

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 589 792**

51 Int. Cl.:

**C07D 403/12** (2006.01)

**A01N 43/58** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **23.03.2011 PCT/EP2011/054424**

87 Fecha y número de publicación internacional: **29.09.2011 WO11117286**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **23.03.2011 E 11709439 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.06.2016 EP 2550264**

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

30 Prioridad:

**23.03.2010 EP 10157418**

**23.03.2010 US 316441 P**

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

**16.11.2016**

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)**

**Carl-Bosch-Strasse 38**

**67056 Ludwigshafen am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**LE VEZOUET, RONAN;**

**SÖRGEL, SEBASTIAN;**

**DEFIEBER, CHRISTIAN;**

**GROSS, STEFFEN;**

**KÖRBER, KARSTEN;**

**VON DEYN, WOLFGANG;**

**ANSPAUGH, DOUGLAS D. y**

**CULBERTSON, DEBORAH L.**

74 Agente/Representante:

**CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel**

ES 2 589 792 T3

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

## DESCRIPCIÓN

Compuestos de piridazina para el control de plagas de invertebrados

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

Antecedentes de la invención

Las plagas de invertebrados en particular artrópodos y nematodos destruyen cultivos en crecimiento y cosechados y atacan viviendas y estructuras comerciales de madera, causando de ese modo grandes pérdidas económicas al suministro de alimentos y a la propiedad. Aunque se conocen un gran número de agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas diana para desarrollar resistencia a dichos agentes, existe la necesidad continua de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados tales como insectos, arácnidos y nematodos. Por lo tanto, es un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos que tienen una buena actividad plaguicida y que muestran un amplio espectro de actividad frente a un gran número de diversas plagas de invertebrados, especialmente frente a insectos, arácnidos y nematodos difíciles de controlar.

El documento de Patente WO 2003/106427 describe N-fenil o N-piridilcarboxamidas de ácidos pirrol o pirazol carboxílicos, que son útiles como insecticidas.

El documento de Patente WO 2002/094765 describe N-(heteril 6 miembros) carboxamidas de ácidos carboxílicos heteroaromáticos de 6 miembros, que portan un radical oxazolina o carboxamida en la posición orto. Se menciona que los compuestos son útiles como insecticidas.

El documento de Patente WO 2009/027393 describe N-(3-piridil)carboxamidas de ácidos carboxílicos sustituidos con pirazol, que son útiles como insecticidas.

El documento de Patente WO 2007/068375 describe derivados de N-hetarilamidas de fórmulas



donde A podría ser, entre otros, un radical piridilo o pirazinilo, R<sup>1</sup> podría ser, entre otros, hidrógeno, alquilo, haloalquilo, y similares, R<sup>8-A</sup>, R<sup>8-C</sup> y R<sup>8-D</sup>, podrían ser, entre otros, hidrógeno, halógeno, alquilo y trifluorometilo y R es un radical de fórmula -CH(Z<sup>1</sup>)-CH<sub>2</sub>-C(Z<sup>2</sup>)(Z<sup>3</sup>)-CH<sub>3</sub>, donde Z<sup>1</sup> y Z<sup>2</sup> son hidrógeno o metilo y Z<sup>3</sup> es metilo o etilo.

El documento de Patente EP 332579 desvela N-piridazinil carboxamidas fungicidamente activas de ácido 2,6-dihalógeno-4-piridinacarboxílico.

El documento de Patente EP 480258 desvela, entre otros, N-(4-cloro-6-metilpiridazin-3-il) 2-(mercaptoetil)-piridina-3-ilcarboxamida que es útil para combatir endoparásitos en animales de sangre caliente.

Heinisch *et al.*, J. Heterocyclic Chemistry 38, 2001, p. 125-130 y Heterocycles 51, 1999, 1035-1050 desvelan N-(3,6-dicloropiridazin-4-il)-3,6-dicloropiridazin-4-il carboxamida como compuesto intermedio en la preparación de neurolépticos tricíclicos.

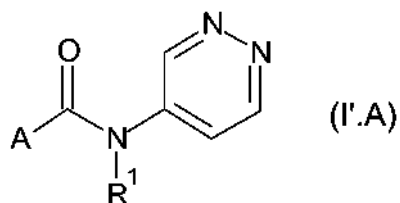
Sumario de la Invención

Es un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos que tengan una buena actividad plaguicida, en particular actividad insecticida, y muestren un amplio espectro de actividad frente a un gran número de plagas de invertebrados diferentes, especialmente frente a insectos. Los compuestos serían útiles para proteger plantas y

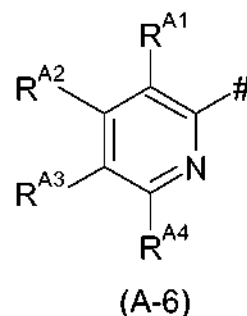
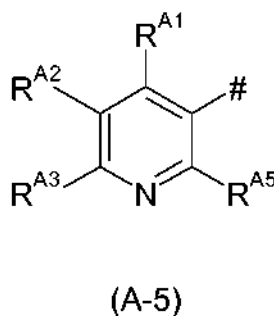
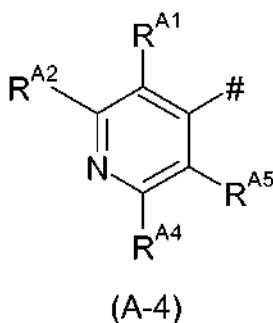
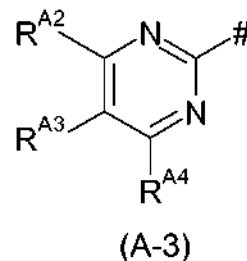
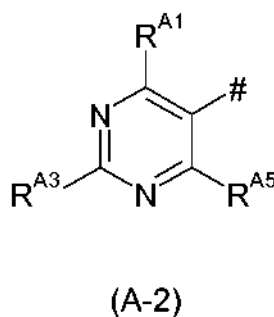
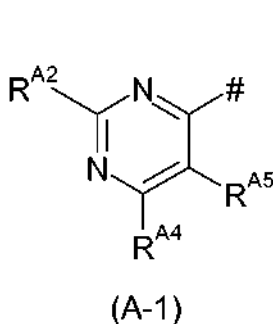
materiales de propagación de plantas de la infestación de plagas de invertebrados, en particular de insectos. En particular, los compuestos serían útiles para aplicación en agricultura.

