S-dioxotiomorfolinilo, tiazinilo y similares.

Ejemplos para anillo heterocíclico que también comprende 1 o 2 grupos carbonilo como miembros de anillo comprenden pirrolidin-2-solo, pirrolidin-2,5-dionilo, imidazolidin-2-solo, oxazolidin-2-solo, tiazolidin-2-solo y similares.

5 Los términos "fenilalquilo" y "fenoxialquilo" se relaciona con fenilo o fenoxi, respectivamente, los cuales están enlazados a través de un grupo alquilo, en particular un grupo metilo (= hetarilmetilo), para el resto de la molécula, incluyendo ejemplos de bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, 2-fenoxietilo y similares.

Los términos "heterociclilalquilo" y "hetarilalquilo" se relacionan con hetarilo o heterociclilo, respectivamente, como se definió anteriormente los cuales están enlazados a través de un grupo alquilenos, en particular un grupo metileno (= heterocicilmetilo o hetarilmetilo, respectivamente) o un grupo 1,1-etandiilo o 1,2-etandiilo (= 1-heterocicililetilo, 2-heterocicililetilo, 1-hetariletilo o 2-hetariletilo, respectivamente), para el resto de la molécula.

10 Las observaciones hechas a continuación como realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmulas I o II son válidos por su propia cuenta, así como – preferiblemente - en combinación unos con otros. Las observaciones hechas a continuación en relación con las realizaciones preferidas de las variables adicionales son válidas en relación con los compuestos de fórmulas I o II, así como en relación con los usos y métodos de acuerdo con la invención y la composición de acuerdo con la presente invención.

15 Una realización particular de la invención se relaciona con los compuestos de pirazol de fórmulas I y II, con sus sales y con sus N-óxidos, en donde X^1 , X^2 y R^1 tienen los siguientes significados:

20 X^1 es S, O o NR^{1a} , en donde R^{1a} es seleccionado de hidrógeno, C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilmetilo, C_3 - C_{10} -halocicloalquilo, C_2 - C_{10} -alqueno, C_2 - C_{10} -haloalqueno, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_1 - C_{10} -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, OR^a , fenilo, hetarilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi;

25 X^2 es OR^{2a} , $NR^{2b}R^{2c}$, $S(O)_mR^{2d}$, en donde m es 0, 1 o 2, en donde R^{2a} es seleccionado de C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alqueno, C_2 - C_4 -haloalqueno, C_2 - C_4 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi C_1 - C_4 -alquilo, fenilo, hetarilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de hidrógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi, y en donde R^{2b} , R^{2c} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alqueno, C_2 - C_4 -haloalqueno, C_2 - C_4 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -alquilcarbonilo, C_1 - C_4 -haloalquilcarbonilo, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilocarbonilo, hetarilosulfonilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos ocho radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi, o R^{2b} y R^{2c} junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros, saturado o insaturado, que puede llevar un átomo adicional seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi, y en donde R^{2d} es seleccionado de C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alqueno, C_2 - C_4 -haloalqueno, C_2 - C_4 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, fenilo, hetarilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi;

45 R^1 es hidrógeno, CN, C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_3 - C_{10} -halocicloalquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilmetilo, C_3 - C_{10} -halocicloalquilmetilo, C_2 - C_{10} -alqueno, C_2 - C_{10} -haloalqueno, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_3 - C_{10} -haloalquinilo, C_1 - C_4 -alquilen-CN, OR^a , C_1 - C_4 -alquilen- OR^a , $C(Y)R^b$, C_1 - C_4 -alquilen- $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, C_1 - C_4 -alquilen- $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , C_1 - C_4 -alkyleri- NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, C_1 - C_4 -alquilen- $C(Y)NR^gR^h$, $S(O)_mNR^eR^f$, $C(Y)NR^iNR^eR^f$, fenilo, hetarilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo en donde el anillo aromático de los últimos cuatro radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes y en donde m es 0, 1 o 2;

en donde Y es O o S;

55 R^a , R^b , R^c son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalquilmetilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_2 - C_4 -alqueno, C_2 - C_4 -haloalqueno, C_2 - C_4 -alquinilo, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, fenilo, hetarilo, fenil- C_1 - C_4 -alquilo y hetarilo- C_1 - C_4 -alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi;

- 5 R^d es seleccionado de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 10 R^e , R^f son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilo-carbonilo, hetarilsulfonilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos ocho radicales mencionados puede ser no sustituido o, puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi; o
- 15 R^e y R^f junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo de 5 o 6 miembros, saturado o insaturado, que puede llevar un átomo adicional seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 20 R^g , R^h son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los últimos cuatro radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes los cuales son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 25 R_i es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenil y fenilo-C₁-C₄-alquilo en donde el anillo de fenilo en los últimos dos radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 30 y en donde A es un radical pirazol de fórmulas A1, A2 o A3 como se definió anteriormente en donde las variables R^1 , R^{41} , R^{42} , R^{43} , R^{51} , R^{52} , R^{53} , R^{61} , R^{62} y R^{63} son como se definió anteriormente:
- 35 R^{41} , R^{42} , R^{43} y R^{51} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno y C₂-C₁₀-alquino, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes,
- o en donde R^{41} , R^{42} , R^{43} y R^{51} son seleccionados además de OR^a, SR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, hetarilo, heterociclilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₅-C₁₀-cicloalqueno y fenilo, en donde los últimos cinco radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, y en donde
- 40 R^{52} , R^{53} son seleccionados de hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno y C₂-C₁₀-alquino, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes,
- o en donde R^{52} , R^{53} son seleccionados además de OR^a, SR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, hetarilo, heterociclilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₅-C₁₀-cicloalqueno y fenilo, en donde los últimos cinco radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, y en donde R^{61} , R^{62} , R^{63} son seleccionados de hidrógeno, CN, NO₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno y C₂-C₁₀-alquino, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, o en donde R^{61} , R^{62} , R^{63} son seleccionados 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)NRⁱNR^eR^f, heterociclilo, hetarilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₅-C₁₀-cicloalqueno y fenilo, en donde los últimos cinco radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^y idénticos o diferentes y donde m es 0, 1 o 2;
- 50 donde R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , R^f , R^g , R^h y R_i son como se definió anteriormente en conexión con R^1 y en donde: R^x son independientemente uno de otro seleccionados de ciano, nitro, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilitio, C₁-C₄-haloalquilitio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₁₀-alquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, heterociclilo de 5- a 7- miembros, fenilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, heterociclilo y fenoxi de 3- a 6- miembros, en donde los 6 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2,
- 55 3, 4 o 5 radicales R^y ;

y en donde R^y es seleccionado de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfino, C₁-C₄-haloalquilsulfino, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo.

- 5 Una primera realización preferida de la invención se relaciona con los compuestos de pirazol de la fórmula I, con sus sales y con sus N-óxidos.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a aquellos compuestos, en donde X¹ es oxígeno. Estos compuestos también se denominan de aquí en adelante como compuestos de fórmula I'.

- 10 Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia además a aquellos compuestos, en donde R¹ es hidrógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-haloalqueno, C₂-C₁₀-alquino, C₁-C₄-alquilen-CN, OR^a, C₁-C₄-alquilen-OR^a, en particular C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C(Y)R^b, C(Y)OR^c o S(O)₂R^d.

- 15 Entre los compuestos de la fórmula I, del mismo modo se da preferencia además a aquellos compuestos, en donde R¹ es seleccionado del grupo que consiste de C₁-C₄-alquilen-CN, C₁-C₄-alquilen-OR^a, C₁-C₄-alquilen-C(Y)R^b, C₁-C₄-alquilen-NR^eR^f, C₁-C₄-alquilen-C(Y)NR^gR^h, fenil-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^x y R^y, los cuales son como se definió anteriormente y que se seleccionan preferiblemente de halógeno, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

- 20 En una realización preferida en particular o la invención, R¹ es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo. Entre los compuestos de esta realización preferida particular, se da preferencia a compuestos en donde R¹ es hidrógeno o C₁-C₃ alquilo. Entre los compuestos de esta realización preferida particular, del mismo modo se da preferencia a compuestos, en donde R¹ es C₁-C₃-haloalquilo o C₁-C₂-alcoxi-C₁-C₂-alquilo.

- 25 En otra realización preferida particular o la invención, R¹ es seleccionado del grupo que consiste de C₁-C₄-alquilen-NR^eR^f, fenil-C₁-C₄-alquilo, en particular bencilo, 1-feniletilo o 2-feniletilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, en particular heterocicilometilo, 1-heterociciloetilo o 2-heterociciloetilo, y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en particular hetarilometilo, 1-hetariloetilo o 2-hetariloetilo, en donde los últimos doce radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2 o 3 radicales R^x, que se definen como anteriormente y que se seleccionan preferiblemente de halógeno, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

Ejemplos de radicales R¹ preferidos incluyen:

- 30 - C₁-C₄-alquilo, tales como metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, tert.-butilo o 2-metilpropil;
- C₁-C₄-haloalquilo, tales como 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, 2-brometilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloroetilo, 2,2-dibromoetilo o 2,2,2-trifluoroetilo;
- C₃-C₄-alqueno tales como 2-propenilo;
- C₃-C₄-haloalqueno tales como 3,3-dicloro-2-propenilo o 3,3-dibromo-2-propenilo;
- 35 - C₁-C₄-alquilen-CN tales como cianometilo o cianoetilo;
- C₁-C₄-alquilen-OR^a tales como metoximetilo, etoximetil 2-metoxietilo o 2-etoxietilo;
- C₁-C₄-alquilen-NR^eR^f tales como 2-(dimetilamino)etilo;
- C₁-C₄-alquilen-C(Y)NR^gR^h tales como N,N-dimetilcarbamoilmetilo o N,N-dimetiltiocarbamoilmetil
- C₃-C₆-cicloalquilo, tales como ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo;
- 40 - C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, en particular C₃-C₆-cicloalquilmetilo, 1-C₃-C₆-cicloalkyletilo o 2-C₃-C₆-cicloalkyletilo tales como ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo o ciclopentilmetilo;
- fenil-C₁-C₄-alquilo, en particular bencilo, 1-feniletilo o 2-feniletilo, en donde los radicales fenilo pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2 o 3 radicales R^x como se definió anteriormente, por ejemplo bencilo;
- 45 - heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, en particular heterocicilometilo, 1-heterociciloetilo o 2-heterociciloetilo, en donde los radicales heterociclilo pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2 o 3 radicales R^x como se definió anteriormente, por ejemplo oxetan-2-ilmetilo, oxetan-3-ilmetilo, tietan-3-ilmetilo, 3,3-dioxatietan-3-ilmetilo, oxolan-2-ilmetilo, oxolan-

3-ilmetilo, oxazolin-2-ilmetilo, tiazolin-2-ilmetilo, 1H-imidazolin-2-ilmetilo, 1-metil-1H-imidazolin-2-ilmetilo o 5,5-dimetiltetrahidrofuran-2-ilmetilo; y

- hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en particular hetarilometilo, 1-hetariloetilo o 2-hetariloetilo,

5 en donde los radicales hetarilo pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2 o 3 radicales R^x como se definió anteriormente, por ejemplo 2- furilmetilo, 3-furilmetilo, 5-metilfuran-2-ilmetilo, 2-tienilmetilo, 3-tienilmetilo, isotiazol-3-ilmetilo, isotiazol- 4-ilmetilo, isotiazol-5-ilmetilo, isoxazol-3-ilmetilo, isoxazol-4-ilmetilo, isoxazol-5-ilmetilo, oxazol-2-ilmetilo, oxazol-4-ilmetilo, oxazol-5-ilmetilo, tiazol-2-ilmetilo, tiazol-4-ilmetilo, tiazol-5-ilmetilo, 1 H-pirazol-3- ilmetilo, 1 H-pirazol-4-ilmetilo, 2H-pirazol-3-ilmetilo, 1-metil-1H-pirazol-3-ilmetilo, 1-metil-1 H-pirazol-4- ilmetilo, 1-fenil-1 H-pirazol-4-ilmetilo, 2-metil-2H-pirazol-3-ilmetilo, 1 H-imidazol-2-ilmetilo, 1 H-imidazol- 4-ilmetilo, 1 H-imidazol-5-ilmetilo, 1-metil-1H-imidazol-2-ilmetilo, 1-metil-1H-imidazol-4-ilmetilo, 1-metil- 1 H-imidazol-5-ilmetilo, 2-piridilmetilo o 3-piridilmetil.

15 Otra realización de la invención se relaciona con compuestos de pirazol de la fórmula II, con las sales y N-óxidos de los mismos y con los métodos y usos de tales compuestos. En los compuestos de la fórmula II, se da preferencia a aquellos compuestos, en donde X² en la fórmula II es OR^{2a} o SR^{2a}. En estos compuestos R^{2a} es preferiblemente C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-alqueno, C₃-C₆-alquino, C₃-C₆-cicloalquilmetilo o C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₁₀-alquilo.

20 Otra realización de la invención se relaciona con compuestos de la fórmula II, en donde X² es NR^{2b}R^{2c}. En estos compuestos R^{2b} y R^{2c} se seleccionan preferiblemente, independientemente uno del otro, de C₁-C₆- alquilo, C₃-C₆- cicloalquilmetilo o C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₁₀-alquilo o R^{2b} y R^{2c}, junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un heterociclo de 5 ó 6 miembros enlazado a nitrógeno saturado 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 aquellos compuestos, en donde R^u es seleccionado de hidrógeno, halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo.

25 Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia adicional a aquellos compuestos, en donde R^w es hidrógeno, esto es, W es CH.

Entre los compuestos de fórmulas I y II se da preferencia además a aquellos compuestos, en donde R^t y R^u se seleccionan independientemente uno del otro de hidrógeno, halógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi. Más preferiblemente al menos dos de los radicales R^t, R^u, o RW son hidrógeno.

30 Otra realización preferida se relaciona con compuestos de fórmulas I y II, en donde R^t y R^u, si están presentes, se seleccionan independientemente el uno del otro de hidrógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

35 Otra realización preferida de la invención se relaciona con compuestos de pirazol las fórmulas I y II, con las sales y N-óxidos de los mismos y con los métodos y usos de tales compuestos, en donde A es un radical A1. Entre los compuestos, en donde A es A1, se da preferencia a compuestos de la fórmula I, en donde X¹, R¹, R^t, R^u, y R^w se definen como anteriormente y, en particular tienen uno de los significados preferidos.

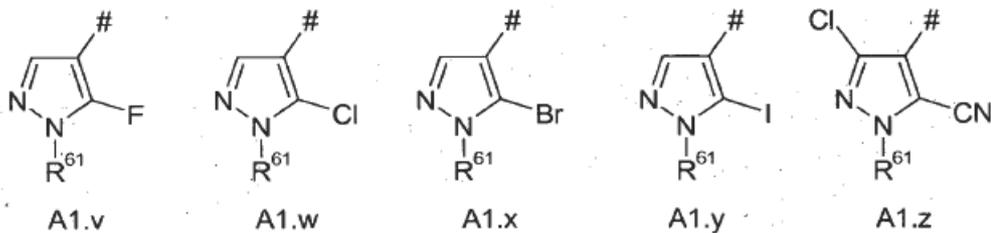
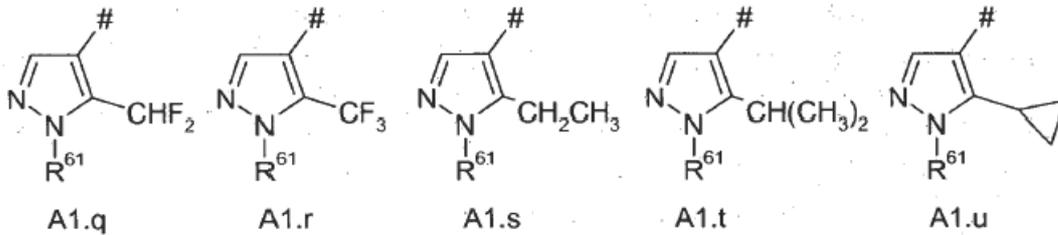
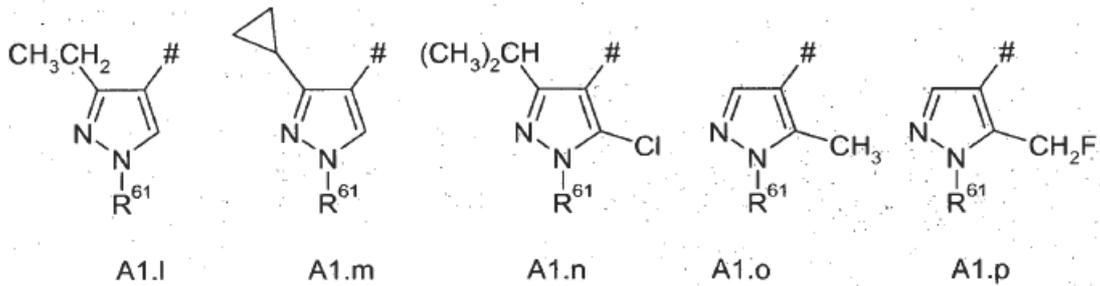
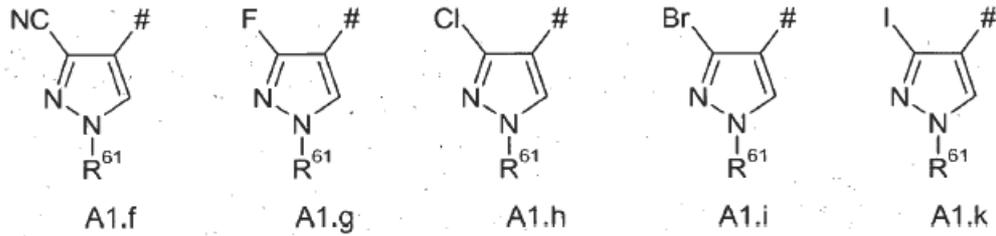
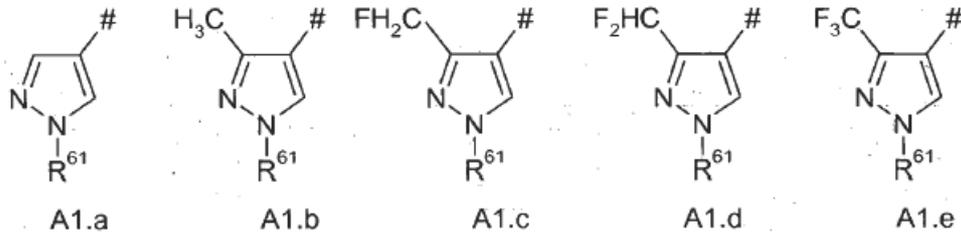
40 Entre los compuestos de fórmulas I y II, en donde A es A1, se da preferencia a aquellos compuestos, en donde R⁴¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄- alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, puede ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, heteroarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁴¹ es seleccionado además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

45 Preferiblemente R⁴¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Más preferiblemente R⁴¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo, en particular de hidrógeno, metilo, difluorometilo y trifluorometilo. En particular R⁴¹ es hidrógeno.

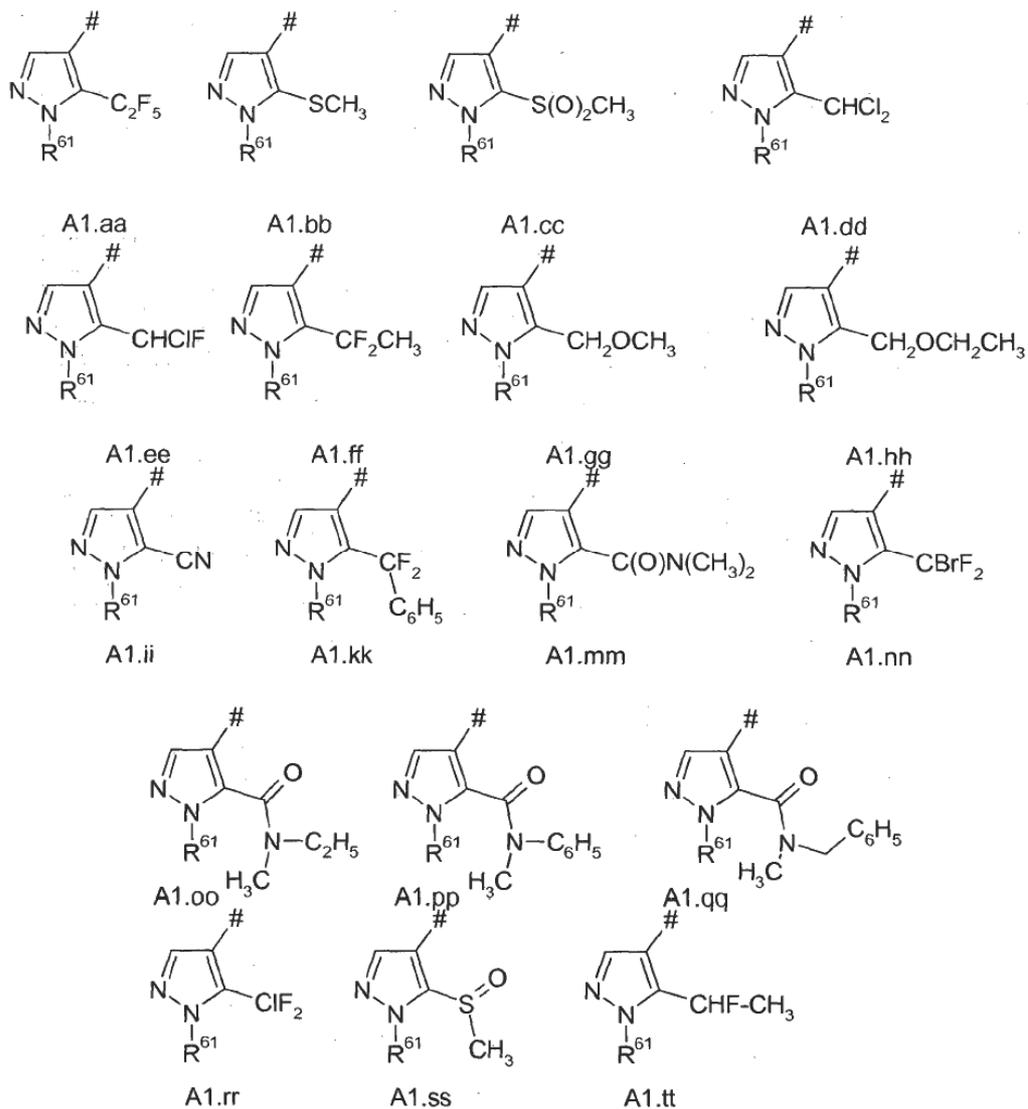
50 Entre los compuestos de fórmulas I y II, en donde A es A1, se da preferencia adicional a aquellos compuestos, en donde R⁵¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los 2 últimos

- radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenil y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁵¹ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.
- Preferiblemente, R⁵¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi- C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C(O)NR⁹R^h, bencilo y fenilo, en donde fenilo y bencilo pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. En particular, R⁵¹ es, seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Más preferiblemente R⁵¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo. En una realización particular preferida R⁵¹ es hidrógeno. En una realización igualmente preferida R⁵¹ es seleccionado de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi- C₁-C₄-alquilo y C₃-C₆-cicloalquilo, en particular de cloro, bromo, yodo, metil etilo, isopropilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, clorodifluorometilo, clorodifluorometilo, metoximetil, etoximetil y ciclopropil. En otra realización igualmente preferida R⁵¹ es un radical C(O)NR⁹R^h, en donde R⁹ y R^h son como se definen aquí, y en donde R⁹ es preferiblemente hidrógeno o metilo y R^h es preferiblemente hidrógeno, alquilo o bencilo. En una realización adicional igualmente preferida R⁵¹ es un radical SR^a o S(O)QRD, en donde q es 1 o 2 y en donde R^a y R^d son como se definen aquí, y en donde R^a y R^d son preferiblemente C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄ haloalquilo.
- Preferiblemente, el radical R⁴¹ es hidrógeno, si R⁵¹ es diferente de hidrógeno. Preferiblemente, el radical R⁵¹ es hidrógeno, si R⁴¹ es diferente de hidrógeno. Igualmente preferidos son los compuestos de la presente invención, en donde R⁴¹ y R⁵¹ son ambos hidrógeno.
- Entre los compuestos de fórmulas I y II, en donde A es A1, se da preferencia adicional a aquellos compuestos, en donde n R⁶¹ es seleccionado de, hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, puede ser parcial o totalmente halogenados o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenil y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁶¹ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO₂, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.
- Preferiblemente R⁶¹ es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de, NO₂ C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y C₃-C₆-cicloalquilo, en particular de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi.
- Preferiblemente de la misma forma, R⁶¹ es seleccionado de hetarilo de 5- o 6- miembros, en particular de piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, tetrazolilo y 1,2,4-triazolilo, en donde hetarilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno,, NO₂ C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y fenilo.
- En una realización particular preferida R⁶¹ es hidrógeno, C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-haloalquilo. En esta realización particular preferida R⁶¹ es especialmente seleccionado de metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, isobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 2,2-difluoroetilo y 2,2,2-trifluoroetilo, con especial preferencia dada a metilo y 2, 2,2-trifluoroetilo.
- En otra realización particular preferida R⁶¹ es seleccionado de hetarilo de 5- o 6- miembros, en particular de piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, tetrazolilo, 1,2,3-triazolilo y 1,2,4-triazolilo, en donde hetarilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno,, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, y fenilo. En esta realización particular preferida R⁶¹ es por ejemplo seleccionado de: 5-cloro-2-piridilo, 3-cloro-5-trifluoro-metilpiridine-2-ilo, 3-piridilo, 4- piridilo, 2-tiazolilo, 4,5-dimetil-tiazol-2-ilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 4-trifluorometil-

- 5 tiazol-2-ilo, 4-metiltiazol-2-ilo, 4- feniltiazol-2-ilo, 5-1,2,4-triazolilo; 3-metil-triazol-5-ilo, 4-nitro-1-pirazolilo-metilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-metilisoxazol-5-ilo, 5-metilisoxazol- 3-ilo, 3-pirazolilo, [1,3,4]tiadiazol-2-ilo, 5-tetrazolilo, 6-cloro-2-piridilo, 5-nitro-2-piridilo, 3-nitro-2-piridilo, 6-metil-5-nitro- 2-piridilo, pirazin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, tiofeni-3-ilo, 1-metil-[1,2,3]-triazol-4-ilo, 1-fenil-[1,2,3]-triazol-4-ilo, 4-metil- 5-isopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-5-ciclopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-5-trifluorometil- 4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4,5-dimetil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-5-etil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-isopropil- 4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-ciclopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-etil-4H-[1,2,4]-triazol-3- ilo, 4-fenil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 5-trifluorometil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 5-fenil-1,3,4- oxadiazol-2-ilo, 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 5-fenil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.
- 10 En una realización particular preferida adicional R^{61} es fenilo, que es no sustituido o que lleva 1, 2 o 3 radicales seleccionados de halógeno, NO_2 C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfonilo, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonilo, C_1 - C_4 -alcoxi y C_1 - C_4 -haloalcoxi. En esta realización particular preferida R^{61} es por ejemplo seleccionado de fenilo, 2-nitrofenilo, 3-nitrofenilo, 4-nitrofenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2- fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 2,4,6-triclorofenilo, 2,3,4-trichlorfenilo, 2,4-difluorofenilo, 2,6-difluorofenil; 4-cloro-2-fluorofenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 4-difluorometoxifenilo, 4-(trifluorometiltio) fenilo, 4-(trifluorometilsulfonil)fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-(isopropil) fenilo, 4-(heptafluoroisopropil)fenilo, 2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil y 4-trifluorometilfenil.
- 15
- 20 En una realización particular preferida adicional R^{61} es C_1 - C_4 -alcoxi- C_2 - C_4 - alquilo, en particular 2-metoxietilo o 2-etoxietilo. En una realización particular preferida adicional R^{61} es C_2 - C_4 -alqueno, en vinilo o 2-propenilo.
- 25 Preferiblemente, uno o ambos de los radicales R^{41} y R^{51} son hidrógeno, mientras que R^{61} es diferente de hidrógeno.
- Ejemplos de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d, A1.e, A1.f, A1.g, A1.h, A1.i, A1.k, A1.l, A1.m, A1.n, A1.o, A1.p, A1.q, A1.r, A1.s, A1.t, A1.u, A1.v, A1.w, A1.x, A1.y y A1.z, en donde R^{61} es como se define aquí, y en donde R^{61} es, por ejemplo un radical como se define en una línea de la tabla A1 (radicales A1.a1 - A1.a111 a A1.z1 - A1.z111):



Ejemplos adicionales de radicales A1 adecuados son los radicales de las fórmulas A1.aa, A1.bb, A1.cc, A1.dd, A1.ee, A1.ff, A1.gg, A1.hh, A1.ii, A1.kk, A1.mm, A1.nn, A1.oo, A1.pp, A1.qq, A1.rr, A1.ss y A1.tt, en donde R⁶¹ es como se define aquí, y en donde R⁶¹ es por ejemplo un radical como se define en una línea de la tabla A1 (radicales A1.aa1 - A1.aa111 a A1.tt1-A1.tt111):



Se da particular preferencia a los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d, A1.e, A1.f, A1.o, A1.q, A1.r, A1.s, A1.t, A1.u, A1.v, A1.w, A1.x y A1.y. También se da particular preferencia a los radicales de las fórmulas A1.aa, A1.bb, A1.cc, A1.dd, A1.ee, A1.gg, A1.hh, A1.ii, A1.rr, A1.ss y A1.tt.

Tabla A.

línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
1	H
2	CH ₃
3	CH ₂ CH ₃
4	CH ₂ CH ₂ CH ₃
5	CH(CH ₃) ₂

línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
6	CH ₂ CF ₃
7	C(CH ₃) ₃
8	C ₆ H ₅
9	4-Cl-C ₆ H ₄
10	4-F-C ₆ H ₄

línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
11	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
12	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄
13	2-piridilo
14	5-cloro-2-piridilo
15	CH ₂ -C ₆ H ₅
16	4-(OCF ₃)-C ₆ H ₄
17	4-(SCF ₃)-C ₆ H ₄
18	4-(OCHF ₂)-C ₆ H ₄
19	4-(CF(CF ₃) ₂)-C ₆ H ₄
20	4-(SO ₂ CH 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-chlorobenzilo
35	4-nitro-1-pirazolil-metilo
36	2-imidazolilo
37	4-imidazolilo
38	5-imidazolilo
39	2-oxazolilo
40	4-oxazolilo
41	5-oxazolilo
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

línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
49	5-tetrazolilo
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-fenil -C ₆ H ₄
68	3-fenil -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
78	CHCl ₂
79	CCl ₃
80	CH ₂ CHCl ₂
81	CH ₂ CCl ₃
82	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
83	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
84	2-NO ₂ -C ₆ H ₄
85	6-cloro-2-piridilo
86	5-nitro-2-piridilo
87	3-nitro-2-piridilo

línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
88	6-metil-5-nitro-2-piridilo
89	pirazin-2-ilo
90	pirimidin-2-ilo
91	tiofen-3-ilo
92	4-metil-5-isopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
93	4-metil-5-ciclopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
94	4-metil-5-trifluorometil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
95	4,5-dimetil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
96	4-metil-5-etil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
97	4-isopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
98	4-ciclopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
99	4-metil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
100	4-etil-4H-[1,2,4]-triazol-3-

línea	Radical R ⁶¹ /R ⁵² /R ⁵³ /R ⁶³
	ilo
101	4-fenil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo
102	5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
103	vinilo
104	2-propenilo
105	5-fenil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
106	5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo
107	5-fenil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo
108	5-trifluorometil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo
109	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo
110	1-metil-1,2,3-triazol-4-ilo
111	1-fenil-1,2,3-triazol-4-ilo

5 Una realización adicional de la invención se relaciona con compuestos de pirazol de fórmulas I y II, con las sales y N-óxidos de los mismos y con los métodos y usos de tales compuestos, en donde A es un radical A2. Entre los compuestos de fórmulas I y II, en donde A es un radical A2, se da preferencia a los compuestos de las fórmulas I o II, en donde X¹, R¹, Rⁱ, R^u y R^w son como se definieron anteriormente y en particular tienen uno de los significados preferidos.

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

20 Entre los compuestos de las fórmulas I y II, en donde A es A2, se da preferencia a aquellos compuestos, en donde R⁴² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₃-alquilo y C₂-C₃-alqueno, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₃-alcoxi, C₁-C₃-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-heteroarilo, fenilo y fenoxi; en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₁-C₃-alcoxi, C₁-C₃-haloalcoxi, C₁-C₃-alquilsulfonilo y C₁-C₃-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁴² se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₁-C₃-alcoxi, C₁-C₃-haloalcoxi, C₁-C₃-alquilsulfonilo y C₁-C₃-haloalquilsulfonilo. Más preferiblemente R⁴² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de

halo-gen, C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₁-C₃-alcoxi y C₁-C₃-haloalcoxi; en particular R⁴² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₃-alquilo, C₁-C₃-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo.

5 Preferiblemente R⁴² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Más preferiblemente R⁴² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo. En particular R⁴² es hidrógeno.

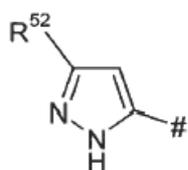
10 Entre los compuestos de fórmulas I y II en donde A es A2, se da preferencia adicional a aquellos compuestos, en donde R⁵² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenado o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁵² se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

15
20 Preferiblemente R⁵² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo, pueden ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Más preferiblemente R⁵² es hidrógeno, C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-haloalquilo. En particular R⁵² es hidrógeno.

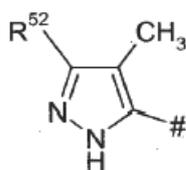
25 Entre los compuestos de fórmulas I y II en donde A es A2, se da preferencia adicional a aquellos compuestos, en donde R⁶² es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenado o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo; C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo o en donde R⁶² se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO₂, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

30
35 Preferiblemente R⁶² es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₂-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Más preferiblemente R⁶² es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₂-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo. En particular R⁶² es hidrógeno.

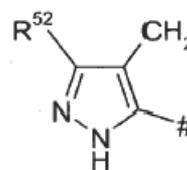
40 Ejemplos de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.aa, A2.ab, A2.ac, A2.ad, A2.ae, A2.af, A2.ag, A2.ah, A2.ai, A2.ak, A2.al, A2.am, A2.an y A2.ao, en donde R⁶² es hidrógeno y R⁵² es un radical como se definió en una línea de la tabla A (radicales A2.aa1 - A2.aa111 a A2.ao1 - A2.ao111):



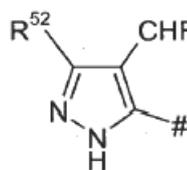
A2.aa



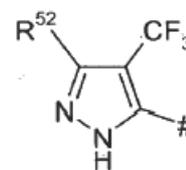
A2.ab



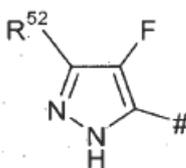
A2.ac



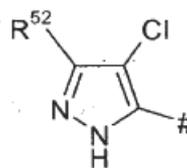
A2.ad



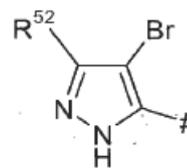
A2.ae



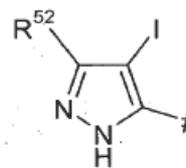
A2.af



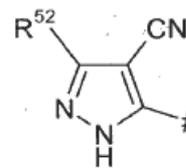
A2.ag



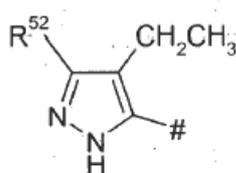
A2.ah



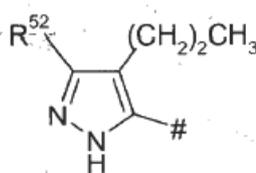
A2.ai



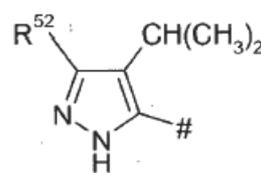
A2.ak



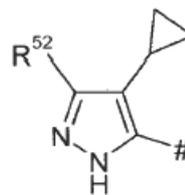
A2.al



A2.am



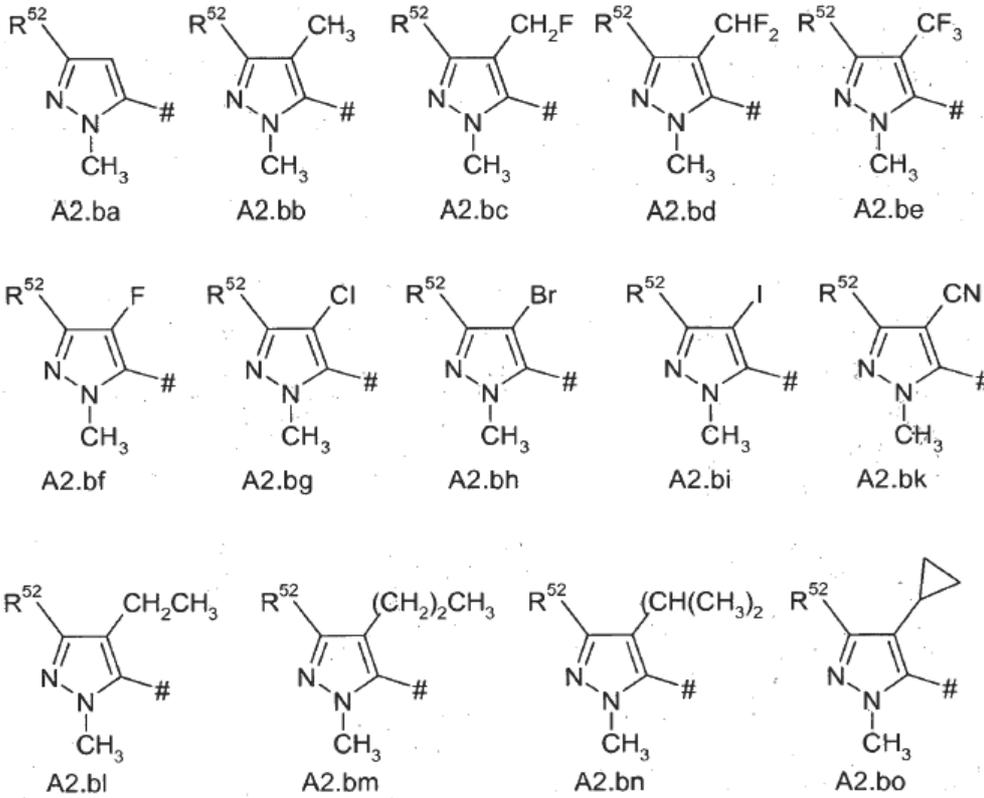
A2.an



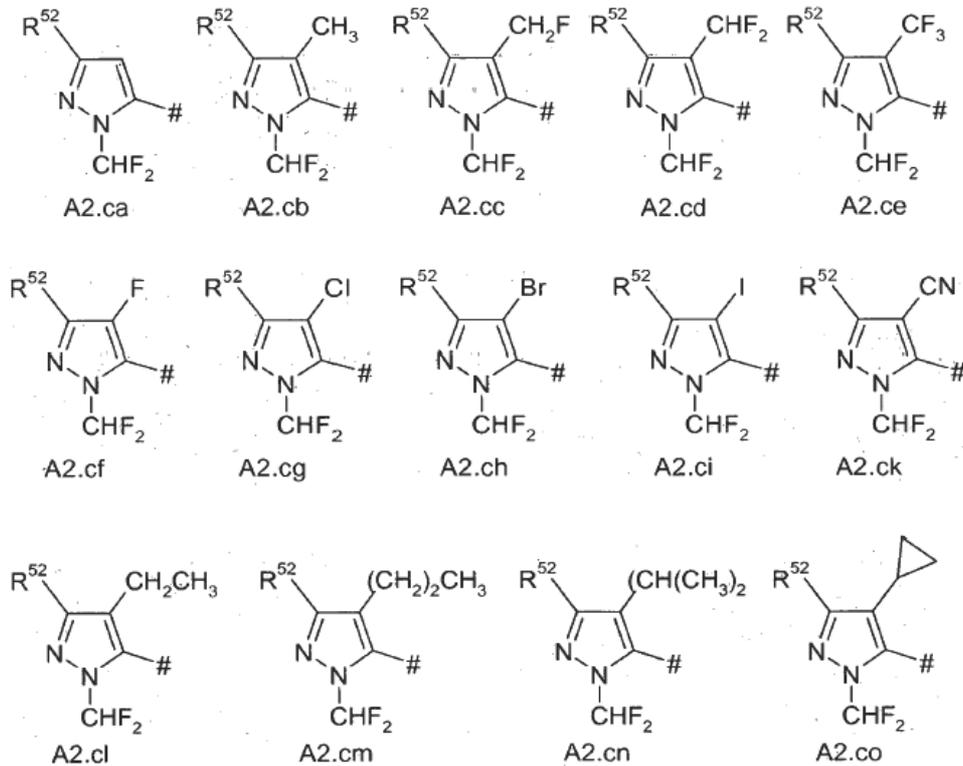
A2.ao

Ejemplos adicionales de radicales A2 adecuados son los radicales 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 donde R^{62} es CH_3 y R^{52} es como se definió en una línea de la tabla A (radicales A2.ba1 - A2.ba111 a A2.bo1 - A2.bo111):

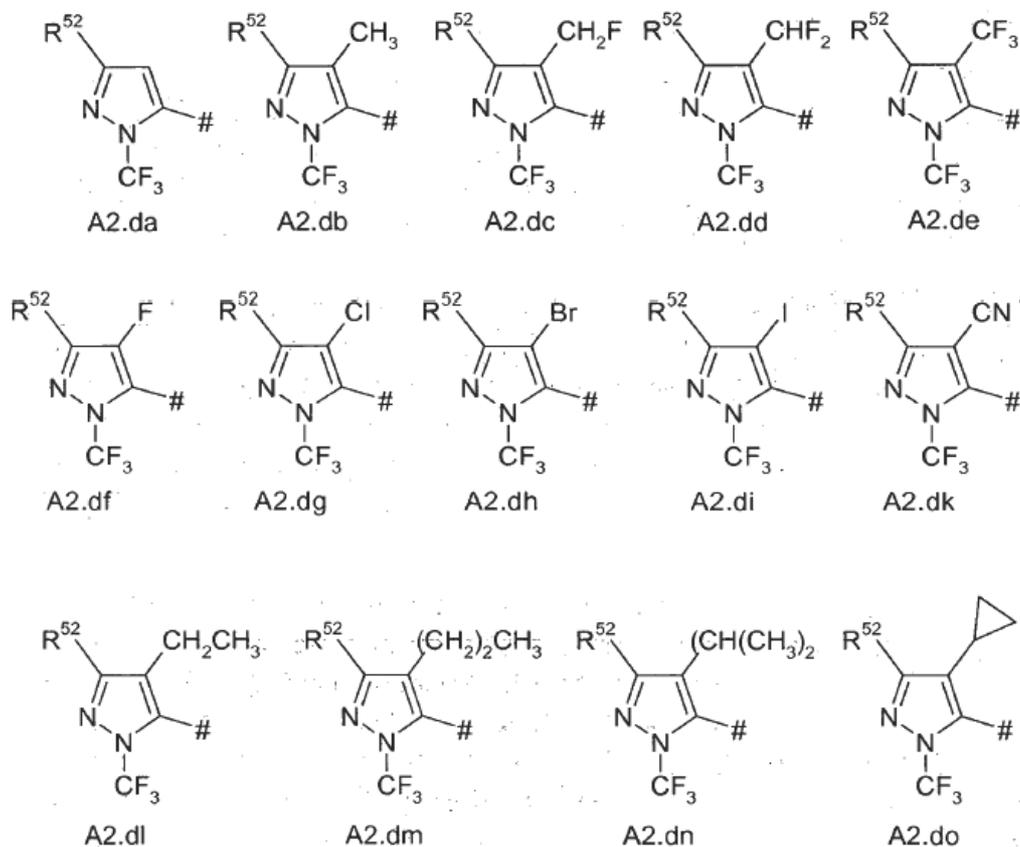
5



Ejemplos adicionales 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.ck, A2.cl, A2.cm, A2.cn y A2.co, en donde R⁵² es CHF₂ y R⁵² es como se definió en una línea de la tabla A (radicales A2.ca1 - A2.ca111 a A2.co1 - A2.co111):

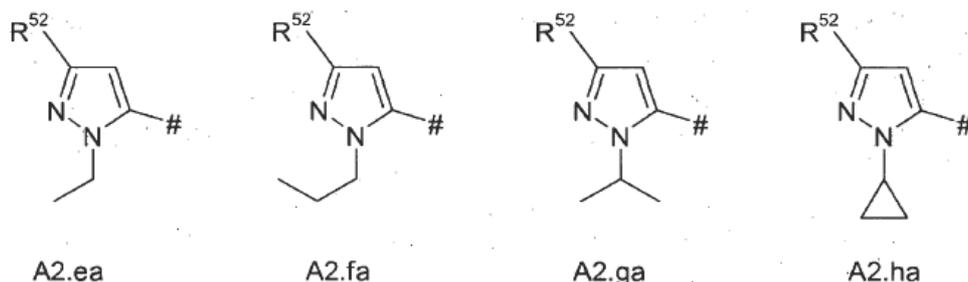


Ejemplos adicionales de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.da, A2.db, A2.dc, A2.dd, A2.de, A2.df, A2.dg, A2.dh, A2.di, A2.dk, A2.dl, A2.dm, A2.dn y A2.do, en donde R^{52} es CF_3 y R^{52} es como se definió en una línea de la tabla A (radicales A2.da1 - A2.da111 a A2.do1 - A2.do111):



5

Ejemplos adicionales de radicales A2 adecuados son los radicales de las fórmulas A2.ea, A2.fa, A2.ga, A2.ha, en donde R^{52} es como se definió en una línea de la tabla A (radicales A2.ea1 - A2.ea111, A2.fa1 - A2.fa111, A2.ga1 - A2.ga111, y A2.ha1 - A2.ha111):



10 Una realización adicional de la invención se relaciona con compuestos de pirazol de fórmulas I y II, con las sales y N-óxidos de los mismos y con los métodos y usos de tales compuestos, en donde A es un radical A3. Entre los compuestos de las fórmulas I y II, en donde A es un radical A3, se da preferencia a los compuestos de las fórmulas I o II, en donde X^1 , R^1 , R^t , R^u , R^v y R^w son como se definieron anteriormente y en particular tienen uno de los significados preferidos.

15 Entre los compuestos de fórmulas I y II, en donde A es A3, se da preferencia a aquellos compuestos, en donde R^{43} es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C_1 - C_4 -alquilo y C_2 - C_{10} -alquenilo, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_3 - C_6 -cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -

alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁴³ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

5 Preferiblemente R⁴³ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Más preferiblemente R⁴³ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo. En particular R⁴³ es hidrógeno.

10 Entre los compuestos de fórmulas I y II, en donde A es A3, se da preferencia adicional a aquellos compuestos, en donde n R⁵³ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alquenoilo, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁵³ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

20 Preferiblemente R⁵³ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. Más preferiblemente R⁵³ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo. En particular R⁵³ es hidrógeno.

25 Entre los compuestos de fórmulas I y II, en donde A es A3, se da preferencia adicional a aquellos compuestos, en donde R⁶³ es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alquenoilo, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenado o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁶³ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO₂, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

30 Preferiblemente R⁶³ es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3 o 4 radicales seleccionados de halógeno, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y C₃-C₆-cicloalquilo, en particular de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi.

35 Preferiblemente de la misma forma, R⁶³ es seleccionado de hetarilo de 5- o 6- miembros, en particular de piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, tetrazolilo y 1,2,4-triazolilo, en donde hetarilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno,, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi y fenilo.

40 En una realización particular preferida R⁶³ es hidrógeno, C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-haloalquilo. En esta realización particular preferida R⁶³ es especialmente seleccionado de metilo, etil, n-propil, isopropil, isobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 2,2-difluoroetilo y 2,2,2-trifluoroetilo, con particular preferencia dada a metilo y 2,2,2-trifluoroetilo.

45 En otra realización particular preferida R⁶³ es C₅-C₆-hetarilo o fenilo, en donde C₅-C₆-heteroarilo y fenilo pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO₂ CN, C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

50 En otra realización particular preferida R⁶³ es seleccionado de hetarilo de 5- o 6- miembros, en particular de piridilo, pirimidinilo, pirazinilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, tetrazolilo y 1,2,4-triazolilo, en donde hetarilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno,, NO₂ C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-

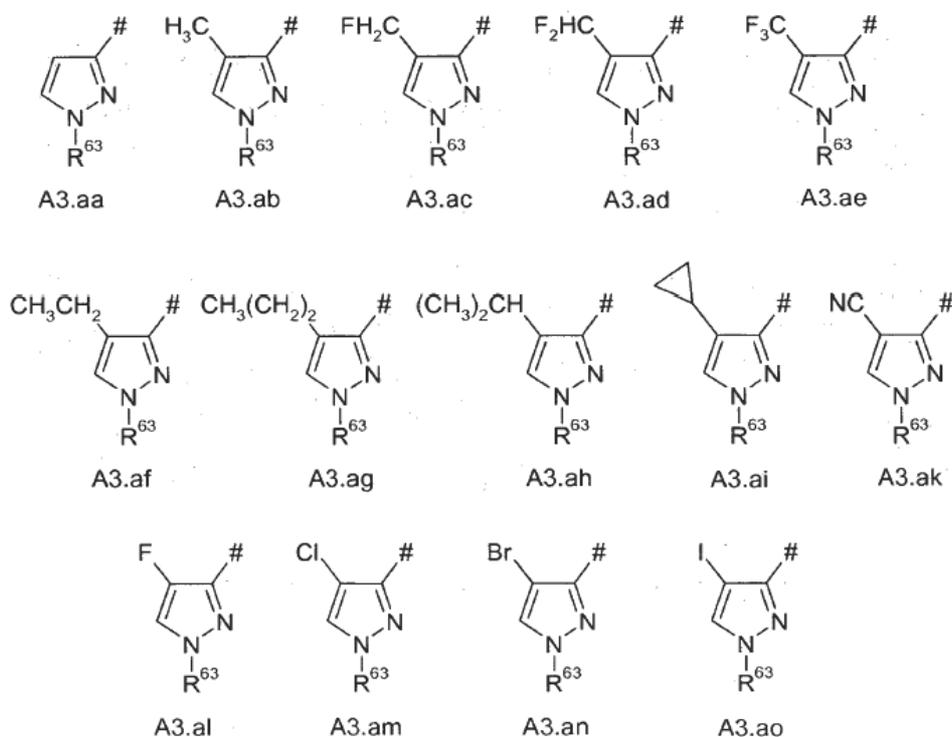
haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, y fenilo. En esta realización particular preferida R⁶³ es por ejemplo seleccionado de:

5 5-cloro-2-piridilo, 3-cloro-5-trifluoro-metilpiridine-2-ilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 2-tiazolilo, 4,5-dimetil-tiazol- 2-ilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 4-trifluormetil-tiazol-2-ilo, 4-metiltiazol-2-ilo, 4-feniltiazol-2-ilo, 5-1,2,4-triazolilo, 3- metil-triazol-5-ilo, 4-nitro-1-pirazolilo-metilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 5-imidazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-metilisoxazol-5-ilo, 5-metilisoxazol-3-ilo, 3-pirazolilo, [1,3,4]tiadiazol-2-ilo, 5-tetrazolilo, 6-cloro-2-piridilo, 5-nitro-2-piridilo, 3-nitro-2-piridilo, 6-metil-5-nitro-2-piridilo, pirazin-2-ilo, pirimidin-2-ilo, tiofeni-3-ilo, 4-metil-5-isopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-5-ciclopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-5-trifluorometil- 4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4,5-dimetil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-5-etil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-isopropil- 4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-ciclopropil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-metil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo, 4-etil-4H-[1,2,4]-triazol- 3-ilo, 4-fenil-4H-[1,2,4]-triazol-3-ilo y 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.

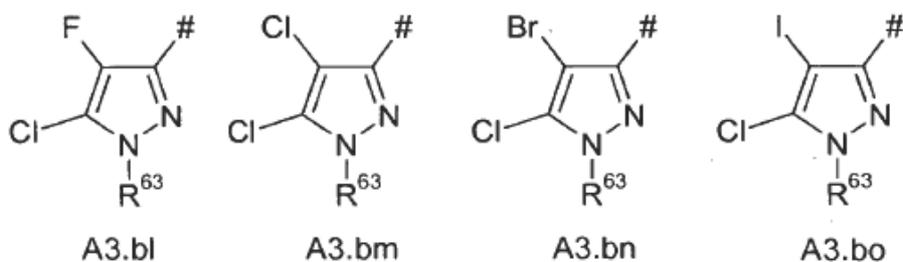
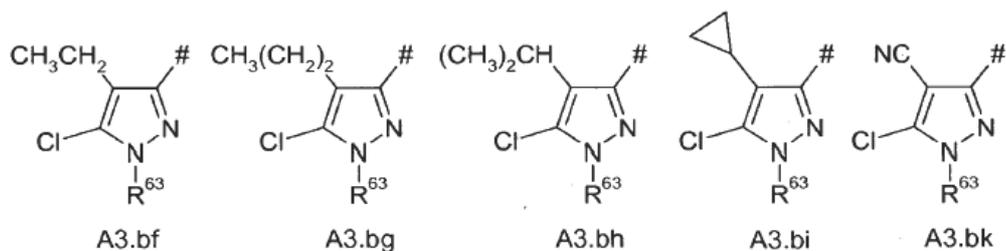
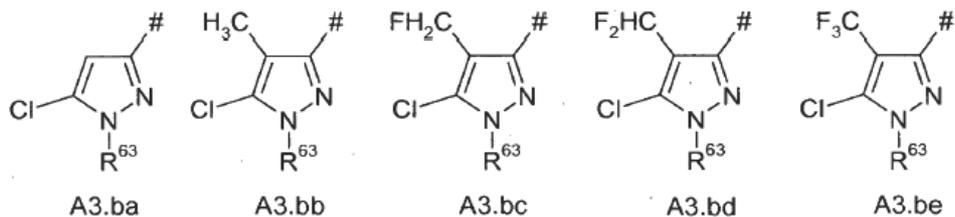
15 En una realización particular preferida adicional R⁶³ es fenilo, que es no sustituido o que lleva 1, 2 o 3 radicales seleccionados de halógeno, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. En esta realización particular preferida R⁶¹ es por ejemplo seleccionado de fenilo, 2-nitrofenilo, 3-nitrofenilo, 4-nitrofenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 2- fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 3,5-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo; 2,4,6-triclorofenilo, 2,3,4-trichlorfenilo, 2,4-difluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 4-cloro-2-fluorofenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 2-metoxifenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 4-difluorometoxifenilo, 4-(trifluorometiltio) fenilo, 4-(trifluorometilsulfonil)fenilo, 2-metilfenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-(isopropil) fenilo, 4-(heptafluoroisopropil)fenilo, 2,6-dicloro-4-trifluorometil-fenil y 4-trifluorometilfenil.

20 En una realización particular preferida adicional R⁶³ es C₁-C₄-alcoxi-C₂-C₄-alquilo, en particular 2-metoxietilo o 2-etoxietil.

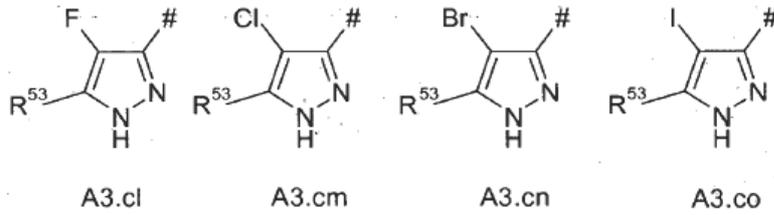
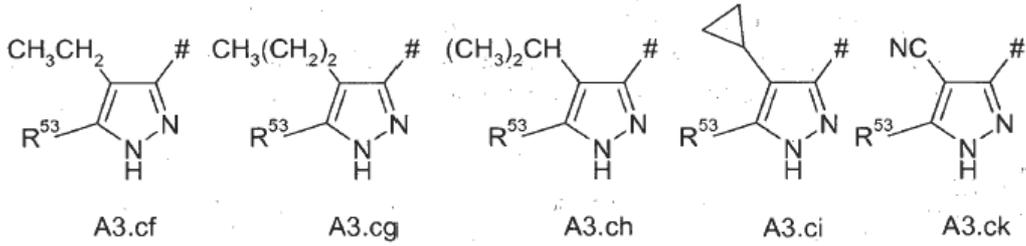
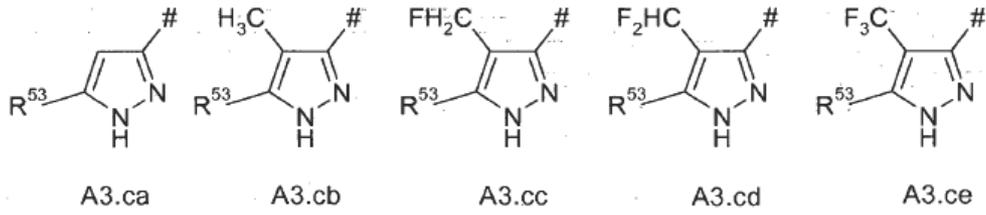
25 Ejemplos de radicales A3 adecuados son los radicales de fórmulas A3.aa, A3.ab, A3.ac, A3.ad, A3.ae, A3.af, A3.ag, A3.ah, A3.ai, A3.ak, A3.al, A3.am, A3.an y A3.ao, en donde R⁶³ es un radical como se definió en una línea de la tabla A (radicales A3.aa1 - A3.aa111 a A3.ao1 - A3.ao111):



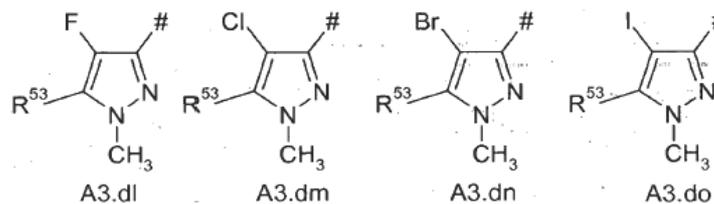
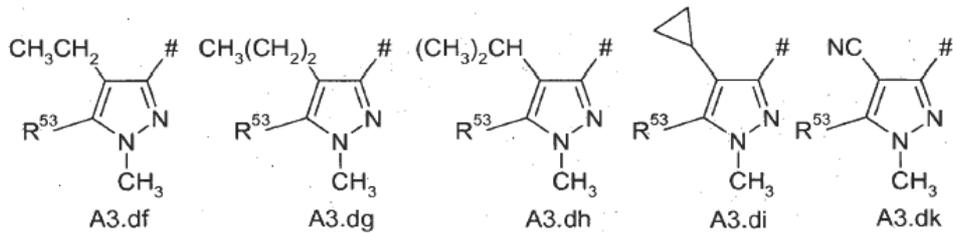
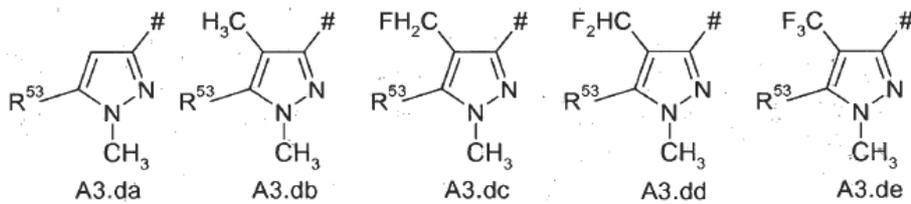
Ejemplos adicionales de radicales A3 adecuados son los radicales de fórmulas A3.ba, A3.bb, A3.bc, A3.bd, A3.be, A3.bf, A3.bg, A3.bh, A3.bi, A3.bk, A3.bl, A3.bm, A3.bn y A3.bo, en donde R⁶³ es un radical como se definió en una fila de la tabla A (radicales A3.ba1 - A3.ba111 a A3.bo1 - A3.bo111):



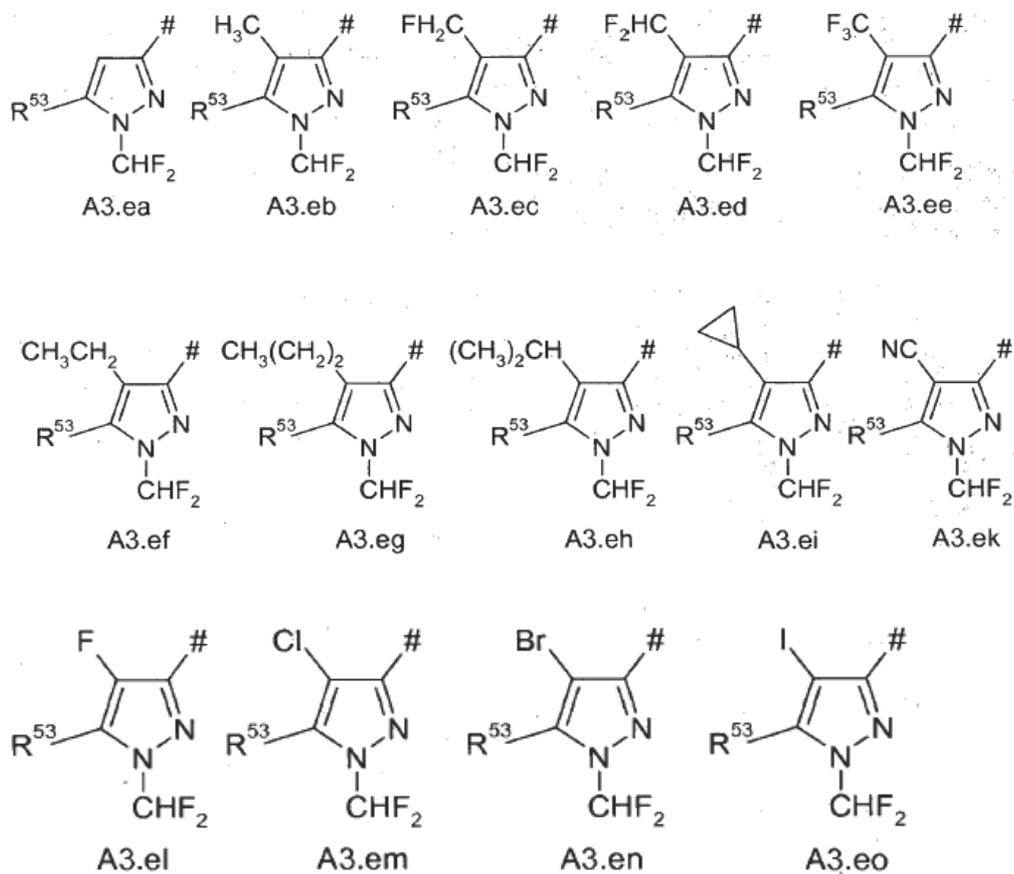
5 Ejemplos adicionales de radicales A3 adecuados son los radicales de fórmulas A3.ca, A3.cb, A3.cc, A3.cd, A3.ce, A3.cf, A3.cg, A3.ch, A3.ci, A3.ck, A3.cl, A3.cm, A3.cn y A3.co, en donde R⁶³ es un radical como se definió en una fila de la tabla A (radicales A3.ca1 - A3.ca111 a A3.co1 - A3.co111):



Ejemplos adicionales de radicales A3 adecuados son los radicales de 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 donde R⁵³ es un radical como se definió en una fila de la tabla A (radicales A3.da1 - A3.da111 a A3.do1 - A3.do111):

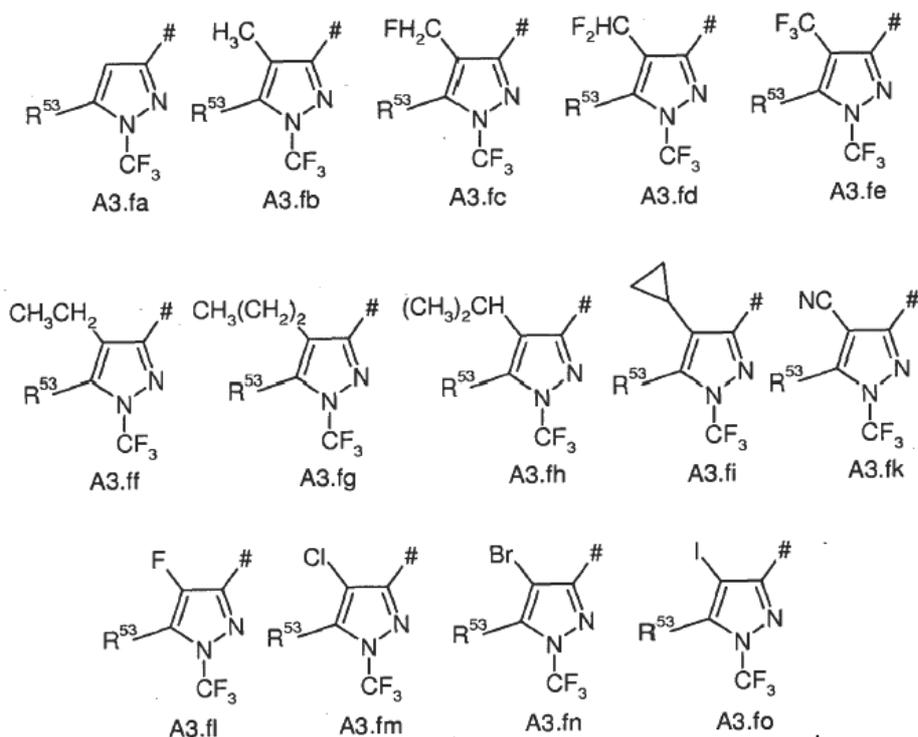


Ejemplos adicionales de radicales A3 adecuados son los radicales de fórmulas A3.ea, A3.eb, A3.ec, A3.ed, A3.ee, A3.ef, A3.eg, A3.eh, A3.ei, A3.ek; A3.el, A3.em, A3.en y A3.eo, en donde R^{53} es un radical como se definió en una fila de la tabla A (radicales A3.ea1 - A3.ea111 a A3.eo1 - A3.eo111):

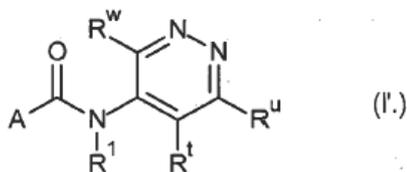


5

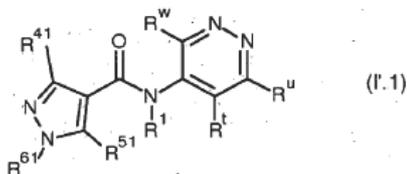
Ejemplos adicionales de radicales A3 adecuados son los radicales de fórmulas A3.fa, A3.fb, A3.fc, A3.fd, A3.fe, A3.ff, A3.fg, A3.fh, A3.fi, A3.fk, A3.fl, A3.fm, A3.fn y A3.fo, en donde R^{53} es un radical como se definió en una fila de la tabla A (radicales A3.fa1 - A3.fa111 a A3.fo1 - A3.fo111):



Una realización particularmente preferida de la invención se relaciona con compuestos de fórmula I'. y con las sales y N-óxidos de los mismos, en donde A, R¹, R^t, R^u, y R^w son como se definen aquí.



- 5 En una realización particular de los compuestos de la fórmula I', el radical A es un radical de la fórmula A1. Estos compuestos son denominados también de aquí en adelante compuestos I'.1:



En la fórmula I'.1, los radicales R¹, R^t, R^u, R^w, R⁴¹, R⁵¹ y R⁶¹ tienen los significados dados anteriormente, en particular los significados dados como significados preferidos.

- 10 En la fórmula I'.1, R⁴¹, R⁵¹ y R⁶¹ tienen en particular los siguientes significados

R⁴¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁴¹ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo;

- R^{51} es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C_1-C_{10} -alquilo y C_2-C_{10} -alqueno, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_3-C_6 -cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_1-C_4 -alquilsulfonilo y C_1-C_4 -haloalquilsulfonilo, o en donde R^{51} se selecciona además de C_3-C_6 -cicloalquilo, C_5-C_6 -hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_1-C_4 -alquilsulfonilo y C_1-C_4 -haloalquilsulfonilo; y
- 10 R^{61} es seleccionado de hidrógeno, C_1-C_{10} -alquilo y C_2-C_{10} -alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenado o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_3-C_6 -cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_1-C_4 -alquilsulfonilo y C_1-C_4 -haloalquilsulfonilo, o en donde R^{61} se selecciona además de C_3-C_6 -cicloalquilo, C_5-C_6 -hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO_2 , CN, C_1-C_4 -alquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_1-C_4 -alquiltio, C_1-C_4 -haloalquiltio, C_1-C_4 -alquilsulfonilo y C_1-C_4 -haloalquilsulfonilo.
- 20 En la fórmula I'.1, R^{41} , R^{51} y R^{61} tendrán en especial los siguientes significados
- R^{41} es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo y C_3-C_6 -halocicloalquilo, especialmente de; y
- Preferiblemente, el radical R^{41} es hidrógeno, si R^{51} es diferente de hidrógeno.
- Preferiblemente, el radical R^{51} es hidrógeno, si R^{41} es diferente de hidrógeno. Igualmente preferidos son los compuestos de la presente invención, en donde, R^{41} y R^{51} son ambos hidrógeno.
- 25 R^{51} es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi- C_1-C_4 -alquilo y C_3-C_6 -cicloalquilo, especialmente cloro, bromo, yodo, metil etilo, isopropilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1,1-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, clorofluorometilo, metoximetilo, etoximetil y ciclopropil;
- R^{61} es hidrógeno, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo o C_1-C_4 -alcoxi- C_2-C_4 -alquilo, o
- 30 R^{61} es C_5-C_6 -hetarilo o fenilo, en donde C_5-C_6 -heteroarilo y fenilo pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO_2 , CN, C_1-C_4 -alquilo, C_3-C_6 -cicloalquilo, fenilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_1-C_4 -alquiltio, C_1-C_4 -haloalquiltio, C_1-C_4 -alquilsulfonilo y C_1-C_4 -haloalquilsulfonilo, por ejemplo.
- 35 En la fórmula I'.1 el radical R^{41} es preferiblemente hidrógeno, si R^{51} es diferente de hidrógeno. En la fórmula I'.1 el radical R^{51} es preferiblemente hidrógeno, si R^{41} es diferente de hidrógeno. En particular, el radical R^{41} es hidrógeno y R^{51} es diferente de hidrógeno. Igualmente preferidos son los compuestos de la fórmula I'.1, en donde R^{41} , y R^{51} ambos son hidrógeno.
- 40 En la realización particular de los compuestos de la fórmula I'., donde el radical A es un radical de la fórmula A1, el radical A es en particular un radical pirazol de las fórmulas A1.a a A1.z o un radical pirazol de las fórmulas A1.aa a A1.tt, más preferiblemente radical pirazol A1.a, A1.b, A1.c, A1.d, A1.e, A1.f, A1.o, A1.q, A1.r, A1.s, A1.t, A1.u, A1.v, A1.w, A1.x, A1.y, A1.aa, A1.bb, A1.cc, A1.dd, A1.ee, A1.gg, A1.hh o A1.ii, por ejemplo un radical seleccionado de los radicales pirazol A1.a1 a A1.z111 o de A1.aa1 a A1.tt111.
- En la fórmula I'. y I'.1 los radicales R^1 , R^t , R^u y R^w preferiblemente tienen los siguientes significados:
- 45 R^1 es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, CN, C_1-C_{10} -alquilo, C_1-C_{10} -haloalquilo, C_2-C_{10} -alqueno, C_2-C_{10} -haloalqueno, C_2-C_{10} -alquino, C_1-C_4 -alquilen-CN, OR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, C_1-C_4 -alquilen- $C(Y)R^b$, C_1-C_4 -alquilen- OR^a , C_1-C_4 -alquilen- NR^eR^f , C_1-C_4 -alquilen- $C(Y)NR^gR^h$, fenil- C_1-C_4 -alquilo, heterociclilo- C_1-C_4 -alquilo y hetarilo- C_1-C_4 -alquilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^x y R^y , los cuales son como se definió anteriormente y que se seleccionan preferiblemente de halógeno, NO_2 , C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi, C_1-C_4 -haloalcoxi, C_1-C_4 -alquilsulfonilo y C_1-C_4 -haloalquilsulfonilo, en donde R^a , R^b , R^c , R^d , R^e y R^f son como se definió aquí; en particular del grupo que consiste de hidrógeno, C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi- C_1-C_4 -alquilo, heterociclilo- C_1-C_4 -alquilo y hetarilo- C_1-C_4 -alquilo; Más preferiblemente del grupo que consiste de hidrógeno, C_1-C_4 -alquilo y C_1-C_4 -alcoxi- C_1-C_2 -alquilo, lo más preferiblemente del grupo que consiste de hidrógeno, metilo y etilo;
- 50

R^t , R^u , y R^w son independientemente uno del otro seleccionados de hidrógeno, halógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en donde preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, en particular todos los radicales R^t , R^v , y R^w son hidrógeno.