5 Se ha descubierto que estos objetivos se pueden lograr mediante los compuestos de fórmula I'.A, que se describen a continuación, y mediante sus sales, sus N-óxidos y las sales de sus N-óxidos, en particular sus sales agrícolamente aceptables.

En un primer aspecto la presente invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula I'.A y las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos,



donde el radical A se selecciona entre los radicales de fórmulas A-1, A-2, A-3, A-4, A-5 y A-6:



10

en la que: # representa el punto de unión al resto de la fórmula I'.A, y en la que

15  $R^{A1}$ ,  $R^{A5}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-CN, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-OR<sup>a</sup>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y heterociclilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, en los que cicloalquilo y heterociclilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R<sup>y</sup> iguales o diferentes;

20  $R^{A2}$ ,  $R^{A4}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-CN, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-OR<sup>a</sup>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y heterociclilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, en los que cicloalquilo y heterociclilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R<sup>y</sup> iguales o diferentes;

- 5  $R^{A3}$  se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquileo  $C_1-C_3-CN$ , alquileo  $C_1-C_3-OR^a$ , cicloalquilo  $C_3-C_7$ , cicloalquil  $C_3-C_7$ -alquilo  $C_1-C_3$ , y heterocicilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo  $C_1-C_3$ , en los que cicloalquilo y heterocicilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes  $R^y$  iguales o diferentes;
- $R^1$  se selecciona entre hidrógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$  y alcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_2$ ;
- $R^a$  se selecciona entre hidrógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$  y alcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_2$ ;
- $R^y$  se selecciona entre halógeno, nitro, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo  $C_1-C_4$  y haloalquilsulfonilo  $C_1-C_4$ ;
- 10 excepto para los compuestos de fórmula I'.A, en la que  $R^1$  es hidrógeno y A se selecciona entre el grupo que consiste en 2,6-difluoro-4-piridilo, 2,6-dicloro-4-piridilo, 2,6-dibromo-4-piridilo y 2,6-diiodo-4-piridilo.

15 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un método para controlar plagas de invertebrados, método que comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su criadero o una planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el que las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que se protegen del ataque o infestación de plagas con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de piridazina de fórmula I'.A de acuerdo con la presente invención o una sal del mismo, un N-óxido del mismo o una sal de un N-óxido del mismo.

20 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un método para proteger material de propagación de plantas y/o las plantas que crecen a partir del mismo, método que comprende tratar el material de propagación de plantas con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de piridazina de fórmula I'.A de acuerdo con la presente invención o una sal agrícolamente aceptable del mismo, un N-óxido del mismo o una sal de un N-óxido del mismo.

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

25 Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un método para tratar o proteger un animal de una infestación o infección por parásitos, especialmente ectoparásitos, que comprende poner en contacto en animal con una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de fórmula I'.A de acuerdo con la presente invención o una sal veterinariamente aceptable o un N-óxido del mismo. Poner en contacto animal con el compuesto de fórmula I'.A, su sal o la composición veterinaria de la invención significa aplicarlo o administrarlo al animal.

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

#### Descripción detallada de la invención

35 Los radicales unidos a la cadena principal de los compuestos de fórmula I'.A pueden contener uno o más centros de quiralidad. En este caso, los compuestos de fórmula I'.A están presentes en forma de enantiómeros o diastereómeros diferentes, dependiendo de los sustituyentes. La presente invención se refiere a cada estereoisómero posible de los compuestos de fórmula I'.A, es decir a enantiómeros o diastereómeros individuales, así como a mezclas de los mismos.

40 Los compuestos de fórmula I'.A pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas tales como estabilidad o mostrar diferentes propiedades biológicas tales como actividades. La presente invención se refiere a compuestos amorfos y cristalinos de fórmula I'.A, mezclas de diferentes estados cristalinos del respectivo compuesto de fórmula I'.A, así como sales amorfas o cristalinas de los mismos.

45 Las sales de los compuestos de fórmula I'.A son preferentemente agrícola y veterinariamente aceptables. Se pueden formar de una forma habitual, por ejemplo por reacción del compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula I'.A tiene una funcionalidad básica.

Las sales agrícolamente útiles de los compuestos de fórmula I'.A incluyen especialmente las sales de adición de ácido de los ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efectos adversos en la acción plaguicida de los compuestos de fórmula I'.A.

5 Algunos aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenosulfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanóicos C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, preferentemente formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar por reacción de los compuestos de fórmula I'.A con un ácido del correspondiente anión, preferentemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

10 Las sales veterinariamente aceptables de los compuestos de fórmula I'.A incluyen especialmente las sales de adición de ácido que se conocen y se aceptan en la técnica para la formulación de sales para uso veterinario. Algunas sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula I'.A que contienen un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo un grupo amino, incluyen sales con ácidos orgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos, nitratos y sales de ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético, ácido maleico, por ejemplo las sales de monoácido o las sales de diácido de ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, por ejemplo las sales de monoácido o las sales de diácido de ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metanosulfénico, ácido metanosulfónico, y ácido succínico.

15 El término "N-óxido" incluye cualquier compuesto de fórmula I'.A que tiene al menos un átomo de nitrógeno terciario que se oxida a un resto N-óxido.

20 La expresión "plaga de invertebrados", como se usa en el presente documento, incluye poblaciones de animales, tales como insectos, arácnidos y nematodos. Estas plagas pueden atacar plantas causando de ese modo un daño considerable en las plantas atacadas. La expresión "plaga de animal", como se usa en el presente documento, también incluye ectoparásitos que pueden infestar animales, en particular animales de sangre caliente tales como, por ejemplo, mamíferos o pájaros, u otros animales superiores tales como reptiles, anfibios o peces, causando de ese modo un daño considerable a los animales infestados.