- 5 Ejemplos de compuestos de esta realización particularmente preferida son los compuestos dados en las siguientes tablas 1 a 2847.
- Tabla 1: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.a1 a A1.a111.
- Tabla 2: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.b1 a A1.b111.
- 10 Tabla 3: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.c1 a A1.c111.
- Tabla 4: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.d1 a A1.d111.
- 15 Tabla 5: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.e1 a A1.e111.
- Tabla 6: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.f1 a A1.f111.
- Tabla 7: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.g1 a A1.g111.
- 20 Tabla 8: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.h1 a A1.h111.
- Tabla 9: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.i1 a A1.i111.
- 25 Tabla 10: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.k1 a A1.k111.
- Tabla 11: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.l1 a A1.l111.
- Tabla 12: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.m1 a A1.m111.
- 30 Tabla 13: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.n1 a A1.n111.
- Tabla 14: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.o1 a A1.o111.
- 35 Tabla 15: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.p1 a A1.p111.
- Tabla 16: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.q1 a A1.q111.
- Tabla 17: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.r1 a A1.r111.
- 40 Tabla 18: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.s1 a A1.s111.
- Tabla 19: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.t1 a A1.t111.
- 45 Tabla 20: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.u1 a A1.u111.

- Tabla 65: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.x1 a A1.x111.
- Tabla 66: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.y1 a A1.y111.
- 5 Tabla 67: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.z1 a A1.z111.
- Tabla 68: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.aa1 a A1.aa111.
- 10 Tabla 69: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.bb1 a A1.bb111.
- Tabla 70: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.cc1 a A1.cc111.
- Tabla 71: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.dd1 a A1.dd111.
- 15 Tabla 72: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.ee1 a A1.ee111.
- Tabla 73: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.ff1 a A1.ff111.
- 20 Tabla 74: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.gg1 a A1.gg111.
- Tabla 75: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.hh1 a A1.hh111.
- Tabla 76: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno, y en donde A es seleccionado de los radicales A1.kk1 a A1.kk111.
- 25 Tabla 77: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.mm1 a A1.mm111.
- Tabla 78: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.nn1 a A1.nn111.
- 30 Tabla 79: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.oo1 a A1.oo111.
- Tabla 80: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.pp1 a A1.pp111.
- Tabla 81: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.qq1 a A1.qq111.
- 35 Tabla 82: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.rr1 a A1.rr111.
- Tabla 83: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.ss1 a A1.ss111.
- 40 Tabla 84: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A1.tt1 a A1.tt111.
- Tablas 85 a 126: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es etilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 127 a 168: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es n-propil y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

ES 2 546 404 T3

- Tablas 169 a 210: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es isopropil y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 211 a 252: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u son R^v son hidrógeno, R¹ es n-butilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 5 Tablas 253 a 294: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es tert.-butilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 295 a 326: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-metilpropil y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 10 Tablas 337 a 378: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-propenilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 379 a 420: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 3,3-dicloro-2-propenilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 421 a 462: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 3,3-dibromo-2-propenilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 15 Tablas 463 a 504: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-fluoroetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 505 a 546: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-cloroetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 20 Tablas 547 a 588: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-bromoetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 589 a 630: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2,2-difluoroetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 631 a 672: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2,2-dicloroetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 25 Tablas 673 a 714: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2,2-dibromoetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 715 a 756: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2,2,2-trifluoroetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 30 Tablas 757 a 798: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es cianometilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 799 a 840: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es metoximetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 841 a 882: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es etoximetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 35 Tablas 883 a 924: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-cianoetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 925 a 966: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-metoxietilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 40 Tablas 967 a 1008: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-etoxietilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1009 a 1050: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es ciclopropilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1051 a 1092: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es ciclobutilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

- Tablas 1093 a 1134: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es ciclopentilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1135 a 1176: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxetan-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 5 Tablas 1177 a 1218: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxetan-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1219 a 1260: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxolan-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 10 Tablas 1261 a 1302: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxolan-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1303 a 1344: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es tietan-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1345 a 1386: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1,1-dioxatietan-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 15 Tablas 1387 a 1428: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es ciclopropilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1429 a 1470: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es ciclobutilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 20 Tablas 1471 a 1512: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es ciclopentilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1513 a 1554: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxetan-2-ilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1555 a 1596: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxetan-3-ilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 25 Tablas 1597 a 1638: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxolan-2-ilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1639 a 1680: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxolan-3-ilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 30 Tablas 1681 a 1722: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es tietan-3-ilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1723 a 1764: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1,1-dioxatietan-3-ilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1765 a 1806: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es bencilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 35 Tablas 1807 a 1848: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-furilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1849 a 1890: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 3-furilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 40 Tablas 1891 a 1932: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-tienilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1933 a 1974: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 3-tienilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 1975 a 2016: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es isotiazol-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

ES 2 546 404 T3

- Tablas 2017 a 2058: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es isotiazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2059 a 2100: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es isotiazol-5-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 5 Tablas 2101 a 2142: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es isoxazol-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2143 a 2184: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxazol-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 10 Tablas 2185 a 2226: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxazol-5-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2227 a 2268: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2269 a 2310: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es tiazol-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 15 Tablas 2311 a 2352: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es tiazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2353 a 2394: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es tiazol-5-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 20 Tablas 2395 a 2436: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1 H-pirazol-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2437 a 2478: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1 H-pirazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2479 a 2520: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2H-pirazol-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 25 Tablas 2521 a 2562: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1-metil-1 H-pirazol-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2563 a 2604: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1-metil-1 H-pirazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 30 Tablas 2605 a 2646: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 2-metil-2H-pirazol-3-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2647 a 2688: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1 H-imidazol-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2689 a 2730: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1 H-imidazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 35 Tablas 2731 a 2772: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1 H-imidazol-5-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2773 a 2814: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1-metil-1 H-imidazol-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- 40 Tablas 2815 a 2856: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1-metil-1H-imidazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2857 a 2898: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1-metil-1 H-imidazol-5-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.
- Tablas 2899 a 2940: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es oxazolin-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

Tablas 2941 a 2982: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es tiazolin-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

Tablas 2983 a 3024: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1 H-imidazolin-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

5 Tablas 3025 a 3066: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1-metil-1 H-imidazolin-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

Tablas 3067 a 3108: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 1-phenylpirazol-4-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

10 Tablas 3109 a 3150: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 5-metilfuran-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

Tablas 3151 a 3192: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u y R^v son hidrógeno, R¹ es 5,5-dimetiltetrahidrofuran-2-ilmetilo y en donde A es como se definió en las tablas 1 a 42.

Otra realización preferida particular se relaciona con compuestos de la fórmula I'. y con las sales y N-óxidos de los mismos, en donde

15 A es un radical A2, como se definió aquí, en particular un radical A2, en donde R⁴², R⁵² y R⁶² tienen los significados preferidos, en particular un radical pirazol de las fórmulas A2.aa a A2.do, por ejemplo un radical seleccionado de los radicales pirazol A2.aa1 - A2.aa111 a A2.do1 a A2.do111.

20 R¹ es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₂-C₁₀-alquenoilo, C₂-C₁₀-haloalquenoilo, C₂-C₁₀-alquinoilo, C₁-C₄-alquilen-CN, OR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, C₁-C₄-alquilen-C(Y)R^b, C₁-C₄-alquilen-OR^a, C₁-C₄-alquilen-NR^eR^f, C₁-C₄-alquilen-NR^eR^f, fenil- C₁-C₄-alquilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^x, los cuales son como se definió anteriormente y que se seleccionan preferiblemente de halógeno, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, en donde R^a, R^b, R^c, R^d, R^e y R^f son como se definen aquí; en particular del grupo que consiste de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo; Más preferiblemente del grupo que consiste de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₂-alquilo, lo más preferiblemente del grupo que consiste de hidrógeno, metil y etilo;

30 R^t, R^u y R^w son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en donde preferiblemente al menos uno, más preferiblemente dos o tres o, en particular, todos los radicales R^t, R^u y RW son hidrógeno.

Ejemplos de compuestos de esta realización preferida particular son los compuestos indicados en las siguientes tablas 3193 a 3304.

Tabla 3193: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.aa1 a A2.aa111.

35 Tabla 3194: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.aa1 a A2.aa111.

Tabla 3195: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ab1 a A2.ab111.

40 Tabla 3196: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ab1 a A2.ab111.

Tabla 3197: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ac1 a A2.ac111.

Tabla 3198: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ac1 a A2.ac111.

45 Tabla 3199: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R² y R³ son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ad1 a A2.ad111.

Tabla 3200: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ad1 a A2.ad111.

- Tabla 3289: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.dl1 a A2.dl111.
- Tabla 3290: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.dl1 a A2.dl111.
- 5 Tabla 3291: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.dm1 a A2.dm111.
- Tabla 3292: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.dm1 a A2.dm111.
- 10 Tabla 3293: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.dn1 a A2.dn111.
- Tabla 3294: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.dn1 a A2.dn111.
- Tabla 3295: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.do1 a A2.do111.
- 15 Tabla 3296: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.do1 a A2.do111.
- Tabla 3297: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ea1 a A2.ea111.
- 20 Tabla 3298: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ea1 a A2.ea111.
- Tabla 3299: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.fa1 a A2.fa111.
- Tabla 3300: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.fa1 a A2.fa111.
- 25 Tabla 3301: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ga1 a A2.ga111.
- Tabla 3302: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ga1 a A2.ga111.
- 30 Tabla 3303: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ha1 a A2.ha111.
- Tabla 3304: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A2.ha1 a A2.ha111.
- Otra realización preferida particular se relaciona con compuestos de fórmula I'. y con las sales y N-óxidos de los mismos, en donde
- 35 A es un radical A3, como se definió aquí, en particular un radical A3, en donde R⁴³, R⁵³ y R⁶³ tienen los significados preferidos, más particularmente un radical pirazol de las fórmulas A3.aa a A3.do, por ejemplo un radical seleccionado de los radicales pirazol A3.aa1 - A3.aa111 a A3.do1 - A3.do111;
- R¹ es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₂-C₁₀-alquenoilo, C₂-C₁₀-haloalquenoilo, C₂-C₁₀-alquinoilo, C₁-C₄-alquilen-CN, OR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, C₁-C₄-alquilen-C(Y)R^b, C₁-C₄-alquilen-OR^a, C₁-C₄-alquilen-NR^eR^f, C₁-C₄-alquilen-NR^eR^f, fenil- C₁-C₄-alquilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^x, los cuales son como se definió anteriormente y que se seleccionan preferiblemente de halógeno, NO₂, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, en donde R^a, R^b, R^c, R^d, R^e y R^f son como se definió aquí; en particular del grupo que consiste de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo; Más preferiblemente del grupo que consiste de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₂-alquilo, lo más preferiblemente del grupo que consiste de hidrógeno, metilo y etilo;
- 40
- 45

R^t , R^u y R^w son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi; y en donde preferiblemente al menos uno, más preferiblemente 2 o 3, en particular todos los radicales R^t , R^u y R^w son hidrógeno.

5 Ejemplos de compuestos de esta realización particular preferida son los compuestos dados en las siguientes tablas 3305 a 3472.

Tabla 3305: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.aa1 a A3.aa111.

Tabla 3306: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.aa1 a A3.aa111.

10 Tabla 3307: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ab1 a A3.ab111.

Tabla 3308: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ab1 a A3.ab111.

15 Tabla 3309: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ac1 a A3.ac111.

Tabla 3310: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ac1 a A3.ac111.

Tabla 3311: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ad1 a A3.ad111.

20 Tabla 3312: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ad1 a A3.ad111.

Tabla 3313: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ae1 a A3.ae111.

25 Tabla 3314: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ae1 a A3.ae111.

Tabla 3315: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.af1 a A3.af111.

Tabla 3316: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.af1 a A3.af111.

30 Tabla 3317: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ag1 a A3.ag111.

Tabla 3318: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ag1 a A3.ag111.

35 Tabla 3319: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ah1 a A3.ah111.

Tabla 3320: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ah1 a A3.ah111.

Tabla 3321: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ai1 a A3.ai111.

40 Tabla 3322: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ai1 a A3.ai111.

Tabla 3323: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 , R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ak1 a A3.ak111.

45 Tabla 3324: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R^1 es metilo, R^t , R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.ak1 a A3.ak111.

Tabla 3457: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fg1 a A3.fg111.

Tabla 3458: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fg1 a A3.fg111.

5 Tabla 3459: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fh1 a A3.fh111.

Tabla 3460: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fh1 a A3.fh111.

10 Tabla 3461: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fi1 a A3.fi111.

Tabla 3462: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fi1 a A3.fi111.

Tabla 3463: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fk1 a A3.fk111.

15 Tabla 3464: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fk1 a A3.fk111.

Tabla 3465: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fl1 a A3.fl111.

20 Tabla 3466: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fl1 a A3.fl111.

Tabla 3467: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fm1 a A3.fm111.

Tabla 3468: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fm1 a A3.fm111.

25 Tabla 3469: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fn1 a A3.fn111.

Tabla 3470: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fn1 a A3.fn111.

30 Tabla 3471: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fo1 a A3.fo111.

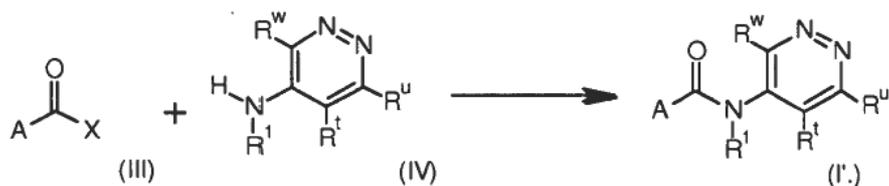
Tabla 3472: Compuestos de la fórmula I'. y las sales y N-óxidos de los mismos, en donde R¹ es metilo, R^t, R^u y R^w son hidrógeno y en donde A es seleccionado de los radicales A3.fo1 a A3.fo111.

Los compuestos de fórmulas I o II se pueden preparar por los métodos estándar de química orgánica, por ejemplo, por los métodos descritos de aquí en adelante o en los ejemplos de trabajo:

35 Los compuestos de la fórmula I, en donde X¹ es O (compuestos I'), se pueden preparar por ejemplo, de acuerdo con el método representado en el Esquema 1 haciendo reaccionar el derivado III activado de ácido pirazol carboxílico con un compuesto 4-aminopiridazina IV (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). Derivados de ácido carboxílico de pirazol activado III son, por ejemplo, haluros, ésteres activados, anhídridos, azidas, por ejemplo, cloruros, fluoruros, bromuros, ésteres de para-nitrofenilo, ésteres de pentafluorofenilo, N-hidroxisuccinimidas, ésteres de hidroxibenzotriazol-1-ilo.

40 En el esquema 1, los radicales A, y R¹ tienen los significados mencionados anteriormente y en particular los significados mencionados como preferidos, X es un grupo saliente adecuado tal como halógeno, N3, para-nitrofenoxi o pentafluorofenoxi y similares.

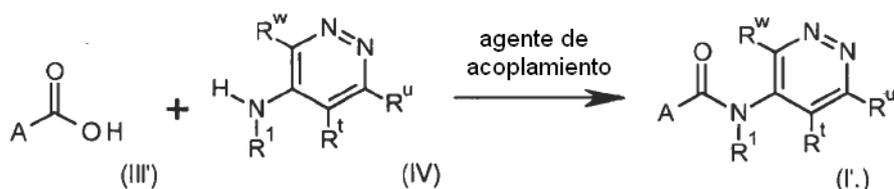
45 **Esquema 1:**



Los compuestos activos de la fórmula I, en donde X^1 es O (compuestos I'), también se pueden preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar el ácido carboxílico de pirazol III' y un compuesto de 4-amino-piridazina IV, en presencia de un agente de acoplamiento de acuerdo con el esquema 2. En el esquema 2, el radical A tiene los significados dados anteriormente y en particular los significados dados como preferidos.

5

Esquema 2:



Agentes de acoplamiento adecuados son, por ejemplo

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

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

15 - agentes de acoplamiento basados en sales de fosfonio, por ejemplo (benzotriazol-1-iloxi)tris (dimetilamino)fosfonio hexafluorofosfato [B. Castro, J.R. Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219], (benzotriazol-1-il-oxi)tripirrolidinofosfonio hexafluorofosfato [J. Coste et al., Tetrahedron Lett. 1990, 31, 205];

20 - agentes de acoplamiento basados en sales de uronio o que tiene una estructura de N-óxido de guanidinio, por ejemplo N,N,N',N'-tetrametil- O-(1H-benzotriazol-1-il)uronio hexafluorofosfato [R. Knorr, A. Trzeciak, W. Bannwarth, D. Gillessen, Tetrahedron Lett. 1989, 30, 1927], N,N,N',N'-tetranietil-O-(benzotriazol-1,-il)uronio tetrafluoroborato, (benzotriazol- 1-iloxi)dipiperidino-carbenio hexafluorofosfato [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, Synthesis 1980, 547].

Compuestos de fórmula I, en donde X^1 es O (compuestos I') y R^1 es diferente de hidrógeno también se pueden preparar por alquilación de las amidas I (en las que R^1 es hidrógeno y que se pueden obtener de acuerdo con el esquema 1 o 2) usando agentes alquilantes adecuados en presencia de bases

25

Esquema 3:



Los ácidos pirazol carboxílicos V y sus derivados III activados, así como los compuestos 4-aminopiridazina IV son conocidos en la técnica o están disponibles comercialmente o se pueden preparar por métodos conocidos de la literatura.

30

Compuestos de la fórmula I, en donde X^1 es diferente de oxígeno, se pueden preparar a partir de los compuestos de fórmula I' por métodos estándar:

5 Compuestos de fórmula I, en donde X^1 es S, se pueden preparar por ejemplo, haciendo reaccionar 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 método descrito por M. Jesberger et al. en *Synthesis* 2003, 1929.

Compuestos de la fórmula I, en donde 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 donde X^1 es S), el cual entonces se hace reaccionar con una amina apropiada de acuerdo con el método descrito por V. Glushkov et al. en *Pharmaceutical Chemistry Journal* 2005, 39(10), 533-536.

10 Compuestos de fórmula II, en donde $X^2 = SR^{2a}$, se pueden preparar por alquilación de la correspondiente tioamida (compuesto I, en donde X^1 es S) por reacción con un agente de alquilación de acuerdo con el método descrito por V. Glushkov et al. en *Pharmaceutical Chemistry Journal* 2005, 39(10), 533-536. De una manera similar, se pueden obtener compuestos I, en donde X^2 es OR^{2a} o $NR^{2b}R^{2c}$. Compuestos de la fórmula II, en donde $X^2 = SOR^{2a}$ o SO_2R^{2a} se pueden obtener por oxidación de los compuestos II con $X^2 = SR^{2a}$.

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

20 Como regla general, los compuestos de fórmulas I o II se pueden preparar por los métodos descritos anteriormente. Si los compuestos individuales no se pueden preparar a través de las rutas anteriormente descritas, se pueden preparar por derivación de otros compuestos I o II o por modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos I o II pueden ser ventajosamente preparados a partir de otros compuestos I o II por hidrólisis del éster, amidación, esterificación, escisión de éter, olefinación, reducción, oxidación y similares.

25 Las mezclas de reacción se manipulan en la forma habitual, por ejemplo mediante la mezcla con agua, separando las fases, y, si es apropiado, purificando los productos crudos por cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sobre sílica gel. Algunos de los intermedios y productos finales se pueden obtener en la forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido los cuales son liberados o purificados a partir de componentes volátiles bajo presión reducida y temperatura moderadamente elevada. Si los intermediarios y los productos finales se obtienen como sólidos, se pueden purificar por recristalización o trituración.

30 Debido a su excelente actividad, los compuestos de las fórmulas generales I o II se pueden usar para el control de plagas invertebradas.

35 De acuerdo con lo anterior, la presente invención también provee un método para controlar plagas invertebradas, cuyo método comprende el tratamiento de las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o sus terrenos de crianza o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tales como semillas), suelo, área, material o ambiente en el que las plagas están creciendo o puede crecer, o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación de las plantas (tales como semillas), suelos, superficies o espacios que van a ser protegidos de los ataques o infestación de plagas con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de fórmulas (I) o (II) o una sal o N-óxido del mismo o una composición como se ha definido anteriormente.

40 Preferiblemente, el método de la invención sirve para la protección de material de propagación de la planta (tales como semillas) y de la planta que crece a partir del mismo de ataque de plagas de invertebrados o infestación y comprende tratar el material de propagación de la planta (tales como semillas) con una cantidad efectiva como plaguicida de un compuesto de fórmulas (I) o (II) o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola o N-óxido del mismo como se definió anteriormente o con una cantidad efectiva como plaguicida de una composición agrícola tal como se define arriba y abajo. El método de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación de la planta, material de suelo etc.) que ha sido tratada de acuerdo con la invención, pero también tiene un efecto preventivo, así, por ejemplo, protección acordada a una planta que crece a partir de materiales tratados de propagación de plantas (tales como semillas), la propia planta no habiendo sido tratada.

45 En el sentido de la presente invención, "plagas invertebradas" se seleccionan preferiblemente de los artrópodos y nematodos, más preferiblemente de insectos, arácnidos y nematodos nocivos, e incluso más preferiblemente de insectos, ácaros y nematodos.

50 La invención provee además una composición agrícola para combatir tales plagas invertebradas, que comprende una cantidad de al menos un compuesto de las fórmulas generales I o II o al menos una sal útil desde el punto de vista agrícola o N-óxido del mismo y al menos un líquido inerte y/o vehículo sólido aceptable desde el punto de vista agrícola que tiene una acción pesticida y, si se desea, al menos un surfactante.

Tal composición puede contener un compuesto activo individual 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 de acuerdo con la presente invención. La composición de acuerdo con la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros, así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

5 Los compuestos de las fórmulas I o II y las composiciones pesticidas que los comprenden son agentes efectivos para el control de plagas de artrópodos y nematodos. Plagas invertebradas controladas por los compuestos de las fórmulas I o II incluyen, por ejemplo insectos del orden lepidoptera (Lepidoptera), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyrestia 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*, *Leucopetra coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhagoletia frustrana*, *Scrobipalpa absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusiani* y *Zeiraphera canadensis*;

25 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*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12 punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epirix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hyllobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga sp.*, *Phyllorpertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*;

35 dípteros (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *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*;

40 tisanópteros (Thysanoptera), por ejemplo *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *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*;

45 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*;

50 homópteros (Homoptera), por ejemplo *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*; *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis gnossulariae*, *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 nordmanniana*, *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 pirarius*, *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*, *Rhopalosiphum ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, y *Viteus vitifolii*;

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

5 ortópteros (Orthoptera), por ejemplo *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Grylotalpa grylotalpa*, *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 arachnids (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*;

siphonatera, por ejemplo *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.

Las composiciones y los compuestos de fórmulas I o son útiles para el control de nemátodos, especialmente nemátodos parásitos de plantas tales como nemátodos de los nódulos radiculares, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, y otras especies *Meloidogyne*; cyst-forming nemátodos, *Globodera rostochiensis* y otras especies *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies *Heterodera*; Seed gall nemátodos, *Anguina* species; Stem y foliar nemátodos, especies *Aphelenchoides*; Sting nemátodos, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies *Belonolaimus*; Pine nemátodos, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies *Bursaphelenchus*; nemátodos de anillo, especies *Criconema*, especies *Criconemella*, especies *Criconemoides*, especies *Mesocriconema*; Stem y bulb nemátodos, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies *Ditylenchus*; Awl nemátodos, especies *Dolichodorus*; Spiral nemátodos, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies *Helicotylenchus*; Sheath y sheathoid nemátodos, especies *Hemicycliophora* y especies *Hemicriconemoides*; especies *Hirshmanniella*; Lance nemátodos, especies *Hoploaimus*; false rootknot nemátodos, especies *Nacobbus*; Needle nemátodos, *Longidorus elongatus* y otras especies *Longidorus*; Pin nemátodos, especies *Paratylenchus*; Lesion nemátodos, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies *Pratylenchus*; Burrowing nemátodos, *Radopholus similis* y otras especies *Radopholus*; *R*ⁿiform nemátodos, *Rotylenchus robustus* y otras especies *Rotylenchus*; especies *Scutellonema*; Stubby root nemátodos, *Trichodorus primitivus* y otras especies *Trichodorus*, especies *Paratrichodorus*; nemátodos acróbatas, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies *Tylenchorhynchus*; Citrus nemátodos, especies *Tylenchulus*; Dagger nemátodos, especies *Xiphinema*; y otras especies de nemátodos parásitos de la planta.

En una realización preferida de la invención los compuestos de fórmulas I o II se utilizan para el control de insectos.

En otra realización preferida de la invención los compuestos de fórmulas I o II se utilizan para el control de insectos o arácnidos, en particular insectos de órdenes Lepidoptera, Coleoptera Thysanoptera y Homoptera y arácnidos del orden Acarina. Los compuestos de las fórmulas I o II de acuerdo con la presente invención son particularmente útiles para el control insectos del orden Thysanoptera y Homoptera, en particular de Homoptera. En otra realización preferida de la invención los compuestos de fórmulas I o II se utilizan para el control de ácaros.

Los compuestos de fórmulas I o II o las composiciones pesticidas que los comprenden se pueden utilizar para proteger las plantas y los cultivos del ataque o infestación por plagas invertebradas, especialmente insectos, ácaros o arácnidos poniendo en contacto la planta/cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de los compuestos de fórmulas I o II. El término "cultivo" se refiere tanto a los cultivos en crecimiento y recolectados.

Los compuestos de fórmulas I o II se pueden convertir en las formulaciones usuales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pulverizables, pastas y granulados. La forma de uso depende del propósito particular que se pretende; en cada caso, debe garantizar una distribución fina y uniforme del compuesto de acuerdo con la invención.

Las formulaciones son preparadas de una manera conocida (véase por ejemplo para revisión US 3,060,084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 y et seq. WO 91/13546, US 4,172,714, 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., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry y Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo extendiendo el compuesto activo con agentes auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, tales como

solventes y/o vehículos, si se desea emulsificantes, surfactantes y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, para la formulación de tratamiento de semillas también opcionalmente colorantes y/o aglomerantes y/o agentes gelificantes.

5 Ejemplos de solventes adecuados son agua, solventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol de bencilo), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (N-metilpirrolidona [NMP], N-octilpirrolidona [NOP]), acetatos (diacetato de glicol), glicoles, dimetilamidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos. En principio, también se pueden usar mezclas de solventes.

10 Emulsionantes adecuados son emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo polioxietileno éteres de alcoholes grasos, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Ejemplos de dispersantes son licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa

15 Surfactantes adecuados utilizados son metales alcalinos, sales de metales alcalinos y sales de amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftaleno sulfónico, alquilarilsulfonatos, Alquilo sulfatos, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y éteres glicólicos de alcoholes grasos sulfatados, además condensados de naftaleno y naftaleno derivados sulfonados con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietileno octilfenil éter, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenilo poliglicol éteres, tributilfenilo poliglicol éter, tristearilfenilo poliglicol éter, alquilarilo poliéteralcoholes, alcohol y condensados de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de castor etoxilado, polioxietileno alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílicopoliglicol éter acetal, ésteres de sorbitol licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa.

20

25 Sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleosas directamente asperjables son fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tales como queroseno o aceite diesel, adicionalmente aceites de alquitrán de carbón 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, solventes polares fuertes, por ejemplo dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.

También pueden agregarse a la formulación agentes anticongelantes tales como glicerina, etilén glicol, propileno glicol y bactericidas

30 Agentes antiespumantes adecuados son por ejemplo agentes antiespumantes basados en silicio o estearato de magnesio.

Un conservante adecuado es por ejemplo diclorofeno.

Formulaciones para el tratamiento de la semilla pueden comprender adicionalmente aglomerantes y opcionalmente colorantes

35 Los aglomerantes pueden agregarse para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Aglomerantes adecuados son copolímeros de bloque, surfactantes EO/PO, pero también polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas (Lupasol®, Polimin®), poliéteres, poliuretanos, polivinilacetato, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.

40 Opcionalmente, también pueden incluirse colorantes en la formulación. Colorantes o pigmentos adecuados para formulaciones para el tratamiento de semillas son rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112, C.I. Solvente rojo 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, rojo básico 108.

45

Ejemplos de un agente gelificante es carragenano (Satiagel®)

Los polvos, materiales para esparcir y productos espolvoreables se pueden preparar mezclando o moliendo concomitantemente las sustancias activas con un vehículo sólido.

50 Gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, pueden prepararse mediante la unión de los compuestos activos a vehículos sólidos.

- 5 Ejemplos de vehículos sólidos son tierras minerales tales como sílica geles, silicatos, talco, caolín, atarcilla, caliza, cal, tiza, bolo, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomáceas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos triturados, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal tales como tortas de cereales, tortas de corteza de árbol, tortas de madera y tortas de cubierta de nueces, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.
- En general, las formulaciones comprenden de 0.01 a 95% en peso, preferiblemente de 0.1 a 90% en peso, de los compuestos activos. En este caso, los compuestos activos se emplean con una pureza del 90% a 100% en peso, preferiblemente de 95% a 100% en peso (de acuerdo con un espectro de RMN).
- 10 Para propósitos de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas pueden ser diluidas de 2 a 10 veces llevando a concentraciones en las preparaciones listas para el uso de 0.01 a 60% en peso de compuesto activo por peso, preferiblemente 0.1 a 40% en peso.
- 15 Los compuestos de la fórmula I puede ser usado como tal, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, por ejemplo en la forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, productos pulverizables, materiales para dispersión o gránulos, directamente asperjables, por medio de aspersión, atomización, pulverización, dispersión o vertimiento. Las formas de uso dependen completamente de los propósitos buscados, están previstas para asegurar en cada caso la distribución más fina posible de los compuestos activos de acuerdo con la invención.
- 20 Las formas de uso acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos humectables (polvos asperjables, dispersiones en aceite) agregando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o solvente, pueden homogeneizarse en agua por medio de un humectante, aglomerante, dispersante o emulsificante. Sin embargo, es posible preparar concentrados compuestos de sustancias activas, humectantes, aglomerantes, dispersante o emulsificantes y, si es apropiado, un solvente o un aceite, y tales concentrados son adecuados para dilución con agua.
- 25 Las concentraciones del compuesto activo en las preparaciones listas para el uso pueden variar dentro de rangos relativamente amplios. En general, van de 0.0001 a 10%, preferiblemente de 0.01 a 1% en peso.
- Los compuestos activos también pueden utilizarse exitosamente en el proceso de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden 95% en peso de ingrediente activo, o incluso aplicar el ingrediente activo sin aditivos.
- Los siguientes son ejemplos de formulaciones:
- 30 1. Productos para dilución con agua para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a la semilla diluidos o no diluidos.
- A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)
- 35 10 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 90 partes en peso de agua o un solvente soluble en agua. Como alternativa, se agregan humectantes u otros auxiliares. El compuesto activo se disuelve por dilución con agua, mediante lo cual se obtiene una formulación al 10% (p/p) de compuesto activo.
- B) Concentrados dispersables (DC)
- Se disuelven 20 partes en peso del compuesto activo en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua da una dispersión, mediante la cual se obtienen una formulación con 20% (p/p) de compuestos activos.
- 40 C) Concentrados emulsificables (EC)
- Se disuelven 15 partes en peso de los compuestos activos en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecilmencenosulfonato de calcio y aceite de castor etoxilado (en cada caso 5 partes en peso). La dilución con agua produce una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 15% (p/p) de compuestos activos.
- D) Emulsiones (EW, EO, ES)
- 45 Se disuelven 25 partes en peso del compuesto activo en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecilmencenosulfonato de calcio y aceite de castor etoxilado (en cada caso 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsificadora (por ejemplo Ultraturax) y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 25% (p/p) de compuesto activo.

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

5 En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para dar una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto activo.

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

10 Se trituran finamente 50 partes en peso del compuesto activo con la adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se fabrican gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua por medio de dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de aspersion, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto activo, mediante la cual se obtiene una formulación con 50% (p/p), del compuesto activo.

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

15 Se trituran 75 partes en peso del compuesto activo en un rotor-estator con la adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y sílica gel. La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación del 75% (p/p) del compuesto activo.

H) Formulación en gel (GF)

20 En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con la adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de un agente gelificante, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para dar un suspensión fina del compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p), del compuesto activo.

2. Productos para aplicar no diluidos para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a la semilla diluidos o no diluidos.

I) Polvos pulverizables (DP, DS)

25 5 partes en peso del compuesto activo se trituran finamente y se mezclan de manera íntima con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto pulverizable que tiene 5% (p/p) del compuesto activo.

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

Se trituran finamente 0.5 partes en peso del compuesto activo y se asocian con 95.5 partes en peso de vehículos, mediante lo cual se obtiene una formulación con 0.5% (p/p) de compuesto activo. Los métodos habituales son extrusión, aspersion-secado o lecho fluidizado. Esto da gránulos que se pueden aplicar sin dilución para uso foliar.

30 K) Soluciones ULV (UL)

10 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 90 partes en peso de un solvente orgánico, por ejemplo, xileno. Esto da un producto que tiene 10% (p/p) de compuesto activo, el cual se aplica sin dilución para uso foliar.

35 Los compuestos de las fórmulas I o II son también adecuados para el tratamiento de materiales de propagación de plantas (tales como semillas). Las formulaciones convencionales para tratamiento de semillas incluyen por ejemplo concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en pasta WS, polvos solubles en agua SS y emulsiones ES y CE y formulaciones en gel GF. Estas formulaciones pueden aplicarse a la semilla diluidas o no diluidas. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, bien sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado estas últimas

40 En una realización preferida se usa una formulación FS para un tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación FS puede comprender de 1 a 800 g/l de ingrediente activo, de 1 a 200 g/l de surfactante, de 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglomerante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de solvente, preferiblemente agua.

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

Diversos tipos de aceites, agentes humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas, o bactericidas pueden agregarse a los ingredientes activos, si es apropiado justo inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Estos agentes usualmente se mezclan con los agentes de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:10 a 10: 1.

- 5 Los compuestos de fórmulas I o II son efectivas tanto a través de contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, partes de plantas o partes de animales), y la ingestión (cebo, o parte de la planta).

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

- 10 El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo un gel). Los cebos sólidos pueden conformarse en diversas formas y configuraciones adecuadas a la aplicación respectiva, por ejemplo gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos pueden llenarse en diversos dispositivos para asegurar una aplicación apropiada, por ejemplo, contenedores abiertos, dispositivos de aspersión, fuentes de goteo o fuentes de evaporación. Los geles pueden basarse en matrices acuosas u oleosas y pueden formularse de acuerdo con las necesidades particulares en términos de adhesividad, retención de humedad o características de envejecimiento.

- 15 El cebo empleado en la composición es un producto, que es suficientemente atractivo para incitar los insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, saltamontes, etc., o cucarachas a comerlo. La atracción puede manipularse utilizando estimulantes de la alimentación o feromonas sexuales. Se escogen estimulantes para la alimentación, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (carne, pescado, sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melazas o miel. Partes frescas o decadentes de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos pueden también servir como estimulante para la alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas para los insectos. Feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas para las personas experimentadas en la técnica.

- 25 Las formulaciones de los compuestos de las fórmulas I o II como aerosoles (por ejemplo en latas de aspersión), aspersiones en aceite o aspersiones por bombeo son altamente adecuados para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas en aerosol están compuestas preferiblemente del compuesto activo, solventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona), hidrocarburos parafínicos (por ejemplo, querosenos) que tienen rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetil sulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, auxiliares adicionales tales como emulsificantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tienen 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilado de alcoholes grasos, aceites perfumados tales como aceites etéreos, ésteres o ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos de carbonilo aromáticos, si es apropiado estabilizantes tales como benzoato de sodio, surfactantes anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si se requiere, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de aspersión en aceite difieren de las recetas en aerosol en que no se utilizan propelentes.

- 40 Los compuestos de la fórmula I o y sus composiciones respectivas pueden utilizarse en alambres para mosquitos y de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles para polillas, paños para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

- 45 Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la fórmulas I o II y sus respectivas composiciones comprenden también tratar superficies de construcciones y casas, aspersión en aire e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestuario, mosquiteros, trampas para mosca tsetsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a telas, textiles, tejidos, material no tejido, material para redes o láminas y tarpaulinas comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglomerante. Repelentes adecuados por ejemplo son N,N-Dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, ácido (2-hidroximetilciclohexil) acético lactona, 2-etil-1,3-hexandiol, indalon, Metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-allyl-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin), un repelente derivado de o idéntico a extractos de plantas tales como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos crudos vegetales de plantas tales como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cimnopogan martinii, Cimnopogan citratus (limonaria), Cimopogan nardus (citronela). Los aglomerantes 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 acrílico y metacrílico de alcoholes, tales como acrilato de butilo, 2-etilhexilacrilato, y acrilato de metilo, hidrocarburos insaturados mono- y dietilénicamente, tales como estireno, y dienos alifáticos tales como butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteros se hace en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o asperjándolos sobre las redes.

Métodos que se pueden emplear para tratar el material de propagación de plantas, en particular la semilla son, en principio, todo tratamiento de semillas adecuado y, especialmente, las técnicas de revestimiento de semillas conocidas en la técnica, tales como recubrimiento de semillas (por ejemplo peletización de la semilla), pulverización de semillas e inhibición de semillas (por ejemplo, inmersión de semillas). Aquí, "tratamiento de semillas" se refiere a todos los métodos que traen material de propagación de las plantas, en particular, las semillas, y los compuestos de fórmulas I o II en contacto unos con otros, y "tratamiento de semillas" a los métodos de tratamiento de semillas que proveen las semillas con una cantidad de los compuestos de fórmulas I o II, o una sal de los mismos o N-óxido de los mismos, esto es, que generan un material de propagación de plantas, en particular, la semilla que comprende el compuesto de fórmulas I o II, o una sal de los mismos, o N-óxido de los mismos. En principio, el tratamiento se puede aplicar al material de propagación de plantas, en particular, a la semilla en cualquier momento desde la cosecha del material de propagación de plantas, en particular de la semilla para la siembra del material de propagación de plantas, en particular de la semilla. El material de propagación de la planta, en particular, la semilla se puede tratar inmediatamente antes o durante la siembra del material de propagación de la planta, en particular, de la semilla, por ejemplo, usando el método de " **caja de jardinería**". Sin embargo, el tratamiento también puede llevarse a cabo de 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 material de propagación de plantas sin sembrar, en particular, a las semillas sin sembrar. Tal como se utiliza aquí, el término "semilla no sembrada" se entiende que incluye la semilla en cualquier período de la cosecha de la semilla para la siembra de la semilla en la tierra con el propósito de la germinación y el crecimiento de la planta.

Específicamente, un procedimiento es seguido en el tratamiento en el que el material de propagación de las plantas, en particular la semilla, se mezcla, en un dispositivo adecuado, por ejemplo un dispositivo de mezcla para los asociados de la mezcla sólida o líquida/sólida, con la cantidad deseada de formulaciones de tratamiento de semillas, ya sea como tal o después de dilución previa con agua, hasta que la composición se distribuya uniformemente sobre la semilla. Si es apropiado, esto es seguido por una etapa de secado.

Los compuestos de las fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables de los mismos desde el punto de vista veterinario, también son en particular, adecuados para ser utilizados para combatir parásitos en y sobre animales.

Por lo tanto, un objeto adicional de la presente invención es proveer un compuesto de fórmula I o II para uso en nuevos métodos para el control de parásitos en y sobre animales. Otro objeto de la invención es proveer plaguicidas más seguros para animales. Otro objeto de la invención es además proveer plaguicidas para animales que pueden utilizarse en dosis más bajas que los pesticidas existentes. Y otro objeto de la invención es proveer plaguicidas para animales, que provean un largo control residual de los parásitos.

La invención también se refiere a composiciones que contienen una cantidad efectiva como parasiticida de compuestos de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y un vehículo aceptable, para combatir parásitos en y sobre animales.

La presente invención también provee un método no terapéutico para tratar, controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende aplicar a un locus una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que lo comprende.

La presente invención también provee un compuesto de fórmula I o II para uso en un método para tratar, controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administración o aplicación por vía oral, por vía tópica o parenteral a los animales de una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que lo comprende.

La invención también provee un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende incluyendo una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos en una composición que comprende tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos.

La invención se refiere además al uso de compuestos de fórmula I para tratar, controlar, prevenir o proteger 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 una composición que lo comprende, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento terapéutico de animales contra la infección o infestación por parásitos.

La actividad de compuestos contra plagas agrícolas no sugiere su adecuabilidad para el control de endo- y ectoparásitos en y sobre animales que los requieran, por ejemplo, dosificaciones bajas, no eméticas en el caso de la aplicación oral, la compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad, y un manejo seguro.

5 Sorprendentemente, se ha encontrado que los compuestos de fórmulas I o II, sus sales y sus N-óxidos, son adecuados para combatir endo- y ectoparásitos en y sobre animales.

10 Los compuestos de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptable desde el punto de vista veterinario o N-óxidos de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales incluidos los animales de sangre caliente (incluyendo humanos) y peces. Son, por ejemplo adecuados para controlar y prevenir las infestaciones e infecciones en mamíferos tales como vacas, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, gamos y renos, y también en animales de pieles como el visón, la chinchilla, mapaches, aves como gallinas, gansos, pavos y patos y peces como pescado de agua dulce y de agua salada como la trucha, la carpa y anguilas.

15 Los compuestos de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y composiciones que los comprenden se usan preferiblemente 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 no se limitan a, los piojos, piojos masticadores, garrapatas, lombrices nasales, keds, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasíticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

20 Los compuestos de fórmulas I o II o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y composiciones que los comprenden son apropiados para control sistémico y/o no sistémico de ecto y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas etapas de desarrollo.

Los compuestos de fórmulas I o II sus sales y sus N-óxidos son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

25 Los compuestos de fórmulas I o II, sus sales y sus N-óxidos son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y 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*,

30 moscas, 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*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus interstitialis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina 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 eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*,

45 garrapatas y ácaros parasíticos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (Mesostigmata), por ejemplo *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

50 actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata) por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* 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., y *Laminosioptes* spp,

bichos (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *R^eduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. y *Arilus critatus*,

- 5 Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., y *Solenopotes* spp., Mallophagida (subórdenes *Armblycerina* y *Ischnocerina*), por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp,

Gusanos Nematoda:

Gusanos frotadores y Trichinosis (*Trichosyringida*), por ejemplo *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,

Rhabditida, por ejemplo *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,

- 10 *Strongylida*, por ejemplo *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (Hookworm), *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 *Dioctophyma renale*,
- 15

gusanos intestinales (*Ascaridida*), por ejemplo *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara canis*,

Toxascaris leonine, *Skrjabinema* spp., y *Oxiuris-equi*,

Camallanida, e.g *Dracunculus medinensis* (guinea worm),

- 20 *Spirurida*, por ejemplo *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilaria* spp.a, *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,

Planarios (*Plathelminthes*):

- 25 *Lombrices del ganado* (*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,

- 30 *Cercomeromorpha*, en particular *Cestoda* (Tapeworms), por ejemplo *Diphyllbothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., y *Hymenolepis* spp.

Los compuestos de fórmulas I o II, sus sales y sus N-óxidos y composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes *Diptera*, *Siphonaptera* e *Ixodida*.

Por otra parte, se prefiere especialmente el uso de las fórmulas I o II, sus sales y sus N-óxidos y composiciones que los contienen para combatir mosquitos.

- 35 El uso de los compuestos de fórmulas I o II, sus sales y sus N-óxidos y composiciones que los contienen para combatir moscas es una forma de realización preferida adicional de la presente invención.

Adicionalmente, se prefiere especialmente el uso de los compuestos de fórmulas I o II, sus sales y sus N-óxidos y composiciones que los contienen para combatir pulgas.

- 40 El uso de los compuestos de fórmulas fórmula I o II, sus sales y sus N-óxidos y composiciones que los contienen para combatir garrapatas es una forma de realización preferida adicional de la presente invención.

Los compuestos de fórmulas I o II, sus sales y sus N-óxidos son también especialmente útiles para combatir endoparásitos (gusanos nematodos, gusanos de cabeza espinosa y planarios).

Los compuestos de fórmula I pueden ser efectivos tanto a través de contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombras, mantas o partes de animales) y la ingestión (por ejemplo cebos).

La presente invención se refiere al uso terapéutico y no terapéutico de compuestos de fórmula I para el control y/o combatir parásitos en y/o en animales.

5 Los compuestos de fórmula I se pueden usar para proteger a los animales de ataque o infestación por parásitos poniéndolos en contacto con una cantidad efectiva como parasitario de compuestos de fórmula I. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente en el parásito, por ejemplo, también en su locus, y opcionalmente también la administración de los compuestos/composición directamente en el animal) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito mediante la aplicación a su locus es un ejemplo de un uso no terapéutico de compuestos de fórmula I.

10 "Locus" como se definió anteriormente significa el hábitat, el suministro de alimentos, el terreno de crianza, el área, material o ambiente en el cual un parásito está creciendo o puede crecer fuera del animal. Los compuestos de la invención también pueden aplicarse preventivamente en lugares en los que se espera la presencia de las plagas o parásitos.

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

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

20 Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de fórmula I o II se pueden formular como alimentos para animales, premezclas para alimentos de animales, concentrados para alimentación de animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pociones, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de fórmulas I o II pueden administrarse a los animales en su agua de abrevadero. Para la administración oral, la forma de dosificación escogida debe proveer al animal con 0.01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de las fórmulas I o II, preferiblemente con 0.5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

25 Alternativamente, los compuestos de las fórmulas I o II pueden administrarse a los animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intraluminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de las fórmulas I o II pueden dispersarse o disolverse en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de las fórmulas I o II pueden formularse en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de las fórmulas I o II puede administrarse por vía transdérmica a los animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación escogida debería proveer al animal con 0.01 mg/kg hasta 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de las fórmulas I o II.

30 Los compuestos de las fórmulas I o II también pueden aplicarse por vía tópica a los animales en forma de gotas, polvos, pulverizados, collares, medallones, aspersiones, champús, formulaciones para aplicación y vertimiento y en ungüentos o en emulsiones aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, las gotas y las aspersiones contienen usualmente 0.5 ppm a 5 000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3 000 ppm del compuesto de las fórmulas I o II. Además, los compuestos de las fórmulas I o II pueden formularse en etiquetas para orejas para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado y ovejas.

Preparaciones adecuadas son:

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

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

40 Formulaciones en las que el compuesto activo es procesado en una base de ungüento o en una emulsión aceite-en-agua o agua-en-aceite;

Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, pellas, tabletas, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes, y artículos conformados que contienen el compuesto activo.

45 Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un solvente adecuado y agregando opcionalmente ingredientes adicionales tales como ácidos, bases, sales reguladoras, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se empaquetan de manera estéril.

Solventes adecuados son solventes fisiológicamente tolerables tales como agua, alcanoles tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilen glicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de los mismos.

50 Los compuestos activos pueden disolverse opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables los cuales son adecuados para inyección.

Solubilizantes adecuados son solventes que promueven la disolución del compuesto activo en el solvente principal o evita su precipitación. Ejemplos son polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite de castor polioxetilado y éster de sorbitano polioxetilado.

Conservantes adecuados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

- 5 Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran oralmente después de una dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones y concentrados orales se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y tal como se describió anteriormente para soluciones para inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.