25 La expresión "material de propagación de plantas", como se usa en el presente documento, 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 se pueden usar para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutas, tubérculos, bulbos, rizomas, tallos, brotes y otras partes de las plantas. También se pueden incluir plantones y plantas jóvenes, que se van a trasplantar después de la germinación o después del surgimiento del suelo. Estos materiales de propagación de plantas se pueden tratar profilácticamente con una composición de protección de plantas en o antes de la plantación o el trasplante.

30 El término "plantas" comprende cualquier tipo de planta incluyendo "plantas no cultivadas" y en particular "plantas cultivadas".

La expresión "plantas no cultivadas" se refiere a cualquier especie de tipo salvaje o especie relacionada o género relacionado de una planta cultivada.

35 La expresión "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye plantas que se han modificado mediante cría, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas modificadas genéticamente son plantas, cuyo material genético se ha modificado de ese modo mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que en circunstancias naturales no se pueden obtener fácilmente mediante cruzamiento, mutaciones o recombinación natural. Por lo general, 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 incluyen, pero no se limitan a, modificación postransicional dirigida de una proteína o proteínas (oligo o polipéptidos), por ejemplo por glicosilación o adiciones de polímero tales como restos prenilados, acetilados o farnesilados o restos de PEG (por ejemplo, como se describe en *Biotechnol Prog.* Julio-agosto de 2001;17(4):720-8., *Protein Eng. Des. Sel.* Enero de 2004;17(1):57-66, *Nat. Protoc.* 2007;2(5):1225-35., *Curr. Opin. Chem. Biol.* Octubre de 2006;10(5):487-91. *Epub* 28 de agosto de 2006, *Biomaterials.* Marzo de 2001; 22(5):405-17, *Bioconjug. Chem.* Enero-febrero de 2005;16(1):113-45 21).

50 La expresión "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye además plantas que se han vuelto tolerantes a aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonil ureas (véanse, por ejemplo, los documentos de Patente US 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) o imidazolinonas (véanse, por ejemplo, los documentos de Patente US 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); inhibidores de enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS), tales como glifosato (véase, por ejemplo, el documento de Patente WO 92/00377); inhibidores de glutamina sintetasa (GS), tales como glufosinato (véanse, por ejemplo, los documentos de Patente EP-A-0242236, EP-A-242246) o herbicidas de oxinilo (véase, por ejemplo, el documento de Patente US 5.559.024) como resultado de métodos convencionales de cría o ingeniería genética.

Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a herbicidas mediante métodos convencionales de cría (mutagénesis), por ejemplo colza de verano Clearfield® (colza) que es tolerante a imidazolinonas, por ejemplo imazamox. Se han usado métodos de ingeniería genética para hacer las plantas cultivadas, tales como soja, algodón, maíz, remolacha y colza, tolerantes a herbicidas, tales como glifosato y glufosinato, algunas de las cuales están disponibles en el mercado con los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato).

La expresión "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, 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 nematodos, por ejemplo Photorhabdus spp. o Xenorhabdus spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnidos, toxinas de avispa, u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de Streptomyces, lectinas de plantas, tales como lectinas de guisante o cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina o papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas, (RIP), tales como ricino, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas de metabolismo de esteroides, tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glucosil transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisoma o HMG-CoA-reductasa; bloqueadores de los canales de iones, tales como bloqueadores de canales de sodio o potasio; esterasa de hormona juvenil; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); estilbeno sintasa, bibencilo sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas insecticidas o toxinas se han de entender expresamente también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o modificadas de otro modo. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios proteicos (véase, por ejemplo, el documento de Patente WO 2/1571). Otros ejemplos de tales toxinas o plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar tales toxinas se desvelan, por ejemplo, en los documentos de Patente EP-A 374 753, WO 93/7278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 3/1881 y WO 3/5273. El experto en la materia conoce generalmente métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente imparten a las plantas que producen estas proteínas protección frente a plagas perjudiciales de ciertos grupos taxonómicos de insectos artrópodos, particularmente a escarabajos (Coleoptera), moscas (Diptera), y mariposas y polillas (Lepidoptera) y a nematodos parásitos de plantas (Nematoda).

La expresión "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye además plantas que son capaces, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de estas plantas frente a patógenos bacterianos, víricos o fúngicos. Algunos ejemplos de dichas proteínas son las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo el documento de Patente EP-A 0 392 225), genes de resistencia a enfermedades de plantas (por ejemplo, variedades de cultivo de patata que expresan genes de resistencia que actúan frente a *Phytophthora infestans* derivadas de la patata silvestre mexicana *Solanum bulbocastanum*) o lisozima T4 (por ejemplo, variedades de cultivo de patata capaces de sintetizar estas proteínas con resistencia aumentada frente a bacterias tales como *Erwinia amylovora*). El experto en la materia conoce generalmente los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

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

La expresión "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye además plantas que contienen, mediante 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 de aceite que producen ácidos grasos omega 3 o ácidos grasos omega 9 insaturados de cadena larga promotores de la salud (por ejemplo, colza Nexera®).

La expresión "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye además plantas que contienen, mediante 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 aumentadas de amilopectina (por ejemplo, patata Amflora®).

Los restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son - tales como el término halógeno - términos colectivos para listas individuales de los miembros de grupo individuales. El sufijo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub> indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

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

5 El término "alquilo", como se usa en el presente documento y en los restos alquilo de alcoxi, alquilcarbonilo, alquiltio, alquilsulfino, alquilsulfonilo y alcoxialquilo, representa en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que tiene habitualmente de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono y en particular de 1 a 3 átomos de carbono. Algunos ejemplos de un grupo alquilo son metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, 2-butilo, iso-butilo, terc-butilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, n-heptilo, 1-metilhexilo, 2-metilhexilo, 3-metilhexilo, 4-metilhexilo, 5-metilhexilo, 1-etilpentilo, 2-etilpentilo, 3-etilpentilo, 1-propilpentilo, n-octilo, 1-metiloctilo, 2-metilheptilo, 1-etilhexilo, 2-etilhexilo, 1,2-dimetilhexilo, 1-propilpentilo y 2-propilpentilo.

15 El término "alquileno" (o alcanodiilo), como se usa en el presente documento, representa en cada caso un radical alquilo como se ha definido anteriormente, en el que un átomo de hidrógeno en cualquier posición de la cadena principal de carbono se reemplaza con un sitio de enlace adicional, formando de ese modo un resto divalente.

20 El término "haloalquilo", como se usa en el presente documento y en los restos haloalquilo de haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilcarbonilo, haloalquilsulfonilo y haloalquilsulfino, representa en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que tiene habitualmente de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 átomos de carbono, en el que los átomos de hidrógeno de este grupo se reemplazan parcial o totalmente con átomos de halógeno. Algunos restos haloalquilo preferentes se seleccionan entre haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, más preferentemente entre haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, en particular entre fluoroalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> tal como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, y similares.

25 El término "alcoxi", como se usa en el presente documento, representa en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que está unido a través de un átomo de oxígeno y tiene habitualmente de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono. Algunos ejemplos de un grupo alcoxi son metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, n-butiloxi, 2-butiloxi, iso-butiloxi, terc-butiloxi, y similares.

30 El término "haloalcoxi", como se usa en el presente documento, representa en cada caso un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 4 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 3 átomos de carbono, en el que los átomos de hidrógeno de este grupo se reemplazan parcial o totalmente con átomos de halógeno, en particular átomos de flúor. Algunos restos haloalcoxi preferentes incluyen haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en particular fluoroalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, tales como fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y similares.

35 El término "cicloalquilo", como se usa en el presente documento y en los restos cicloalquilo de cicloalcoxi y cicloalquilmetilo, representa en cada caso un radical cicloalifático mono o bicíclico que tiene habitualmente 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.

40 El término "halocicloalquilo", como se usa en el presente documento y en los restos halocicloalquilo de halocicloalquilmetilo, representa en cada caso un radical cicloalifático mono o bicíclico que tiene habitualmente de 3 a 10 átomos de carbono o de 3 a 6 átomos de carbono, en el que al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 de los átomos de hidrógeno se reemplazan con halógeno, en particular con flúor o cloro. Algunos ejemplos son 1- y 2-fluorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-difluorociclopropilo, 1,2,2-trifluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, 1- y 2-clorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-diclorociclopropilo, 1,2,2-triclorociclopropilo, 2,2,3,3-tetraclorociclopropilo, 1-, 2- y 3-fluorociclopropilo, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-difluorociclopropilo, 1-, 2- y 3-clorociclopropilo, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-diclorociclopropilo y similares.

45 El término "alqueno", como se usa en el presente documento, representa en cada caso un radical hidrocarburo insaturado individualmente que tiene habitualmente de 2 a 10, preferentemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo vinilo, alilo (2-propen-1-ilo), 1-propen-1-ilo, 2-propen-2-ilo, metalilo (2-metilprop-2-en-1-ilo), 2-buten-1-ilo, 3-buten-1-ilo, 2-penten-1-ilo, 3-penten-1-ilo, 4-penten-1-ilo, 1-metilbut-2-en-1-ilo, 2-etilprop-2-en-1-ilo y similares.

50 El término "alquino", como se usa en el presente documento, representa en cada caso un radical hidrocarburo insaturado individualmente que tiene habitualmente de 2 a 10, preferentemente de 2 a 4 átomos de carbono, por ejemplo etinilo, propargilo (2-propin-1-ilo), 1-propin-1-ilo, 1-metilprop-2-in-1-ilo, 2-butin-1-ilo, 3-butin-1-ilo, 1-pentin-1-ilo, 3-pentin-1-ilo, 4-pentin-1-ilo, 1-metilbut-2-in-1-ilo, 1-etilprop-2-in-1-ilo y similares.

- El término "alcoxilquilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un quilo que comprende habitualmente de 1 a 4 átomos de carbono, en el que 1 átomo de carbono porta un radical alcoxi que comprende habitualmente de 1 a 10, en particular de 1 a 4 átomos de carbono, como se ha definido anteriormente. Algunos ejemplos son  $\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$ , n-propoximetilo,  $\text{CH}_2\text{-OCH}(\text{CH}_3)_2$ , n-butoximetilo, (1-metilpropoxi)-metilo, (2-metil-propoxi)metilo,  $\text{CH}_2\text{-OC}(\text{CH}_3)_3$ , 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)-propilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)-propilo, 2-(metoxi)-butilo, 2-(etoxi)-butilo, 2-(n-propoxi)-butilo, 2-(1-metiletoxi)-butilo, 2-(n-butoxi)-butilo, 2-(1-metilpropoxi)-butilo, 2-(2-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.
- 15 El término "alquilcarbonilo" (alquil-C(=O)-), como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado como se ha definido anteriormente que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= alquilcarbonilo  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ ), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquilcarbonilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ) unido a través del átomo de carbono del grupo carbonilo en cualquier posición del grupo alquilo.
- El término "haloalquilcarbonilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilcarbonilo como se ha definido anteriormente en el que los átomos de hidrógeno se sustituyen parcial o completamente con flúor, cloro, bromo y/o yodo.
- 25 El término "alquiltio" (también alquilsulfanilo o alquil-S-), como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado que comprende 1 a 10 átomos de carbono (= alquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ ), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ) como se ha definido anteriormente, que está unido a través de un átomo de azufre en cualquier posición del grupo alquilo.
- El término "haloalquiltio", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquiltio como se ha definido anteriormente en el que los átomos de hidrógeno se sustituyen parcial o completamente con flúor, cloro, bromo y/o yodo.
- 30 El término "alquilsulfinito" (también alquilsulfoxilo o alquil-S(=O)-), como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado como se ha definido anteriormente que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= alquilsulfinito  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ ), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfinito  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ) unido a través del átomo de azufre del grupo sulfinito en cualquier posición del grupo alquilo.
- El término "haloalquilsulfinito", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilsulfinito como se ha definido anteriormente en el que los átomos de hidrógeno se sustituyen parcial o completamente con flúor, cloro, bromo y/o yodo.
- 35 El término "alquilsulfonilo" (también alquil-S(=O)<sub>2</sub>-), como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificado que comprende de 1 a 10 átomos de carbono (= alquilsulfonilo  $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ ), preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfonilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ), como se ha definido anteriormente, que está unido a través del átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición del grupo alquilo.
- 40 El término "haloalquilsulfonilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilsulfonilo como se ha definido anteriormente en el que los átomos de hidrógeno se sustituyen parcial o completamente con flúor, cloro, bromo y/o yodo.
- 45 El término "heterociclilo" incluye radicales no aromáticos heterocíclicos monocíclicos, en general de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros, en particular de 5, 6, 7 u 8 miembros, y radicales no aromáticos heterocíclicos bicíclicos de 8 a 10 miembros, y los radicales no aromáticos mono y bicíclicos pueden estar saturados o no saturados. Los radicales no aromáticos heterocíclicos mono y bicíclicos comprenden habitualmente 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados entre N, O y S como miembros de anillo, donde los átomos de S como miembros de anillo puede estar presentes como S, SO o SO<sub>2</sub>. Algunos ejemplos de radicales heterocíclicos de 3, 4, 5, 6, 7 u 8 miembros saturados o insaturados comprenden anillos heterocíclicos no aromáticos, saturados o insaturados, tales como oxiranilo, oxetanilo, tietanilo, S-óxido de tietanilo (S-oxotietanilo), S-dióxido de tietanilo (S-dioxotietanilo), pirrolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahidrofurano, dihidrofurano, 1,3-dioxolanilo, dioxolanilo, 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-