Las soluciones para uso sobre la piel son rociadas, esparcidas, frotadas, pulverizadas o asperjadas.

- 10 Las soluciones para uso sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo a lo que se describe anteriormente para soluciones en inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.

Solventes adecuados adicionales son polipropilén glicol, fenil etanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicol alquiléter, por ejemplo, dipropilenglicol monometiléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcutool y solketal, carbonato de propileno y mezclas de los mismos.

- 15

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

- 20 Los geles se aplican por distribución sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que han sido preparadas tal como se describe en el caso de las soluciones para inyección con un aglomerante suficiente de tal forma que da como resultado un material claro que tiene una consistencia similar a un ungüento. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.

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

- 25 Las formulaciones para vertimiento se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsificando el compuesto activo en solventes o mezclas de solventes compatibles con la piel. Si es apropiado, se agregan otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores frente a la luz, adhesivos.

Solventes adecuados son: 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 éteres de alquilen glicol alquilo, tales como dipropilén glicol monoetil éter, dietilenglicol mono-butil éter, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, carbonatos cíclicos tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, N-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oximetilén-1,3-diox-olano y glicerol formal.

- 30

- 35 Colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para uso en animales y que pueden ser disueltos o suspendidos.

Sustancias promotoras de la absorción adecuada son, por ejemplo, DMSO, aceites de aplicación tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

- 40 Antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

Estabilizadores frente a luz adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

Adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de la celulosa, derivados de almidón, poliácridatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatinas.

- 45 Las emulsiones pueden administrarse oralmente, por vía dérmica o como inyecciones.

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

Se preparan disolviendo el compuesto activo, bien sea en la fase hidrófoba o en la hidrofílica y homogeneizándolas con el solvente de la otra fase con la ayuda de emulsificantes adecuados y, si es apropiado, otros auxiliares tales

ES 2 546 404 T3

como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz, sustancias potenciadoras de la viscosidad.

Fases hidrófobas adecuadas (aceites) son:

5 parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendras, aceite de castor, triglicéridos sintéticos tales como biglicéridos caprílico/cáprico, mezclas de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de longitud de cadena C₈-C₁₂ u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas parciales de glicéridos de ácidos grasos saturados o insaturados posiblemente también con contenido de grupos hidroxilo, mono y diglicéridos de los ácidos grasos C₈-C₁₀,

10 ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, perlargonato de dipropilen glicol, ésteres de ácidos grasos ramificados o de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₆-C₁₈, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₂-C₁₈, estearato de isopropilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos tales como grasa de la glándula coccigeal de pato sintética, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionadas con estos últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleílico, ácidos grasos tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

15 Fases hidrofílicas adecuadas son: agua, alcoholes tales como propilen glicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

Emulsificantes adecuados son:

20 surfactantes no iónicos, por ejemplo, aceite de castor polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monoestearato de sorbitano, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol éter; surfactantes anfólicos tales como N-lauril-p-iminodipropionato de di-sodio o lecitina; surfactantes aniónicos, tales como lauril sulfato de sodio, sulfatos de éteres de alcoholes grasos, mono/dialquil poliglicol éter y sales de monoetanolamina de ésteres de ácido ortofosfórico; surfactantes activos anticaciones, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

25 Auxiliares adecuados adicionales son: sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliácridatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilén glicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

30 Las suspensiones pueden administrarse oralmente o por vía tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si es apropiado con adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz.

Los agentes de suspensión en líquido son todos solventes y mezclas de solventes homogéneos.

35 Agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulsificantes dados anteriormente.

Otros auxiliares que pueden mencionarse son los que se dan anteriormente.

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

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

45 Excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Se utilizan 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, sílica precipitada o coloidal, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos y piensos tales como leche en polvo, torta de animales, tortas y deshechos de granos y almidones.

Auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

50 Otros auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la desintegración, tales como almidón o polivinilpirrolidona entrecruzada, aglomerantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglomerantes en seco tales como celulosa microcristalina.

- En general, "cantidad efectiva como parasitocida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para alcanzar un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardamiento, prevención y eliminación, destrucción o disminución de alguna otra manera de la presencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como parasitocida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como parasitocida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como efecto y duración parasitocidas deseados, especie objetivo, modo de aplicación y similares.
- Las composiciones que pueden utilizarse en la invención pueden comprender generalmente desde aproximadamente 0.001 a 95% del compuesto de las fórmulas I o II.
- En general es favorable aplicar los compuestos de las fórmulas I o II en cantidades totales de 0.5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.
- Las preparaciones listas para el uso contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferiblemente de 0.1 a 65 por ciento en peso, más preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso, lo más preferiblemente de 5 a 40 por ciento en peso.
- Las preparaciones que se diluyen antes del uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones de 0.5 a 90 por ciento en peso, preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso.
- Adicionalmente, las preparaciones comprenden los compuestos de las fórmulas I o II contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferiblemente de 0.05 a 0.9 por ciento en peso, muy particularmente de forma preferible de 0.005 a 0.25 por ciento en peso. En una realización preferida de la presente invención, las composiciones que comprende los compuestos de las fórmulas I o II se aplican por vía dérmica/tópica.
- En una realización preferida adicional, la aplicación tópica se lleva a cabo en la forma de artículos conformados que contienen el compuesto tales como collares, medallones, etiquetas para oreja, bandas para fijar a partes del cuerpo, y tiras y láminas adhesivas.
- En general es favorable aplicar las formulaciones sólidas que liberan los compuestos de las fórmulas I o II en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.
- Para la preparación de los artículos conformados, se utilizan termoplásticos y plásticos flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Los plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster que son suficientemente compatibles con los compuestos de las fórmulas I o II. Una lista detallada de plásticos y elastómeros así como de procedimientos de preparación para los artículos conformados se da por ejemplo en WO 03/086075.
- Composiciones para ser usadas de acuerdo con esta invención también puede contener otros ingredientes activos, por ejemplo otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de las plantas, aseguradores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales pueden utilizarse secuencialmente o en combinación con las composiciones antes descritas, si es apropiado también agregados únicamente justo antes del uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, las plantas pueden ser asperjadas con una composición de esta invención bien sea antes o después de ser tratadas con otros ingredientes activos.
- Estos agentes pueden mezclarse con los agentes usados de acuerdo con la invención en una proporción en peso de 1:10 a 10:1. Mezclando los compuestos de las fórmulas I o II o las composiciones que los comprenden en la forma de uso como pesticidas con otros pesticidas da como resultado frecuentemente un espectro de acción pesticida más amplio.
- La siguiente lista M de pesticidas junto con los cuales pueden utilizarse los compuestos de acuerdo con la invención y con los cuales se podría producir efectos sinérgicos potenciales pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no impone ninguna limitación:
- M.1. Organo(tio)fosfatos: acephate, azamethiphos, azinphos-etilo, azinphosmetilo, cloretoxifos, clorfenvinphos, clormephos, clorpyrifos, chlorpyrifosmetilo, coumaphos, cianophos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/ DDVP, dicrotophos, dimetoate, dimetilvinphos, disulfoton, EPN, etion, etoprophos, famphur, fenamiphos, fenitroton, fention, flupirazophos, fostiazate, heptenophos, isoxation, malation, mecarbam, metamidophos, metidation, mevinphos, monocrotophos, naled, ometoate, oxidemeton-metilo, paration, paration- metilo, phentoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metilo, profenofos, propetamphos, protiofos, piraclofos, piridapention, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, tiometon, triazophos, triclofon, vamidotion;

ES 2 546 404 T3

- M.2. Carbamatos: aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanate, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, methomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimethacarb, XMC, xililcarb y triazamate;
- 5 M.3. Piretroides: acrinatrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin Scylclopentenilo, bioresmethrin, cicloprothrin, ciflutrin, betaciflutrin, cihalotrin, lambda-cihalotrin, gamma-cihalotrin, cipermethrin, alphacipermetrin, beta-cipermetrin, theta-cipermetrin, zeta-cipermethrin, ciphenotrin, deltametrin, empentrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropatrin, fenvalerate, flucitrin, flumetrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprotrin, metoflutrin, permetrin, phenotrin, pralletrin, proflutrin, piretrin (pyrethrum), resmetrin, silafluofen, teflutrin, tetrametrin, tralometrin y transflutrin;
- 10 M.4. Imitadores de la hormona juvenil: hidropreno, kinopreno, metopreno, fenoxicarb y piriproxifen;
- M.5. Compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: acetamiprid, bensultap, clorhidrato de cartap, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, nicotine, spinosad (agonista alostérico), spinetoram (agonista alostérico), tiacloprid, tiocyclam, tiosultap-sodio y AKD1022.
- 15 M.6. Compuestos antagonistas del canal de cloro controlado por GABA: clordano, endosulfan, gamma-HCH (lindane); etiprole, fipronil, pirafloprole y piriprole;
- M.7. Activadores del canal de cloro: abamectin, benzoato de emamectin, milbemectin, lepimectin;
- M.8. Compuestos METI I: fenazaquin, fenpiroximate, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, rotenone;
- M.9. Compuestos METI II y III: acequinocil, fluaciprim, hidrametilnon;
- 20 M.10. Desacopladores de fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;
- M.11. Inhibidores de fosforilación oxidativa: azociclotin, cihexatin, diafentiuron, óxido de fenbutatin, propargite, tetradifon;
- M.12. Perturbadores de la muda: cyromazine, cromafenozone, halofenozone, metoxifenozone, tebufenozone;
- M.13. Sinérgicos: piperonil-butóxido, tribufos;
- 25 M.14. Compuestos bloqueadores del canal de sodio: indoxacarb, metaflumizone;
- M.15. Fumigantes: metil bromuro, cloropicrin sulfúrico fluorado;
- M.16. Bloqueadores de alimentación selectiva: crilote, pimetrozina, flonicamid;
- M.17. Inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, hexitiazox, etoxazol;
- 30 M.18. Inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezin, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron;
- M.19. Inhibidores de la biosíntesis de lípidos: spirodiclofen, spiromesifen, spirotriamat;
- M.20. Agonistas octapaminérgicos: amitraz;
- M.21. Moduladores del receptor de rianodina: flubendiamida y (R)- y (S)-3-Clor-N1-{2metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)phthalamid (M21.1);
- 35 M.22. Diversos: fosfuro de aluminio, amidoflomet, benclotiaz, benzoximate, bifenazate, borax, bromopropilato, cianida, cienopirafen, ciflumetofen, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridilil, pirifluquinazon, azufre, compuestos orgánicos de azufre, tártaro emético, sulfoxaflor, 4-But-2-iniloxi-6-(3,5-dimetil-piperidin-1-il)-2-fluoropirimidina (M22.1), 3-Benzoilamino-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-
- 40 benzamida (M22.2), 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-piridin-2-ilmetil-benzamida (M22.3), 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(2,2,2-trifluoro-etil)-benzamida (M22.4), 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-tiazol-2-ilmetil-benzamida (M22.5), 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-metil-N-(tetrahydro-furan-2-ilmetil)-benzamida (M22.6), 4-[[[(6-Bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-on (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-
- 45

- 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), ácido ciclopropanoacético, 1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[[2-ciclopropilacetil)oxi]metil]- 1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-12-hidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto[2,1- b]pirano[3,4-e]piran-3,6-diil] éster (M22.17), 8-(2-Ciclopropilmetoxi-4-metil-fenoxi)-3-(6-metil-piridazin- 3-il)-3-azabicyclo[3.2.1]octano (M22.18),
- 5 M.23. N-R'-2,2-dihalo-1-R" ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -tri-fluoro-p-toluil)hidrazona o N-R'- 2,2-di(R"')propionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-toluil)-hidrazona, en donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R" es hidrógeno o metilo y R"' es metilo o etilo;
- 10 M.24. Antranilamidas: clorantranilprol, ciantranilprol, [4-ciano-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.1), [2-cloro-4-ciano-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin- 2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.2), [2-bromo-4-ciano-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)- fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.3), [2-bromo-4- cloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.4), [2,4-dicloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3- carboxílico (M24.5), [4-cloro-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin- 2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.6);
- 15 M.25. Compuestos de malononitrilo: $CF_2HCF_2CF_2CF_2C_{H_2}C(CN)_2C_{H_2}C_{H_2}CF_3$, (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)- 2-(3,3,3-trifluoro-propil)malononitrilo), $CF_2HCF_2CF_2CF_2C_{H_2}C(CN)_2C_{H_2}C_{H_2}CF_2CF_3$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)- 2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)-malonodinitrilo);
- 20 M.26. Perturbadores 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 se pueden encontrar, entre otras publicaciones, en The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council (2003).
- 25 Tioamidas de formula M6.1 y sus preparaciones se han descrito en WO 98/28279. Lepimectina es conocida de Agro Project, PJB Publications Ltd, November 2004. Benclotiaz y su preparación se ha descrito en EPA1 454621. Methidation y Paraoxon y sus preparaciones se han descrito en Farm Chemicals Handbook, Volume 88, Meister Publishing Company, 2001. Acetoprole y su preparación se ha descrito en WO 98/28277. Metaflumizone y su preparación se ha descrito en EP-A1 462 456. Flupirazofos se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988, p.237-243
- 30 y en la US 4822779. Pirafluprole y su preparación se ha descrito en JP 2002193709 y en WO, 01/00614. Piriprole y su preparación se ha descrito en WO 98/45274 y en US 6335357. Amidoflumet y su preparación se ha descrito en US 6221890 y en JP 21010907. Flufenerim y su preparación se ha descrito en WO 03/007717 y en WO 03/007718. AKD 1022 y su preparación se ha descrito en US 6300348. Clorantranilprole se ha descrito en WO 01/70671, WO 03/015519 y WO 05/118552. Ciantranilprole se ha descrito en WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. Las antranilamidas M 24.1 a M 24.6 se han descrito en WO 2008/72743 y WO 200872783. La ftalamida M 21.1 es conocida de WO 2007/101540. Ciflumetofen y su preparación se ha descrito en WO 04/080180. El compuesto de aminoquinazolinona pirifluquinazon se han descrito en EP A 109 7932. Sulfoximina sulfoxaflo se ha descrito en WO 2006/060029 y WO 2007/149134. El compuesto de alquililéter M22.1 se describe por ejemplo en JP 2006131529.
- 35 Compuestos de azufre orgánicos se han descrito en WO 2007060839. El compuesto de carboxamida M 22.2 es conocido de WO 2007/83394. Los compuestos de oxazolina M 22.3 a M 22.6 se han descrito en WO 2007/074789. Los compuestos de furanona M 22.7 a M 22.16 se han descrito en por ejemplo en WO 2007/115644. El derivado de piripropene M 22.17 se ha descrito en WO 2008/66153 y WO 2008/108491. El compuesto de piridazin M 22.18 se ha descrito en JP 2008/115155. Los compuestos de malononitrilo se han descrito en WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694.
- 40
- 45 Asociados de mezcla fungicidas son, en particular, los seleccionados del grupo que consiste de acilalaninas tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo, derivados de amina tales como aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamin, tridemorph, anilopirimidinas tales como pyrimethanil, mepanipyrim o cyrodinilo, antibióticos tales como cicloheximid, griseofulvin, kasugamycin, natamycin, polyoxin o streptomycin, azoles tales como bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, prochloraz, protioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazole, flutriafol, dicarboximidas tales como iprodion, myclozolin, procymidon, vinclozolin, ditiocarbamatas tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamate, thiram, ziram, zineb, compuestos heterocíclicos tales como anilazine, benomilo, boscalid, carbendazim, carboxin, oxicarboxin, cyazofamid, dazomet, ditianon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpyr, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pyrifenox, pyroquilon, quinoxifen, siltiofam, tiabendazole, thifluzamid, tiofanato-metilo, tiadinil, tricyclazole, triforine, fungicidas de cobre tales como mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato básico de cobre, derivados de nitrofenilo tales como binapacril, dinocap, dinobuton, nitrophthalisopropil, fenilpirroles tales como fencpiclonil o fludioxonil, azufre, otros fungicidas tales como acibenzolar-
- 50
- 55

S-metilo, bentiavalicarb, carpropamid, clorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, diclomezin, diclocymet, diethofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentin-acetato, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetilo, fosetylaluminum, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenon, pencycuron, propamocarb, phthalide, toloclofos-metilo, quintozone, zoxamid, estrobilurinas tales como azoxistrobin, dimoxistrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin, orysastrobin, picoxistrobin o trifloxistrobin, derivados de ácido sulfénico tales como captafol, captan, diclofluanid, folpet, tolylfluanid, cinemamidas y análogos tales como dimethomorph, flumetover o flumorph.

5
10 La plaga invertebrada, esto es, los artrópodos y nematodos, la planta, suelo o agua en el cual la planta está creciendo pueden ponerse en contacto con los presentes compuestos de las fórmulas I o III o composiciones que los contienen por cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones sobre la plaga invertebrada o planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus de la plaga invertebrada o planta).

15 Por otra parte, las plagas invertebradas pueden ser controladas poniendo en contacto la plaga objetivo, su suministro de alimento, hábitat, terrenos de cría o su locus con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de las fórmulas I o II, una sal o un N-óxido de los mismos. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del locus, los cultivos, o cultivos cosechados, por la plaga.

"Locus" significa un hábitat, terreno de cría, plantas cultivadas, material de propagación de la planta (tal como semillas), suelo, área, material o ambiente en el cual una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

20 En general, "cantidad efectiva como pesticida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para alcanzar un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardamiento, prevención y eliminación, destrucción o de alguna otra forma disminución de la presencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como pesticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como pesticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como efecto y duración pesticidas deseados, clima, especies objetivo, locus, modo de aplicación, y similares.

25 Los compuestos de las fórmulas I o II, sus sales y los N-óxidos de los mismos y las composiciones que comprenden dichos compuestos pueden utilizarse para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas, durmientes, etc., y construcciones tales como casas, casas exteriores, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc., frente a hormigas y/o termitas, y para controlar hormigas y termitas y evitar que hagan daño a cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden las casas y las instalaciones públicos). Los compuestos de las fórmulas I o II se aplican no solamente en la superficie del suelo circundante o en el suelo bajo el piso con el fin de proteger los materiales de madera sino que también puede aplicarse a artículos elaborados en madera tales como superficies de concreto bajo el piso, soportes, vigas, aglomerados, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, tableros medios, etc., y artículos de vinilo, tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante del calor, tales como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que afectan cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de las hormigas o similares.

30 Los compuestos de fórmulas I y II, sus sales y N-óxido de los mismos también se pueden aplicar preventivamente a lugares en los que se espera la presencia de las plagas.

35 Los compuestos de las fórmulas I o II, sus sales y N-óxido de los mismos también se pueden utilizar para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de las fórmula I o II, una sal o un N-óxido de los mismos. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta – típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta)

40 En el caso del tratamiento de suelos o para aplicación al sitio de alojamiento de las plagas o nido, la cantidad de ingrediente activo varía desde 0.0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente desde 0.001 a 20 g por 100 m².

45 Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0.01 g hasta 1000 g del compuesto activo por m² al material tratado, deseablemente de 0.1 g a 50 g por m².

50 Las composiciones insecticidas para la impregnación de los materiales contienen típicamente de 0.001 a 95% en peso, preferiblemente de 0.1% 45% en peso, y más preferiblemente de 1 a 25% en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

55 Para uso en las composiciones de cebo, el contenido típico del ingrediente activo va de 0.001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0.001% en peso a 5% en peso del compuesto activo.

Para el uso en composiciones para aspersión, el contenido del ingrediente activo va de 0.001 a 80% en peso, preferiblemente de 0.01 a 50% en peso y lo más preferiblemente de 0.01 a 15% en peso.

5 Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango 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 semilla, las tasas de aplicación de los ingredientes activos son generalmente de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular, de 1 g a 200 g por 100 kg de semilla.

La presente invención se ilustra ahora con más detalle mediante los siguientes ejemplos.

10 I. Ejemplos de preparación

Los procedimientos descritos en los siguientes ejemplos de preparación se utilizaron para preparar compuestos adicionales de las fórmulas I y II por la modificación apropiada del material de partida. Los compuestos resultantes, junto con los datos físicos, se listan en la tabla B más abajo.

15 Los productos se caracterizaron por HPLC (Espectrometría de Masas de Cromatografía líquida de alto rendimiento). HPLC se llevó a cabo usando una columna RP-18 analítica (Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania), que se hizo funcionar a 40 °C. Acetonitrilo con 0.1% en volumen de una mezcla de ácido trifluoroacético/agua y 0.1% en volumen de ácido trifluoroacético sirve como fase móvil; tasa de flujo 1.8 ml/min y el volumen de inyección: 2 µl. La espectrometría de masas puede llevarse a cabo usando un espectrómetro de masas con ionización por electroaspersión Cuadrupol a 80V en el modo positivo.

20 **Ejemplo 1:** piridazin-4-ilamida del ácido 5-Metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1H-pirazol-4-carboxílico

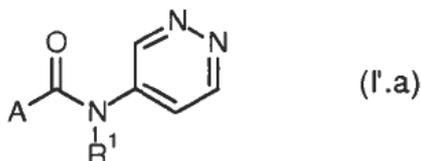
1.1 ácido 5-Metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1H-pirazol-4-carboxílico

25 18,6 g (100 mmol) of etil 2-[1-etoxi-metiliden]-3-oxo-butilato se agitaron en 110 mL de una solución de hidróxido de sodio acuoso 1 N a 0 °C. Después de 30 minutos se agregaron gota a gota 24.5 g (150 mmol) de 2,2,2-trifluoroetilhidrazina (solución acuosa al 70%) y se continuó agitando durante 30 minutos. Luego se agregaron 100 mL de ácido clorhídrico 2N a 0 °C y la mezcla de reacción se dejó calentar hasta 22 °C. La mezcla acuosa se extrajo con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de la evaporación del solvente se obtuvieron 16.8 g de 5-metil-1-(2,2,2-trifluoro-etil)-1H-pirazol-4-carboxilato de etilo crudo. El producto crudo se usó en la siguiente etapa sin purificación. El éster se trató con hidróxido de potasio (59.8 g, 106.7 mmol) en agua a 60 °C. Se continuó la agitación durante 2 horas antes de agregar 13 g (113,7 mmol) de ácido clorhídrico concentrado gota a gota. Después de agitar durante una hora a 0 °C un precipitado se aisló por filtración, el cual se lavó dos veces con agua fría. El material se secó a 50 °C i. vac. Así, se obtuvieron 8.67 g (59%) de ácido 5-metil-1-(2,2,2-trifluoro-etil)-1H-pirazol-4-carboxílico como un isómero individual.

1.2 piridazin-4-ilamida del ácido 5-Metil-1-(2,2,2-trifluoro-etil)-1H-pirazol-4-carboxílico

35 Se suspendieron 800 mg (3.9 mmol de ácido 5-metil-1-(2,2,2-trifluoro-etil)-1H-pirazol-4-carboxílico en 8 mL of tolueno y se agregaron dos gotas de dimetilformamida a la mezcla. Se agregaron 0.42 mL de tionilcloruro (5.8 mmol) a 65 °C a la mezcla de reacción y se continuó la agitación a esta temperatura durante cuatro horas. Después de la eliminación del solvente, se agregó tolueno y se repitió la evaporación. El material obtenido se disolvió en 2 mL de diclorometano y se agregó la solución gota a gota a una solución que contenía 309 mg (3,25 mmol) de 4-aminopiridazina, 2.0 g (6,5 mmol) diisopropil etil amin enlazada a polímero (resina PL-DIPAM, Polymer Laboratories) en 16 mL de diclorometano. La mezcla se agitó durante 16 h a 22 °C. Luego, el polímero se separó por filtración y se lavó con una mezcla de diclorometano/metanol (1:1). La solución que fue obtenida después del lavado contenía 662 mg (59%) de piridazin-4-ilamida del ácido 5-metil-1-(2,2,2-trifluoro-etil)-1H-pirazol-4-carboxílico como un sólido incoloro que no necesitó purificación adicional.

45 Compuestos de la fórmula I y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde R^t, R^u, y R^w son H, y X¹ es O son denominados de aquí en adelante como compuestos I'.a.



ES 2 546 404 T3

Compuestos de fórmula I'.a, que se prepararon de acuerdo con el método mencionado anteriormente, junto con sus datos físico-químicos se compilan en la Tabla B a continuación (Ejemplos 1 a 31). R¹ y A en cada caso tienen los significados dados en la línea correspondiente de la tabla B.

Tabla B: compuestos de fórmula I'.a preparados de acuerdo con el método anteriormente mencionado

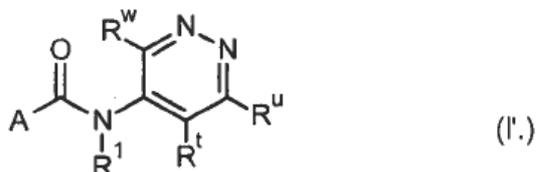
Ejemplo	R ¹	A	Datos físicoquímicos: r.t. [min]	Datos físico- químicos: m/z [*])
1	H	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	1.655	285
2	H	5-difluorometil-1-metilpirazol-4-ilo	1.588	253
3	H	1-(4-nitrofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.408	378
4	H	1-(4-fluorofenil)-5-metilpirazol-4-ilo	2.048	297
5	H	1-(2,2,2-trifluoroetil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.307	339
6	H	1,5-dietilpirazol-4-ilo	1.669	245
7	H	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	1.753	271
8	H	1-etil-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	1.847	285
9	C _{H3}	1-(2,2,2-trifluoroetil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.065	353
10	H	5-trifluorometil-1 H-pirazol-4-ilo	1.428	313
11	H	1-(4-trifluorometilfenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.757	401
12	C _{H3}	1-(4-nitrofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.360	392
13	H	5-difluorometil-1-(4-nitrofenil)pirazol-4-ilo	2.291	360
14	H	1-(4-metoxifenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.354	363
15	H	1-(4-fluorofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.363	351
16	H	1-metilpirazol-4-ilo	1.026	203
17	H	1-etilpirazol-4-ilo	1.274	217
18	H	1-(2,2-difluoroetil)pirazol-4-ilo	1.246	253
19	H	1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	1.457	271
20	H	1-(2,4-diclorofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.852	401
21	H	1-(4-clorofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.585	367
22	H	1,5-di(difluorometil)pirazol-4-ilo	1.840	289
23	H	1-(2,4-difluorofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	2.510	369

ES 2 546 404 T3

Ejemplo	R ¹	A	Datos fisicoquímicos: r.t. [min]	Datos físico- químicos: m/z*)
24	H	5-etil-1-(4-nitrofenil)pirazol-4-ilo	2.193	338
25	H	1-(difluorometil)pirazol-4-ilo	1.182	239
26	H	1-difluorometil-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	1.980	307
27	C _{H3}	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	2.153	335
28	C _{H3}	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	1.708	299.25
29	H	1-metil-3-(difluorometil)pirazol-4-ilo	1.506	253
30	H	1-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	1.663	257
31	H	1-(2-metilpropil)pirazol-4-ilo	1.905	245

r.t. = tiempo de retención de HPLC *)
m/z de los picos [M]⁺

Los compuestos de fórmula I., que se prepararon de acuerdo con el método mencionado anteriormente, junto con sus datos físico-químicos se compilan en la Tabla C a continuación



Ej. #	R ¹	A	R ^t	R ^u	R ^w	Datos fisicoquímicos: r.t. [min] / m/z*)
32	H	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.075 / 321
33	metilo	3-difluorometil-1-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.386 / 267
34	H	5-diclorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-pirazol-4-ilo	H	H	H	2.402 / 353
35	H	1-metil-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.757 / 271
36	H	5-bromo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-pirazol-4-ilo	H	H	H	1.979 / 351
37	H	5-pentafluoroetil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-pirazol-4-ilo	H	H	H	2.468 / 389
38	H	5-etoximetil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-pirazol-4-ilo	H	H	H	2.162 / 329
39	H	1-metil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.331 / 217
40	H	1-(4-trifluorometoxifenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.976 / 417

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^U	R ^W	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
41	H	1-(4-metanosulfonilfenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.053/ 411
42	H	1-(p-toluil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.651 / 347
43	H	1-fenil-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.438 / 333
44	H	1-(6-cloropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.511 / 368
45	H	1-(5-cloropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.564 / 368
46	metilo	1-metil-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.745 / 285
47	metilo	1-metil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.246 / 231
48	metilo	1-(4-trifluorometoxifenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	3.040 / 431
49	metilo	1-(4-metanosulfonilfenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.0827 / 425
50	metilo	1-(p-toluil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.702/ 361
51	metilo	1-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	3.102 / 415
52	metilo	1-fenil-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.457 / 347
53	metilo	1-(5-cloropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.691/ 382
54	metilo	1-(6-cloropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.645 / 382
55	metilo	5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.506 / 271
56	metilo	1-difluorometil-5-(difluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.718 / 303
57	H	5-dimetilcarbamoil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.608 / 342
58	H	5-(metilfenilcarbamoil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.218 404
59	H	5-metoximetil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.8151 / 315
60	metilo	5-(bencilometilcarbamoil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.443 / 432
61	metilo	5-metoximetil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.751 / 329
62	H	5-(bencilometilcarbamoil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.416 / 418
63	H	5-(etilmetilcarbamoil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.813 / 356
64	etilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.305 / 349
65	etilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.874 / 313
66	H	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	Cl	H	Cl	2.813 / 389

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
67	propilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.465 / 363
68	propilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.090 / 327
69	H	5-cloro-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.830 / 305
70	metilo	5-cloro-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.781 / 319
71	metilo	5-difluorometil-1-(pirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.011 / 330
72	H	5-difluorometil-1-(pirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.922 / 316
73	H	1-(pirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.847 / 266
74	metilo	1-(pirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.757 / 280
75	H	1-(pirazin-2-il)-5-(trifluoro-metil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.168 / 335
76	metilo	1-(pirazin-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.151 / 349
77	isopropilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.484 / 363
78	metilo	5-yodo-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.908 / 411
79	H	5-yodo-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.949 / 397
80	isopropilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2,083 / 327
81	H	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	Cl	Cl	H	3.021 / 389
82	H	5-difluorometil-1-(tiofeni-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.176 / 321
83	metilo	5-difluorometil-1-(tiofeni-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.099 / 335
84	H	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	Br	H	H	2.632 / 401
85	H	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	Br	H	H	2.249 / 365
86	H	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	Cl	H	Cl	2.676 / 353
87	H	5-difluorometil-1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.282 / 320
88	2,2-difluoroetilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.495 / 385
89	2,2-difluoroetilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.064 / 349
90	ciclo-propilmetilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.614 / 375
91	ciclo-propilmetilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.210 / 339
92	2-dimetil-aminoetilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.195 / 356
93	metoxicarbonilmetilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.336 / 393
94	metoxi-carbonilmetilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.905 / 357

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
95	metilo	5-difluorometil-1-(pirazin-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.785 / 331
96	H	5-metil-1-(pirazin-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.754 / 317
97	metilo	1-(3-nitropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.192 / 393
98	H	1-(6-metil-5-nitropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.250 / 393
99	metilo	1-(6-metil-5-nitropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.812 / 407
100	H	5-metiltio-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.025 / 317
101	H	5-metanosulfonil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.876 / 349
102	metilo	5-metanosulfonil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.985 / 363
103	metilo	5-metiltio-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.915 / 331
104	H	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	Br	2.356 / 365
105	metilo	5-pentafluoroetil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.490 / 403
106	H	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	O Me	2.093 / 351
107	2-dimetil-aminoetilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.757 / 392
108	metilo	5-difluorometil-1-(5-isopropil-4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.788 / 376
109	metilo	5-difluorometil-1-(5-ciclopropil-4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.703 / 374
110	2-fluoroetilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.361 / 367
111	H	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	Br	2.777 / 401
112	Ciclopropilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.252 / 361
113	Ciclopropilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.904/ 325
114	H	5-difluorometil-1-(5-isopropil-4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.820 / 362
115	H	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	Cl	H	H	2.106 / 319
116	2,2,2-trifluoroetilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.788 / 403
117	2,2,2-trifluoroetilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.411 / 367
118	2-fluoroetilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.917 / 331
119	H	5-metil-1-(3-nitropirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.769 / 325

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
120	metilo	5-difluorometil-1-(pirimidin-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.609 / 331
121	H	5-difluorometil-1-(3-nitropirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.944 / 361
122	metilo	5-difluorometil-1-(3-nitropirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.941 / 375
123	H	1-(5-nitropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.334 / 379
124	metilo	1-(5-nitropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.472 / 393
125	metilo	5-metil-1-(3-nitropirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.624 / 339
126	carbamoil-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.363 / 342
127	H	5-difluorometil-1-(5-ciclopropil-4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.676 / 360
128	metilo	5-difluorometil-1-(4-ciclopropil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.557 / 360
129	metilo	1-(2-nitrofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.428 / 392
130	H	5-difluorometil-1-(pyrimid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.612 / 317
131	H	5-difluorometil-1-(5-metil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.824 / 337
132	metilo	5-difluorometil-1-(5-metil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.889 / 351
133	H	5-difluorometil-1-(5-nitropirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.181 / 361
134	metilo	5-difluorometil-1-(5-nitropirid-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.356 / 375
135	metilo	5-dimetilcarbamoil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.627 / 356
136	metilo	5-(etilmetilcarbamoil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.852 / 370
137	metilo	5-(metilfenilcarbamoil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.304 / 418
138	metilo	5-diclorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.255 / 367
139	H	4-etoxicarbonil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-5-ilo	H	H	H	2.318 / 343
140	H	4-hidroxicarbonil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-5-ilo	H	H	H	1.800 / 315
141	H	5-difluorometil-1-(4,5-dimetil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.399 / 334
142	H	1-(4-ciclopropil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)-5-(difluorometil)-pirazol-4-ilo	H	H	H	1.586 / 346
143	metilo	5-difluorometil-1-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.513 / 267

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
144	metilo	5-difluorometil-1-(4,5-dimetil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.400 / 348
145	metilo	5-difluorometil-1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.237 / 334
146	H	1-(4-etil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)-5-(difluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.486 / 334
147	metilo	1-(4-etil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)-5-(difluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.487 / 348
148	H	5-difluorometil-1-(4-isopropil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.640 / 348
149	H	5-difluorometil-1-(4-fenil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.910 / 382
150	H	5-difluorometil-1-(5-etil-4-metil)-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.569 / 348
151	H	5-difluorometil-1-(4-metil)-5-trifluorometil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.006 / 388
152	H	3-metil-1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.522 / 284
153	H	1-(4,5-dimetil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.292 / 298
154	H	1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.444 / 338
155	H	5-metil-1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.170 / 284
156	metilo	5-difluorometil-1-(4-isopropil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.633 / 362
157	metilo	5-difluorometil-1-(4-fenil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.933 / 396
158	metilo	5-difluorometil-1-(4-metil-5-trifluorometil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.033 / 402
159	metilo	3-metil-1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.399 / 298
160	metilo	1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.467 / 352
161	metilo	5-metil-1-(5-metil-4H-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.725 / 315
162	metilo	5-metil-1-(4-metil-4H-[1,2,4]triazol-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.148 / 298
163	metilo	5-(clorofluorometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.233 / 351

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
164	metilo	5-(1,1-difluoroetil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.232 / 349
165	metilo	5-(bromodifluorometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.384 / 415
166	H	5-ciano-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.953 / 296
167	H	5-(clorofluorometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.240 / 337
168	H	5-(1,1-difluoroetil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.125 / 335
169	H	5-(bromodifluorometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.361 / 401
170	metilo	5-(difluorofenilmetil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.723 / 411
171	H	5-(difluorofenilmetil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.562 / 397
172	metilo	5-ciano-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.919 / 310
173	H	1-isobutil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.996 / 259
174	metilo	1-isobutil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.934 / 273
175	etilo	1-isobutil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.093 / 287
176	Ciclopropilo	1-isobutil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.162 / 299
177	Ciclopropilmetilo	1-isobutil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.381 / 313
178	H	1-(2-metoxietil)-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.482 / 261
179	Metilo	1-(2-metoxietil)-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.410 / 275
180	H	5-difluorometil-1-(2-metoxietil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.728 / 297
181	metilo	5-difluorometil-1-(2-metoxietil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.642 / 311
182	alilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.983 / 325
183	H	1-(3-nitropirid-2-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.153 / 379
184	H	1-(2-nitrofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.410 / 378
185	H	5-metil-1-(5-fenil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.634 / 363
186	H	1-(3-nitrofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.415 / 378
187	metilo	1-(3-nitrofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.508 / 392
188	H	5-difluorometil-1-(pirid-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.708 / 316
189	H	1-(pirid-3-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.805 / 334

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^U	R ^W	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
190	metilo	1-(pirid-3-il)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.855 / 348
191	metilo	5-difluorometil-1-(pirid-3-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.612 / 330
192	etilo	1-(4-nitrofenil)-5-(trifluorometil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.673 / 406
193	furan-2-ilmetilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.247 / 365
194	tetrahidro-furan-3-il-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.872 / 369
195	metilo	5-(1-fluoroetil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.055 / 331
196	H	5-(1-fluoroetil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.134 / 317
197	metilo	5-(clorodifluorometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.334 / 369
198	H	3-metil-1-(5-metil-tiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.271 / 300
199	metilo	3-metil-1-(5-metil-tiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.148 / 314
200	dimetil-carbamoilmetilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.025 / 406
201	H	5-difluorometil-1-isobutilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.365 / 295
202	metilo	5-difluorometil-1-isobutilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.294 / 309
203	dimetilcarbamoilm etilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.670 / 370
204	H	1-(2-metoxietil)-3-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.538 / 261
205	metilo	1-(2-metoxietil)-3-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.443 / 275
206	metilo	5-difluorometil-1-etilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.824 / 281
207	H	5-difluorometil-1-etilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.943 / 267
208	H	5-metanosulfonil-1-(2,2,2-trifluoro-etil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.702 / 333
209	metilo	5-metanosulfonil-1-(2,2,2-trifluoro-etil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.664 / 347
210	metilo	5-bromo-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.840 / 365
211	bencilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.428 / 375
212	(5-metilo-furan-2-il)metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.460 / 379
213	ciclopentil-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.570 / 367
214	H	1-alil-5-difluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.952 / 279
215	metilo	1-alil-5-difluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.865 / 293

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
216	metilo	5-metil-1-(5-fenil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.622 / 379
217	tetrahidrofuran-2-il-metilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-y	H	H	H	2.362 / 405
218	metilo	3-metil-1-vinilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.494 / 243
219	etilo	1-(4-trifluorometoxifenil)-5-trifluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	3.266 / 445
220	metilo	5-difluorometil-1-(5-metiltiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.441 350
221	H	1-etil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.536 / 231
222	metilo	1-etil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.441 / 245
223	H	5-difluorometil-1-propilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.285 / 281
224	metilo	5-difluoroetil-1-propilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.050 / 295
225	H	1-ciclopropilmetil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.813 / 257
226	metilo	1-ciclopropilmetil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.730 / 271
227	H	1-ciclopropilmetil-5-difluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.207 / 293
228	metilo	1-ciclopropilmetil-5-difluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.128 / 307
229	H	1-alil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.727 / 243
230	metilo	1-alil-5-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.641 / 257
231	tiofeni-3-il-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.349 / 381
232	furan-3-il-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.173 / 365
233	tiofeni-2-il-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.436 / 381
234	tiofeni-3-il-metilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.856 / 417
235	H	5-difluorometil-1-(5-metiltiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.316 / 336
236	H	5-difluorometil-1-(1-metil-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.609 / 334
237	metilo	5-difluorometil-1-(1-metil-1H-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.471 / 348
238	H	5-difluorometil-1-(5-fenil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.647 / 399
239	isopropilo	1-(4-trifluorometoxifenil)-5-trifluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	3.395 / 459
240	ciclopropil-metilo	1-(4-trifluorometoxifenil)-5-trifluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	3.273 / 471
241	H	5-metil-1-(1-metil-1H-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.337 / 298
242	pirid-2-il-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.746 / 376
243	2-nitro-fenil-sulfonilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	3.117 / 470
244	(1-metilo-pirazol-4-il)metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.844 / 379
245	(1-metilo-imidazol-2-il)metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.514 / 379

ES 2 546 404 T3

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
246	tiofeni-2-il-metilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.695 / 417
247	metilo	5-metil-1-(1-metil-1 H-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.287 / 312
248	H	5-difluorometil-1-(1-fenil-1H-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.248 / 396
249	metilo	5-difluorometil-1-(1-fenil-1 H-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.244 / 410
250	H	5-difluorometil-1-(1H-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.487 / 320
251	metilo	5-difluorometil-1-(1 H-[1,2,3]triazol-4-ilmetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.434 / 334
252	H	5-difluorometil-1-(5-trifluorometil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.434 / 391
253	metilo	5-difluorometil-1-(5-trifluorometil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.683 / 405
254	pirid-2-il-metilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.986 / 412
255	pirid-3-il-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.430 / 376
256	pirid-3-il-metilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.767 / 412
257	isopropilo	1-(4-nitrofenil)-5-trifluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.946 / 420
258	ciclopropil-metilo	1-(4-nitrofenil)-5-trifluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	3.065 / 432
259	H	5-difluorometil-1-(5-fenil-[1,3,4]oxadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.450 / 383
260	H	1-piridin-2-il-5-trifluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.116 / 334
261	metilo	1-piridin-2-il-5-trifluorometilpirazol-4-ilo	H	H	H	2.228 / 348
262	H	5-metil-1-(5-trifluorometil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.418 / 355
263	metilo	5-metil-1-(5-trifluorometil-[1,3,4]tiadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.431 / 369
264	metilo	5-difluorometil-1-(5-fenil-[1,3,4]oxadiazol-2-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.442 / 397
265	Dimetiltiocarbamoil metilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.378 / 422
266	Dimetiltiocarbamoil metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.997 / 386
267	5,5-dimetil-tetrahidro-furan-2-il-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.400 / 397

Ej. #	R ¹	A	R ¹	R ^u	R ^w	Datos físicoquímicos: r.t. [min] / m/z*
268	tetrahidrofuran-3-il-metil	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.896 / 369
269	metil	5-ciclopropil-1-metilpirazol-4-ilo	H	H	H	1.558 / 257
270	metil	5-ciclopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.862 / 325
271	H	5-etil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.020 / 299
272	H	5-ciclopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.952 / 311
273	H	5-(clorodifluorometil)-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.357 / 443
274	metil	5-difluorometil-1-(pirid-4-il)pirazol-4-ilo	H	H	H	1.327 / 355
275	(1-fenil-pirazol-4-il)metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.648 / 330
276	(1-fenil-pirazol-4-il)metilo	5-difluorometil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.831 / 441
277	(1-metil)-pirrol-2-il)-metilo	5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)pirazol-4-ilo	H	H	H	2.359 / 477

r.t. = tiempo de retención de HPLC

II. Evaluación de la actividad pesticida:

II.1 Áfido del algodón (*Aphis gossypii*, etapas de vida mixtas)

5 Método a)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 (vol: vol) de acetona:agua y 100 ppm de surfactante Kinetica™.

10 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledones (una planta por maceta) se infestaron mediante la colocación de una hoja muy infestada de la colonia principal en la parte superior de cada cotiledón. A los áfidos, durante la noche, se les permitió transferirse a la planta anfitriona, y se retiró la hoja usada para transferir los áfidos. Los cotiledones se sumergieron en la solución de prueba y se dejaron secar. Después de 5 días, se realizaron los recuentos de mortalidad.

En esta prueba, los compuestos 2, 3, 4, 5 y 7, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 90% en comparación con los controles no tratados.

Método b)

15 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,0000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1.3 ml. Estos tubos se insertaron en un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las que se hicieron diluciones más bajas en 50% de acetona: 50% de agua (v/v). Se incluyó un agente surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

20 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 les permitió a los áfidos transferirse durante la noche para lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta y se retiró la hoja anfitriona. Las plantas infestadas se asperjaron mediante un pulverizador electrostático de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas fueron secadas en la campana aspersora de humos, retiradas del aspersor, y luego mantenidas en una cámara de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24-hr a 25 °C y humedad relativa del 20-40%. La mortalidad de los

25

ES 2 546 404 T3

áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas de control no tratadas, fue determinada después de 5 días.

5 En esta prueba, los compuestos 1, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 17, 18, 19, 25, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 35, 36, 39, 40, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 56, 59, 61, 64, 65, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 74, 76, 77, 78, 80, 88, 89, 90, 92, 93, 94, 95, 97, 99, 100, 102, 103, 106, 108, 109, 110, 112, 113, 116, 117, 118, 120, 122, 123, 124, 125, 126, 129, 130, 132, 134, 138, 143, 151, 158, 161, 164, 165, 166, 167, 168, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 184, 186, 187, 189, 190, 192, 193, 194, 196, 197, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 215, 218, 219, 220, 221, 222, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 239, 240 y 242, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

10 II.2 Áfido verde de melocotón (*Myzus persicae*, etapas de vida mixtas)

Método a)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 (vol: vol) de acetona: agua y 100 ppm de surfactante Kinetica™.

15 Plantas de pimienta en la etapa de segundo par de hojas (variedad 'California Wonder') se infestaron con aproximadamente 40 áfidos criados en laboratorio colocando secciones de hojas infestadas en la parte superior de las plantas de prueba. Las secciones de hojas se retiraron después de 24 horas. Las hojas de las plantas intactas fueron sumergidas en soluciones de gradiente del compuesto de prueba y se dejaron secar. Las plantas de prueba se mantuvieron bajo luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) aproximadamente a 25 °C y humedad relativa 20-40%. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas de verificación, se determinó después de 5 días.

20 En esta prueba, los compuestos 2, 3, 4, 5 y 7, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 90% en comparación con los controles no tratados.

Método b)

25 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,0000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1.3 ml. Estos tubos se insertaron en un pulverizador electrostático automatizado, equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las que se hicieron diluciones más bajas en 50% de acetona:50% de agua (v/v). Se incluyó un agente surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

30 Plantas de pimiento en la etapa de primera hoja verdadera fuerin infestadas antes del tratamiento mediante la colocación de hojas muy infestadas de la colonia principal en la parte superior de las plantas de tratamiento. Se les permite a los áfidos transferirse durante la noche para lograr una infestación de 30-50 áfidos por planta y las hojas anfitrionas fueron retiradas. Las plantas infestadas se asperjaron entonces mediante un aspersor de plantas electrostático automatizado equipad con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas fueron secadas en la campana aspersora de humos, se removieron, y luego se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24-hr a 25 °C y humedad relativa del 20-40%. La mortalidad de los
35 áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas de control no tratadas, fue determinada después de 5 días.

40 En esta prueba, los compuestos 1, 3, 4, 6, 7, 8, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 24, 25, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 39, 40, 41, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 51, 52, 53, 54, 56, 61, 64, 65, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 74, 76, 77, 78, 79, 80, 88, 89, 90, 91, 93, 94, 95, 97, 98, 99, 100, 102, 103, 105, 106, 108, 109, 110, 112, 114, 116, 117, 118, 120, 122, 123, 124, 125, 127, 129, 131, 132, 134, 136, 138, 143, 150, 151, 153, 158, 161, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 171, 172, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 184, 186, 187, 189, 190, 191, 192, 193, 196, 197, 203, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 215, 218, 219, 220, 221, 222, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 237, 239, 240 y 242, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

45 II.3 Áfido del caupí (*Aphis craccivora*)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 (vol: vol) de acetona:agua. La solución de prueba se preparó en el día de uso.

Plantas caupí en maceta, colonizadas con 100 - 150 áfidos de diversas etapas se asperjaron después de que la población de la plaga había sido registrada. La reducción de la población se valoró después de 24, 72 y 120 horas.

50 En esta prueba, los compuestos 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 11, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 56, 59, 61, 64, 65, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 74, 76, 77, 78, 79, 80, 88, 89, 90, 91, 93, 94, 95, 97, 99, 100, 101, 103, 105, 109, 110, 112, 113, 114,

115, 116, 117, 118, 119, 120, 122, 123, 124, 125, 126, 138, 150, 151, 158, 161, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 172, 175, 176, 177, 178, 179, 181, 192, 195, 196, 197, 201, 202, 203 y 205, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 90% en comparación con los controles no tratados.