dioxotetrahidrotiopirano, morfolinilo, tiomorfolinilo, S-oxotiomorfolinilo, S-dioxotiomorfolinilo, tiazinilo y similares. Algunos ejemplos del anillo heterocíclico que también comprende 1 o 2 grupos carbonilo como miembros de anillo comprenden pirrolidin-2-onilo, pirrolidin-2,5-dionilo, imidazolidin-2-onilo, oxazolidin-2-onilo, tiazolidin-2-onilo y similares.

- 5 El término "hetarilo" incluye radicales heterocíclicos monocíclicos insaturados en general de 5 o 6 miembros y radicales heterocíclicos bicíclicos insaturados de 8 a 10 miembros que son aromáticos, es decir, cumplen la regla de Hückel (regla de  $4n+2$ ). Hetarilo comprende habitualmente 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados entre N, O y S como miembros de anillo.

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

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

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

Los términos "heterociclilalquilo" y "hetarilalquilo" se refieren a heterociclilo o hetarilo, respectivamente, como se han definido anteriormente que están unidos a través de un grupo alquilo, en particular un grupo metileno (= heterociclilmetilo o hetarilmetilo, respectivamente) o un grupo 1,1-etandiilo o 1,2-etandiilo (= 1-heterocicliletilo, 2-heterocicliletilo, 1-hetariletilo o 2-hetariletilo, respectivamente), al resto de la molécula.

- 35 Las observaciones realizadas a continuación con respecto a las realizaciones preferentes de las variables de los compuestos de fórmula I'.A son válidas por sí mismas así como - preferentemente - en combinación entre sí. Las observaciones realizadas a continuación en lo que respecta a las realizaciones preferentes de las variables son válidas además en lo que respecta a los compuestos de fórmula I'.A así como en lo que respecta a los usos y métodos de acuerdo con la invención y a la composición de acuerdo con la invención.

- 40 Algunos ejemplos de radicales  $R^1$  de los compuestos I'.A incluyen:

- hidrógeno;
- alquilo  $C_1-C_3$ , tal como metilo, etilo, n-propilo o isopropilo;
- haloalquilo  $C_1-C_3$ , tal como 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, 2-brometilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloroetilo, 2,2-dibromoetilo o 2,2,2-trifluoroetilo; y
- 45 - alcoxi  $C_1-C_3$ -alquilo  $C_1-C_3$  tal como metoximetilo, etoximetilo, 2-metoxietilo o 2-etoxietilo.

- Los radicales  $R^{A1}$  y  $R^{A5}$  de los compuestos de fórmula I'.A, si estuvieran presentes, se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquileno  $C_1-C_3-CN$ , alquileno  $C_1-C_3-OR^a$ , cicloalquilo  $C_3-C_7$ , cicloalquil  $C_3-C_7$ -alquilo  $C_1-C_3$ , y heterociclilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo  $C_1-C_3$ , en los que cicloalquilo y heterociclilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes  $R^y$  iguales o diferentes, en los que  $R^a$  es como se define en el presente documento y en particular se selecciona entre el grupo consiste en hidrógeno, metilo, etilo, difluorometilo y trifluorometilo, y en los que los sustituyentes  $R^y$  son como se definen en el presente documento.

En una realización preferente particular de la invención  $R^{A1}$  y  $R^{A5}$ , si estuvieran presentes, se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

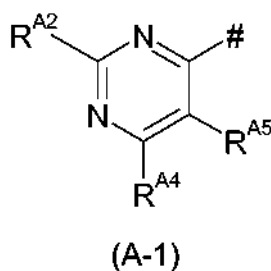
Los radicales  $R^{A2}$  y  $R^{A4}$  de los compuestos de fórmula I.A, si estuvieran presentes, se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquilenos  $C_1-C_3-CN$ , alquilenos  $C_1-C_3-O R^a$ , cicloalquilo  $C_3-C_7$ , cicloalquil  $C_3-C_7$ -alquilo  $C_1-C_3$ , y heterocicilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo  $C_1-C_3$ , en los que cicloalquilo y heterocicilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes  $R^y$  iguales o diferentes, en los que  $R^a$  es como se define en el presente documento y en particular se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, difluorometilo y trifluorometilo, y en los que los sustituyentes  $R^y$  son como se definen en el presente documento.