II.4 Mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia argentifolii*, adulto)

5 Método a)

Los compuestos activos se formularon en 50:50 (vol: vol) de acetona:agua y 100 ppm de surfactante Kinetica™.

10 Plantas de algodón seleccionadas se hicieron crecer hasta el estado de cotiledón (una planta por maceta). Los cotiledones se sumergieron en la solución de prueba para proveer cobertura completa del follaje y se colocan en un área bien ventilada para secar. Cada maceta con plántulas tratadas se colocó en una taza de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (de aproximadamente 3-5 días de edad). Los insectos se recolectaron utilizando una aspirador y una tubería Tygon® no tóxica de 0.6 cm, (R-3603) conectada a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recolectados, se insertó entonces suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, permitiendo que los insectos se arrastraran de la punta para alcanzar el follaje para alimentarse. Las tazas se cubrieron con una tapa de malla reutilizable (pantalla PeCap de malla de poliéster de 150 micrones de Tetko Inc). Las plantas de prueba se mantuvieron en la sala de conservación aproximadamente a 25 °C y humedad relativa del 20-40% durante 3 días evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para prevenir la captura de calor dentro de la taza. Se evaluó la mortalidad 3 días después del tratamiento de las plantas.

20 En esta prueba, los compuestos 3, 5 y 7, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 90% en comparación con los controles no tratados.

Método b)

25 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,000 ppm suministrada en tubos ABgene® de 1.3 ml. Estos tubos se insertaron en un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las que se hicieron diluciones más bajas en 50% de acetona:50% de agua (v/v). Se incluyó un agente surfactante no iónico (Kinetico®) en la solución a un volumen de 0.01% (v / v).

30 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón (una planta por maceta) se asperjaron mediante una planta aspersora electrostática automatizada equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas fueron secadas en la campana aspersora de humos y luego se retiraron del pulverizador. Cada maceta se colocó en una taza de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (de aproximadamente 3-5 días de edad). Los insectos se recogieron utilizando una aspiradora y tubería de Tygon® no tóxica de 0.6 cm, (R-3603) conectada a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recolectados, se inserta entonces suavemente en el suelo que contiene la planta tratada, permitiendo que los insectos se arrastren de la punta para alcanzar el follaje para alimentarse. Las tazas estaban cubiertas con una tapa de malla reutilizable (pantalla PeCap de malla de poliéster de 150 micrones de Tetko Inc). Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a 25 °C y humedad relativa del 20-40% durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para prevenir la captura de calor dentro de la taza. Se evaluó la mortalidad 3 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control no tratadas.

40 En esta prueba, los compuestos 8, 27, 28, 30, 31, 32, 36, 43, 48, 49, 50, 51, 52, 64, 65, 67, 68, 77, 80, 88, 89, 90, 91, 92; 94, 97, 98, 99, 105, 106, 110, 112, 113, 116, 117, 118, 122, 123, 124, 125, 126, 129, 136, 138, 158, 162, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 184, 186, 187, 192, 193, 201, 202, 203, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 219, 222, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 231, 232, 233, 234, 237, 239, 240 y 242, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

45 II.5 Áfido del algarrobo (*Megoura viciae*)

Los compuestos activos fueron formulados en 1:3 (vol:vol) de DMSO:agua con diferentes concentraciones de compuestos formulados.

50 Se colocaron discos de hojas de frijol en placas de microtitulación llenadas con agar-agar al 0.8% y 2.5 ppm de OPUS™. Los discos de hojas se asperjaron con 2.5 µl de la solución de prueba y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en las placas de microtitulación que estaban entonces cerradas y mantenidas a 23 ± 1 °C y una humedad relativa del 50 ± 5% bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se estableció sobre la base de vitales, áfidos reproducidos. La mortalidad y la fecundidad del áfido se establecieron entonces visualmente.

ES 2 546 404 T3

En esta prueba, los compuestos 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 11, 13, 14, 15, 20, 21, 23, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 57, 59, 61, 64, 65, 67, 68, 69, 70, 71, 77, 78, 79, 80, 90, 91, 93, 94, 95, 97, 98, 99, 100, 102, 103, 105, 106, 110, 114, 115, 118, 119, 122, 138, 151, 158, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 175, 177, 179, 181, 192, 195, 196, 197, 204, 209, 210 y 212, respectivamente a una

5

11.6 Gorgojo (*Anthonomus grandis*)

Los compuestos se formularon en 75:25 (vol:vol) de agua:DMSO.

Para evaluar el control del gorgojo (*Anthonomus grandis*) la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pozos que contenían una dieta de insectos y 20-30 huevos de *A. grandis*. Diferentes concentraciones de los compuestos formulados se asperjaron sobre la dieta de insectos en 20 μ l, usando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a 23 ± 1 °C y humedad relativa de $50 \pm 5\%$ durante 5 días. La mortalidad de los huevos y las larvas se estableció entonces visualmente.

10

En esta prueba, los compuestos 1, 3, 7, 8, 11, 13, 14, 15, 20, 21, 23, 27, 30, 32, 36, 40, 41, 43, 44, 45, 48, 49, 51, 52, 54, 61, 64, 65, 66, 72, 78, 79, 90, 96, 97, 98, 99, 105, 106, 110, 137, 138, 165, 167, 169, 192, 196 y 197, respectivamente a una concentración de la solución de prueba de 2500 mg/L mostraron una mortalidad de al menos 50%.

15

11.7 Actividad contra la Mosca mediterránea de la fruta (*Ceratitis capitata*)

Los compuestos activos se formularon en 1:3 (vol: vol) de DMSO:agua.

Para evaluar el control de la mosca mediterránea de la fruta la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contenían una dieta de insectos y 50 a 80 huevos de *C. capitata*. Diferentes concentraciones de los compuestos formulados se asperjaron sobre la dieta de insectos en 5 μ l, usando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a 28 ± 1 °C y humedad relativa $80 \pm 5\%$ durante 5 días. La mortalidad de los huevos y las larvas se estableció entonces visualmente.

20

25

En esta prueba los huevos que habían sido tratadas con 2500 ppm de compuesto 4, 7, 11, 13, 20, 21, 22, 31, 80 y 212, respectivamente mostraron una mortalidad de al menos 50% en comparación con los controles no tratados.

II.8 Actividad contra el Gusano del cogollo del tabaco (*Heliothis virescens*) I

Para evaluar el control de Gusano del cogollo del tabaco (*Heliothis virescens*) la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían una dieta de insectos y de 15-25 huevos de *H. virescens*. Los compuestos se formularon utilizando una solución que contenía 75% v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Diferentes concentraciones de los compuestos formulados se asperjaron sobre la dieta de insectos en 10 μ l, usando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente $28 + 1$ °C y humedad relativa de aproximadamente $80 + 5\%$ durante 5 días. La mortalidad de los huevos y las larvas se estableció entonces visualmente.

30

35

En esta prueba, los compuestos 11, 13, 23, 30, 40, 44, 45, 48, 51, 53, 71, 98, 99, 106, 169, 192 y 196 a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 50% en las comparación con los controles no tratados.

II.9 Actividad contra el áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*)

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

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contiene 75% v / v de agua y 25% v / v de DMSO. Diferentes concentraciones de compuestos formulados se pipetearon en la dieta de áfidos, usando una pipeta hecha a la medida, a las dos repeticiones. Después de la aplicación, de 5 a 8 áfidos adultos fueron colocados en la membrana artificial en el interior de los pocillos de la placa de microtitulación. Se deja que los áfidos chupen de la dieta de áfidos tratada y se incubaron a aproximadamente $23 + 1$ °C y humedad relativa de aproximadamente $50 + 5\%$ durante 3 días. A continuación, la mortalidad y la fecundidad del áfido se evaluaron visualmente.

40

45

En esta prueba, los compuestos 1, 2, 3, 4, 5, 7, 8, 11, 13, 14, 20, 23, 24, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 37, 38, 39, 41, 43, 44, 45, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 59, 64, 65, 67, 68, 69, 70, 71, 76, 77, 78, 79, 80, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 103, 104, 105, 106, 109, 110, 112, 113, 114, 115, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 138,

50

ES 2 546 404 T3

149, 150, 151, 158, 161, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 172, 175, 176, 177, 179, 181, 192, 195, 196 y 197, respectivamente, a 2500 ppm mostraron 100 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

II. 10 Actividad contra el saltamontes marrón (*Nilaparvata lugens*)

5 Los compuestos activos se formularon como una solución de agua:acetona 50:50 (vol vol). Se agregó surfactante (Alkamuls EL 620) a razón de 0.1% (vol/vol). Las plántulas de arroz se limpiaron y se lavaron 24 h antes de la aspersión. Las plántulas de arroz en maceta se asperjaron con 5 ml de la solución de prueba, se secaron al aire, se colocaron en jaulas y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a 28-29 °C y humedad relativa del 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

10 En esta prueba, los compuestos 5, 35, 36, 69, y 118, respectivamente, a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 50% en comparación con los controles no tratados.

II.11 Actividad contra tisanópteros de Vanda/Orquídea (*Dichromothrips corbetti*)

15 Los compuestos activos se formularon como una solución de agua:acetona 50:50 (vol:vol). Se agregó surfactante (Alkamuls EL 620) a razón de 0.1% (vol/vol). Se limpiaron los pétalos de orquídeas Panda, se lavaron y se secaron al aire antes de la aspersión. Los pétalos se sumergieron en la solución de prueba durante 3 segundos, se secaron al aire, se colocaron dentro de un plástico resellable y se inocularon con 20 adultos. Los pétalos tratados se mantuvieron dentro de la sala de conservación a 28-29 °C y humedad relativa del 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

20 En esta prueba, los compuestos 1, 23, 32, 36, 39, 44, 64, 65, 65, 69, 71, 78, 89, 91, 110, 118, 178 y 190, respectivamente, a 500 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 50% en comparación con los controles no tratados.

II. 12 La actividad en pruebas hidropónicas contra áfidos verdes del melocotón (*Myzus persicae*)

25 Plantas de pimiento verde (*Capsicum annuum* L., variedad California Wonder) se cultivan en el invernadero desde la semilla hasta la etapa de segunda hoja verdadera (BBCH 12) en Metro-Mix® 360 de Scott (1-2 plantas por maceta cuadrada de 2 ¼"). Las hojas de cotiledón se retiran y las raíces se enjuagan en agua del grifo hasta que quede libre de suelo. Las raíces se mantienen húmedas bajo una capa de toalla de papel húmeda hasta que se han preparado todas las plantas.

30 Una solución de reserva de 3400 ppm se prepara de cada compuesto de prueba usando acetona de grado reactivo como solvente. Diluciones subsecuentes de 100 y 10 ppm se preparan a partir de estas reservas con estas diluciones finales en agua desionizada en botellas de vidrio ámbar de 100 ml. Se coloca en cada botella una planta a raíz desnuda usando una sección de tapón de espuma para asegurar el centro del tallo en el cuello de botella. Las raíces desnudas están totalmente inmersas en las suspensiones de prueba. Las plantas anfitrionas se colocan en una habitación de crecimiento de las plantas bajo iluminación fluorescente GroLux® continua (40W), durante 24 horas a 25 ± 2 °C y 20-40% de humedad relativa.

35 Después de la exposición de las raíces desnudas a las suspensiones de prueba, pedazos de plantas de pimiento infestadas con áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*) se colocan en la parte superior del follaje de prueba. Se les permite a los insectos transferirse de las hojas anfitrionas para llevar a cabo una infestación de 40-50 insectos por planta. Se deja que el ensayo se ejecute durante 3 días en la misma cámara de crecimiento tal como se utilizó previamente. Las evaluaciones incluyen estimaciones de reducción de la densidad de población de áfidos con relación a la densidad promedio de áfidos en las plantas de control no tratadas. Las respuestas fitotóxicas de las plantas anfitrionas también se registran en este momento.

40 En esta prueba, los compuestos 2, 3, 6, 17, 27, 28, 29, 33, 35, 36, 39, 45, 46, 47, 48, 50, 53, 56, 64, 65, 67, 69, 70, 71, 88, 89, 90, 91, 93, 94, 99, 100, 110, 118 y 123, respectivamente, a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

II.13 Actividad en las pruebas hidropónicas contra áfidos de algodón (*Aphis gossypii*)

45 Las plantas de algodón (*Gossypium hirsutum*, variedad "Sure Grow 747") se cultivan en el invernadero desde la semilla hasta la segunda etapa de hoja verdadera (BBCH 12) en Metro-Mix® 360 de Scott (1-2 plantas por maceta cuadrada de 2 ¼"). Las hojas de cotiledón se eliminan y las raíces se enjuagan en agua del grifo hasta que quede libre de suelo. Las raíces se mantienen húmedas bajo una capa de toalla de papel húmeda hasta que se han preparado todas las plantas.

50 Una solución de reserva de 3400 ppm se prepara de cada compuesto de prueba usando acetona de grado reactivo como solvente. Se preparan diluciones subsecuentes de 100 y 10 ppm se preparan a partir de esta reserva con diluciones finales en agua desionizada en botellas de vidrio ámbar de 100 ml. Se coloca en cada botella una planta a

ES 2 546 404 T3

raíz desnuda usando una sección de tapón de espuma para asegurar el centro del tallo en el cuello de botella. Las raíces desnudas están totalmente inmersas en las suspensiones de prueba. Las plantas anfitrionas se colocan en una habitación de crecimiento de plantas bajo iluminación fluorescente GroLux® continua (40W), durante 24 horas a 25 ± 2 °C y 20-40% de humedad relativa.

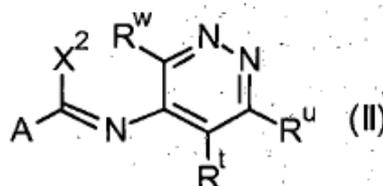
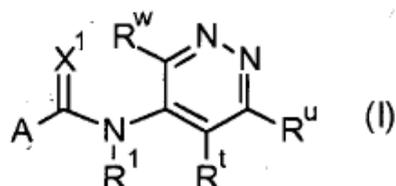
- 5 Después de la exposición de las raíces desnudas a las suspensiones de ensayo, pedazos de plantas de algodón infestadas con áfidos del algodón (*Aphis gossypii*) se colocan en la parte superior del follaje de prueba. Se les permite a los insectos transferirse de las hojas anfitrionas para llevar a cabo una infestación de 40-50 insectos por planta. Se deja que el ensayo se ejecute durante 3 días en la misma cámara de crecimiento tal como se utilizó anteriormente. Las evaluaciones incluyen estimaciones de reducción de la densidad de población de áfidos con relación a la densidad promedio de áfidos en las plantas de control no tratadas. Las respuestas fitotóxicas de las plantas anfitrionas también se registran en este momento.
- 10

En esta prueba, los compuestos 2, 4, 17, 29, 33, 45, 46, 47, 48, 50, 53, 56, 64, 65, 67, 69, 71, 77, 88, 89, 90, 91, 93, 94, 99, 100, 110, 118, 123 y 124, respectivamente, a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

15

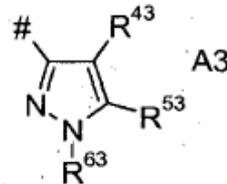
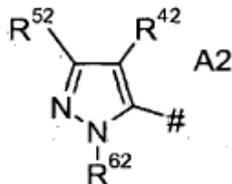
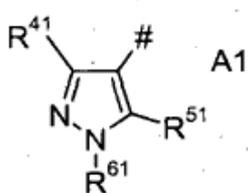
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de pirazol de las fórmulas I o II y las sales y N-óxidos de los mismos,



5 en donde

A es un radical pirazol de fórmulas A1, A2 o A3, en donde



denota el sitio de enlazamiento al resto de las fórmulas I o II, y en donde R^{41} , R^{42} , R^{43} y

R^{51} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -alquilo, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alquenilo y $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alquinilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, o en donde R^{41} , R^{42} , R^{43} y R^{51} son seleccionados además de OR^a , SR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , S(O)R^d , $\text{S(O)}_2\text{R}^d$, NR^eR^f , $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, heterociclilo, hetarilo, $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -cicloalquilo, $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -cicloalquenilo y fenilo, en donde los cinco últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de los radicales R^y y R^x , y en donde R^{52} , R^{53} son seleccionados de hidrógeno, halógeno, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -alquilo, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alquenilo y $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alquinilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, o en donde R^{52} , R^{53} son seleccionados además de OR^a , SR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , S(O)R^d , $\text{S(O)}_2\text{R}^d$, NR^eR^f , $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, heterociclilo, hetarilo, $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -cicloalquilo, $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -cicloalquenilo y fenilo, en donde los cinco últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de los radicales R^y y R^x , y en donde R^{61} , R^{62} , R^{63} son seleccionados de hidrógeno, CN, NO_2 , $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -alquilo, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alquenilo y $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alkynyl en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes R^x idénticos o diferentes, o en donde R^{61} , R^{62} , R^{63} son seleccionados además de OR^a , SR^a , C(Y)R^b , C(Y)OR^c , S(O)R^d , $\text{S(O)}_2\text{R}^d$, NR^eR^f , $\text{C(Y)NR}^g\text{R}^h$, $\text{S(O)}_m\text{NR}^e\text{R}^f$, $\text{C(Y)NR}^i\text{NR}^e\text{R}^f$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-OR}^a$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-CN}$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-C(Y)R}^b$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-C(Y)OR}^c$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-NR}^e\text{R}^f$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-C(Y)NR}^g\text{R}^h$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-S(O)}_m\text{R}^d$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-S(O)}_m\text{NR}^e\text{R}^f$, $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilen-NR}^i\text{NR}^e\text{R}^f$, heterociclilo, hetarilo, $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -cicloalquilo, $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -cicloalquenilo, heterociclilo- $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilo}$, hetarilo- $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilo}$, $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -cicloalquil- $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilo}$, $\text{C}_5\text{-C}_{10}$ -cicloalquenilo- $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilo}$, fenil- $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-alquilo}$ y fenilo, en donde los anillos de los diez últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R^y idénticos o diferentes,

m es 0, 1 o 2;

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

X^1 es S, O o NR^{1a} , en donde R^{1a} es seleccionado de hidrógeno, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -alquilo, $\text{C}_1\text{-C}_4$ -haloalquilo, $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -cicloalquilo, $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -cicloalquilmetilo, $\text{C}_3\text{-C}_{10}$ -halocicloalquilo, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alquenilo, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -haloalquenilo, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ -alquinilo, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ -alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, OR^a , heterociclilo, heterociclilo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, fenilo, hetarilo, fenil- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo y hetarilo- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -

alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, o 4 sustituyentes que independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

5 X² es OR^{2a}, NR^{2b}R^{2c}, S(O)_mR^{2d}, en donde R^{2a} es seleccionado de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, o 4 sustituyentes que independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde R^{2b}, R^{2c} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilocarbonilo, hetarilosulfonilo, heterociclilo, heterociclicarbonilo, heterociclicosulfonilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, donde el anillo en los últimos doce radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes los que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, o R^{2b} y R^{2c} junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un heterociclo saturado o insaturado de 5- o 6 miembros, que puede llevar un átomo adicional seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde R^{2d} es seleccionado de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

15 R¹ es hidrógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₃-C₁₀-halocicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-haloalqueno, C₂-C₁₀-alquino, C₃-C₁₀-haloalquino, C₁-C₅-alquilen-CN, OR^a, C₁-C₅-alquilen-OR^a, C(Y)R^b, C₁-C₅-alquilen-C(Y)R^b, C(Y)OR^c, C₁-C₅-alquilen-C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, C₁-C₅-alquilen-NR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, C₁-C₅-alquilen-C(Y)NR^gR^h, S(O)_mNR^eR^f, C(Y)NRⁱNR^eR^f, C₁-C₅-alquilen-S(O)₂R^d, C₁-C₅-alquilen-S(O)_mNR^eR^f, C₁-C₅-alquilen-C(Y)NRⁱNR^eR^f, fenilo, heterociclilo, hetarilo, fenil-C₁-C₅-alquilo, C₃-C₁₀-cicloalquil-C₁-C₅-alquilo, heterociclilo-C₁-C₅-alquilo y hetarilo-C₁-C₅-alquilo en donde el anillo en los últimos siete radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de los radicales R^y y R^x;

Y es O o S;

35 R^a, R^b, R^c son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halo-cicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-, C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes los cuales, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

40 R^d es seleccionado de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

45 R^e, R^f son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, heterociclicarbonilo, heterociclilo-C₁-C₄-sulfonilo, fenilo, fenil-carbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilocarbonilo, hetarilosulfonilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, donde el anillo en los últimos doce radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes los que, independientemente uno de otro, son seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi; o

55 R^e y R^f junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un heterociclo saturado o insaturado de 5- o 6 miembros, que puede llevar un átomo adicional seleccionado de O, S y N **como un átomo miembro de anillo** y en donde el heterociclo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

- 5 R^g , R^h son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo en los últimos seis radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o sustituyentes los cuales son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 10 R_i es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo y fenilo-C₁-C₄-alquilo en donde el anillo fenilo en los últimos dos radicales mencionados puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que son independientemente uno de otro seleccionados de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 15 R^x son independientemente uno de otro seleccionados de ciano, nitro, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, S(O)_mR^d, S(O)_mNR^eR^f, C₁-C₁₀-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, 5- a 7-membered heterociclilo, hetarilo de 5- o 6- miembros, fenilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, 3- a 6-membered heterocicliooxi y fenoxi, en donde los 7 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales R^y; y en donde
- 20 R^y es seleccionado de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, S(O)_mR^d, S(O)_mNR^eR^f, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alcoxycarbonilo, C₁-C₄-haloalcoxycarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alkynilo y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo.
- 25 2. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 1, en donde el compuesto de pirazol es un compuesto de fórmula I.
3. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 2, en donde X¹ es oxígeno.
4. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 2 o 3, en donde R¹ es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, heterociclilo-C₁-C₄-alquilo y hetarilo-C₁-C₄-alquilo.
5. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde al menos dos de los radicales R^t, R^u o R^w son hidrógeno.
6. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 5, en donde los radicales R^t, R^u y R^w son hidrógeno.
- 30 7. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde A es un radical A1.
8. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 7, en donde R⁴¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi.
- 35 9. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 8, en donde R⁴¹ es hidrógeno.
10. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9, en donde R⁵¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde fenilo puede ser no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi.
- 40 11. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 10, en donde R⁵¹ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo, o de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo y C₃-C₆-cicloalquilo.
- 45 12. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 7 a 11, en donde R⁶¹ es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenado o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁶¹ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o
- 50

diferentes seleccionados de halógeno, NO₂, CN, C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

13. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 12, en donde R⁶¹ es hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo o C₁-C₄-alcoxi- C₂-C₄-alquilo.

5 14. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde A es un radical A2.

15. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 14, en donde R⁴² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁴² se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

16. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 14 o 15, en donde R⁵² es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁵² se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

17. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 14 a 16, en donde R⁶² es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁶² se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO₂, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

18. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde A es un radical A3.

19. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 18, en donde R⁴³ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los últimos 2 radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁴³ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

20. Los compuestos como se reivindican en la reivindicación 18 o 19, en donde R⁵³ es seleccionado de hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los últimos 2 radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁵³ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

21. Los compuestos como se reivindican en cualquiera de las reivindicaciones 18 a 20, en donde R⁶³ es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los dos últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, pueden ser parcial o totalmente halogenados o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R⁶³ se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, C₅-C₆-hetarilo y fenilo, en donde los tres últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, NO₂, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.
22. Un método para controlar plagas invertebradas cuyo método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su terreno de cría o una planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en el que las plagas están creciendo o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que van a ser protegidos de ataque o infestación de la plaga con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de pirazol de las fórmulas I o II o una sal o un N-óxido del mismo como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21.
23. Un método para proteger material de propagación de la planta y/o las plantas que crecen del mismo, cuyo método comprende tratar el material de propagación de la planta con una cantidad efectiva como plaguicida de un compuesto de las fórmulas I o II o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola o un N-óxido del mismo como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21.
24. Un compuesto de las fórmulas I o II o una sal aceptable desde el punto de vista veterinario o un N-óxido del mismo como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21 para tratar o proteger a un animal de infestación o infección por parásitos.
25. Una composición agrícola que contiene al menos un compuesto de las fórmulas I o II como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 21 y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola o un N-óxido del mismo y al menos un vehículo líquido o sólido.