En una realización preferente particular de la invención  $R^{A2}$  y  $R^{A4}$ , si estuvieran presentes, se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

El radical  $R^{A3}$  de los compuestos de fórmula I.A, si estuvieran presente, se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquilenos  $C_1-C_3-CN$ , alquilenos  $C_1-C_3-OR^a$ , cicloalquilo  $C_3-C_7$ , cicloalquil  $C_3-C_7$ -alquilo  $C_1-C_3$ , y heterocicilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo  $C_1-C_3$ , en el que cicloalquilo y heterocicilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes  $R^y$  iguales o diferentes, en el que  $R^a$  es como se define en el presente documento y en particular se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, difluorometilo y trifluorometilo, y en el que los sustituyentes  $R^y$  son como se definen en el presente documento.

En una realización preferente particular de la invención  $R^{A3}$ , si estuviera presente, se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula I.A, a las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos y a los métodos y usos de tales compuestos, en la que  $R^1$  es como se ha definido anteriormente y en particular tiene uno de los significados preferentes y en la que A es un radical A-1,



en el que #,  $R^{A2}$ ,  $R^{A4}$  y  $R^{A5}$  son como se definen en el presente documento.

Entre los compuestos de fórmula I.A en la que A es A-1, se da preferencia a aquellos compuestos en la que  $R^{A5}$  se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Entre los compuestos de fórmula I.A en la que A es A-1, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que  $R^{A2}$  y  $R^{A4}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Preferentemente uno o dos de los sustituyentes  $R^{A2}$ ,  $R^{A4}$  y  $R^{A5}$  son hidrógeno.

Algunos ejemplos de radicales A-1 adecuados son los radicales de fórmulas A-1.1 a A-1.173, como se definen en la Tabla A1.

Tabla A1.

4-Pirimidinilo	(A-1.1)
2-Cloro-4-pirimidinilo	(A-1.2)
2-Bromo-4-pirimidinilo	(A-1.3)
2-Metil-4-pirimidinilo	(A-1.4)
2-Etil-4-pirimidinilo	(A-1.5)
2-Ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.6)
2-Isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.7)
2-Isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.8)
2-Ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.9)
2-Difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.10)
2-Trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.11)
2-(2,2,2-Trifluoroetil-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.12)
2-Metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.13)
2-Difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.14)
2-Trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.15)
2-Cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.16)
2-Metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.17)
2-Metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.18)
2-Trifluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.19)
5,6-Dimetil-4-pirimidinilo	(A-1.20)
5-Metil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.21)
6-Metil-5-etil-4-pirimidinilo	(A-1.22)
5,6-Dietil-4-pirimidinilo	(A-1.23)
2,5,6-Trimetil-4-pirimidinilo	(A-1.24)
2,5-Dimetil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.25)
2,6-Dimetil-5-etil-4-pirimidinilo	(A-1.26)
2-Metil-5,6-dietil-4-pirimidinilo	(A-1.27)
2-Trifluorometil-5,6-dimetil-4-pirimidinilo	(A-1.28)
2-Trifluorometil-5-metil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.29)
2-Trifluorometil-6-metil-5-etil-4-pirimidinilo	(A-1.30)
2-Trifluorometil-5,6-dietil-4-pirimidinilo	(A-1.31)
2-Ciclopropil-5,6-dimetil-4-pirimidinilo	(A-1.32)
2-Ciclopropil-5-metil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.33)
2-Ciclopropil-6-metil-5-etil-4-pirimidinilo	(A-1.34)
2-Ciclopropil-5,6-dietil-4-pirimidinilo	(A-1.35)
2-Isopropil-5,6-dimetil-4-pirimidinilo	(A-1.36)
2-Isopropil-5-metil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.37)
2-Isopropil-6-metil-5-etil-4-pirimidinilo	(A-1.38)

ES 2 589 792 T3

2-Isopropil-5,6-dietil-4-pirimidinilo	(A-1.39)
2-Isobutil-5,6-dimetil-4-pirimidinilo	(A-1.40)
2-Isobutil-5-metil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.41)
2-Isobutil-6-metil-5-etil-4-pirimidinilo	(A-1.42)
2-Isobutil-5,6-dietil-4-pirimidinilo	(A-1.43)
2-Ciclopropilmetil-5,6-dimetil-4-pirimidinilo	(A-1.44)
2-Ciclopropilmetil-5-metil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.45)
2-Ciclopropilmetil-6-metil-5-etil-4-pirimidinilo	(A-1.46)
2-Ciclopropilmetil-5,6-dietil-4-pirimidinilo	(A-1.47)
6-Metil-4-pirimidinilo	(A-1.48)
2-Metil-6-metil-4-pirimidinilo	(A-1.49)
2-Trifluorometil-6-metil-4-pirimidinilo	(A-1.50)
2-Ciclopropil-6-metil-4-pirimidinilo	(A-1.51)
2-Isopropil-6-metil-4-pirimidinilo	(A-1.52)
2-Isobutil-6-metil-4-pirimidinilo	(A-1.53)
2-Ciclopropilmetil-6-metil-4-pirimidinilo	(A-1.54)
6-Etil-4-pirimidinilo	(A-1.55)
2-Metil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.56)
2-Trifluorometil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.57)
2-Ciclopropil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.58)
2-Isopropil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.59)
2-Isobutil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.60)
2-Ciclopropilmetil-6-etil-4-pirimidinilo	(A-1.61)
6-Trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.62)
2-Metil-6-trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.63)
2-Trifluorometil-6-trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.64)
2-Ciclopropil-6-trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.65)
2-Isopropil-6-trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.66)
2-Isobutil-6-trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.67)
2-Ciclopropilmetil-6-trifluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.68)
6-Difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.69)
2-Metil-6-difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.70)
2-Trifluorometil-6-difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.71)
2-Ciclopropil-6-difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.72)
2-Isopropil-6-difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.73)
2-Isobutil-6-difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.74)
2-Ciclopropilmetil-6-difluorometil-4-pirimidinilo	(A-1.75)
6-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.76)
6-Metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.77)
6-Difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.78)
6-Trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.79)
6-Cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.80)

## ES 2 589 792 T3

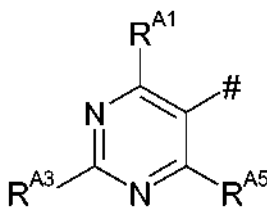
6-Metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.81)
2-Metil-6-(2,2,2-trifluoroet-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.82)
2-Metil-6-metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.83)
2-Metil-6-difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.84)
2-Metil-6-trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.85)
2-Metil-6-cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.86)
2-Metil-6-metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.87)
2-Trifluorometil-6-(2,2,2-trifluoroet-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.88)
2-Trifluorometil-6-metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.89)
2-Trifluorometil-6-difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.90)
2-Trifluorometil-6-trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.91)
2-Trifluorometil-6-cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.92)
2-Trifluorometil-6-metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.93)
2-Ciclopropil-6-(2,2,2-trifluoroet-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.94)
2-Ciclopropil-6-metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.95)
2-Ciclopropil-6-difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.96)
2-Ciclopropil-6-trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.97)
2-Ciclopropil-6-cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.98)
2-Ciclopropil-6-metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.99)
2-Isopropil-6-(2,2,2-trifluoroet-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.100)
2-Isopropil-6-metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.101)
2-Isopropil-6-difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.102)
2-Isopropil-6-trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.103)
2-Isopropil-6-cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.104)
2-Isopropil-6-metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.105)
2-Isobutil-6-(2,2,2-trifluoroet-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.106)
2-Isobutil-6-metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.107)
2-Isobutil-6-difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.108)
2-Isobutil-6-trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.109)
2-Isobutil-6-cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.110)
2-Isobutil-6-metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.111)
2-Ciclopropilmetil-6-(2,2,2-trifluoroet-1-il)-4-pirimidinilo	(A-1.112)
2-Ciclopropilmetil-6-metoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.113)
2-Ciclopropilmetil-6-difluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.114)
2-Ciclopropilmetil-6-trifluorometoximetil-4-pirimidinilo	(A-1.115)
2-Ciclopropilmetil-6-cianometil-4-pirimidinilo	(A-1.116)
2-Ciclopropilmetil-6-metoxietil-4-pirimidinilo	(A-1.117)
6-Cloro-4-pirimidinilo	(A-1.118)
2-Metil-6-cloro-4-pirimidinilo	(A-1.119)
2-Trifluorometil-6-cloro-4-pirimidinilo	(A-1.120)
2-Ciclopropil-6-cloro-4-pirimidinilo	(A-1.121)
2-Isopropil-6-cloro-4-pirimidinilo	(A-1.122)

## ES 2 589 792 T3

2-Isobutil-6-cloro-4-pirimidinilo	(A-1.123)
2-Ciclopropilmetil-6-cloro-4-pirimidinilo	(A-1.124)
6-Bromo-4-pirimidinilo	(A-1.125)
2-Metil-6-bromo-4-pirimidinilo	(A-1.126)
2-Trifluorometil-6-bromo-4-pirimidinilo	(A-1.127)
2-Ciclopropil-6-bromo-4-pirimidinilo	(A-1.128)
2-Isopropil-6-bromo-4-pirimidinilo	(A-1.129)
2-Isobutil-6-bromo-4-pirimidinilo	(A-1.130)
2-Ciclopropilmetil-6-bromo-4-pirimidinilo	(A-1.131)
6-Ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.132)
6-Isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.133)
6-Isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.134)
6-Ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.135)
2-Metil-6-ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.136)
2-Metil-6-isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.137)
2-Metil-6-isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.138)
2-Metil-6-ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.139)
2-Trifluorometil-6-ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.140)
2-Trifluorometil-6-isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.141)
2-Trifluorometil-6-isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.142)
2-Trifluorometil-6-ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.143)
2-Ciclopropil-6-ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.144)
2-Ciclopropil-6-isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.145)
2-Ciclopropil-6-isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.146)
2-Ciclopropil-6-ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.147)
2-Isopropil-6-ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.148)
2-Isopropil-6-isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.149)
2-Isopropil-6-isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.150)
2-Isopropil-6-ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.151)
2-Isobutil-6-ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.152)
2-Isobutil-6-isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.153)
2-Isobutil-6-isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.154)
2-Isobutil-6-ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.155)
2-Ciclopropilmetil-6-ciclopropil-4-pirimidinilo	(A-1.156)
2-Ciclopropilmetil-6-isopropil-4-pirimidinilo	(A-1.157)
2-Ciclopropilmetil-6-isobutil-4-pirimidinilo	(A-1.158)
2-Ciclopropilmetil-6-ciclopropilmetil-4-pirimidinilo	(A-1.159)
6-Metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.160)
2-Metil-6-metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.161)
2-Trifluorometil-6-metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.162)
2-Ciclopropil-6-metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.163)
2-Isopropil-6-metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.164)

2-Isobutil-6-metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.165)
2-Ciclopropilmetil-6-metoxi-4-pirimidinilo	(A-1.166)
6-Difluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.167)
2-Metil-6-difluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.168)
2-Trifluorometil-6-difluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.169)
2-Ciclopropil-6-difluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.170)
2-Isopropil-6-difluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.171)
2-Isobutil-6-difluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.172)
2-Ciclopropilmetil-6-difluorometoxi-4-pirimidinilo	(A-1.173)

5 Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula I'.A, a las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos y a los métodos y usos de tales compuestos, en la que R<sup>1</sup> es como se ha definido anteriormente y en particular tiene uno de los significados preferentes y en la que A es un radical A-2,



(A-2)

en el que #, R<sup>A1</sup>, R<sup>A3</sup> y R<sup>A5</sup> son como se definen en el presente documento.

10 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-2, se da preferencia a aquellos compuestos en la que R<sup>A1</sup> y R<sup>A5</sup> se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

15 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-2, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que R<sup>A3</sup> se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Preferentemente uno o dos de los sustituyentes R<sup>A1</sup>, R<sup>A3</sup> y R<sup>A5</sup> son hidrógeno.

20 Algunos ejemplos de radicales A-1 adecuados son los radicales de fórmulas A-2.1 a A-2.131, como se definen en la Tabla A2.

Tabla A2.

5-Pirimidinilo	(A-2.1)
2-Cloro-5-pirimidinilo	(A-2.2)
2-Bromo-5-pirimidinilo	(A-2.3)
2-Metil-5-pirimidinilo	(A-2.4)
2-Etil-5-pirimidinilo	(A-2.5)
2-Ciclopropil-5-pirimidinilo	(A-2.6)
2-Isopropil-5-pirimidinilo	(A-2.7)

2-Isobutil-5-pirimidinilo	(A-2.8)
2-Ciclopropilmetil-5-pirimidinilo	(A-2.9)
2-Difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.10)
2-Trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.11)
2-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-5-pirimidinilo	(A-2.12)
2-Metoximetil-5-pirimidinilo	(A-2.13)
2-Difluorometoximetil-5-pirimidinilo	(A-2.14)
2-Trifluorometoximetil-5-pirimidinilo	(A-2.15)
2-Cianometil-5-pirimidinilo	(A-2.16)
2-Metoxietil-5-pirimidinilo	(A-2.17)
2-Metoxi-5-pirimidinilo	(A-2.18)
2-Etoxi-5-pirimidinilo	(A-2.19)
2-Cloro-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.20)
2-Bromo-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.21)
2-Metil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.22)
2-Etil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.23)
2-Ciclopropil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.24)
2-Isopropil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.25)
2-Isobutil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.26)
2-Ciclopropilmetil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.27)
2-Difluorometil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.28)
2-Trifluorometil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.29)
2-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.30)
2-Metoximetil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.31)
2-Difluorometoximetil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.32)
2-Trifluorometoximetil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.33)
2-Cianometil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.34)
2-Metoxietil-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.35)
2-Metoxi-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.36)
2-Etoxi-4-metil-5-pirimidinilo	(A-2.37)
2-Cloro-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.38)
2-Bromo-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.39)
2-Metil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.40)
2-Etil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.41)
2-Ciclopropil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.42)
2-Isopropil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.43)
2-Isobutil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.44)
2-Ciclopropilmetil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.45)
2-Difluorometil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.46)
2-Trifluorometil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.47)
2-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.48)
2-Metoximetil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.49)

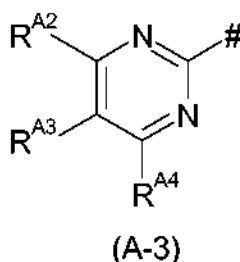


2-Difluorometoximetil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.50)
2-Trifluorometoximetil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.51)
2-Cianometil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.52)
2-Metoxietil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.53)
2-Metoxi-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.54)
2-Etoxi-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.55)
2,4-dicloro-5-pirimidinilo	(A-2.56)
2-Metil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.57)
2-Etil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.58)
2-Ciclopropil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.59)
2-Isopropil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.60)
2-Isobutil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.61)
2-Ciclopropilmetil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.62)
2-Difluorometil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.63)
2-Trifluorometil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.64)
2-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.65)
2-Metoximetil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.66)
2-Difluorometoximetil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.67)
2-Trifluorometoximetil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.68)
2-Cianometil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.69)
2-Metoxietil-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.70)
2-Metoxi-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.71)
2-Etoxi-4-cloro-5-pirimidinilo	(A-2.72)
2-Cloro-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.73)
2,4-dibromo-5-pirimidinilo	(A-2.74)
2-Metil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.75)
2-Etil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.76)
2-Ciclopropil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.77)
2-Isopropil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.78)
2-Isobutil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.79)
2-Ciclopropilmetil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.80)
2-Difluorometil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.81)
2-Trifluorometil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.82)
2-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.83)
2-Metoximetil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.84)
2-Difluorometoximetil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.85)
2-Trifluorometoximetil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.86)
2-Cianometil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.87)
2-Metoxietil-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.88)
2-Metoxi-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.89)
2-Etoxi-4-bromo-5-pirimidinilo	(A-2.90)
2-Bromo-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.91)

2-Metil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.92)
2-Etil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.93)
2-Ciclopropil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.94)
2-Isopropil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.95)
2-Isobutil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.96)
2-Ciclopropilmetil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.97)
2-Difluorometil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.98)
2-Trifluorometil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.99)
2-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.100)
2-Metoximetil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.101)
2-Difluorometoximetil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.102)
2-Trifluorometoximetil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.103)
2-Cianometil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.104)
2-Metoxietil-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.105)
2-Metoxi-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.106)
2-Etoxi-4-etil-5-pirimidinilo	(A-2.107)
2-Cloro-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.108)
2-Bromo-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.109)
2-Metil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.110)
2-Etil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.111)
2-Ciclopropil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.112)
2-Isopropil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.113)
2-Isobutil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.114)
2-Ciclopropilmetil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.115)
2-Difluorometil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.116)
2-Trifluorometil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.117)
2-(2,2,2-Trifluoroet-1-il)-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.118)
2-Metoximetil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.119)
2-Difluorometoximetil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.120)
2-Trifluorometoximetil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.121)
2-Cianometil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.122)
2-Metoxietil-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.123)
2-Metoxi-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.124)
2-Etoxi-4-difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.125)
4-Metil-5-pirimidinilo	(A-2.126)
4-Trifluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.127)
4-Cloro-5-pirimidinilo	(A-2.128)
4-Bromo-5-pirimidinilo	(A-2.129)
4-Etil-5-pirimidinilo	(A-2.130)
4-Difluorometil-5-pirimidinilo	(A-2.131)

Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula I'.A, a las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos y a los métodos y usos de tales

compuestos, en la que  $R^1$  es como se ha definido anteriormente y en particular tiene uno de los significados preferentes y en la que A es un radical A-3,



en el que #,  $R^{A2}$ ,  $R^{A3}$  y  $R^{A4}$  son como se definen en el presente documento.

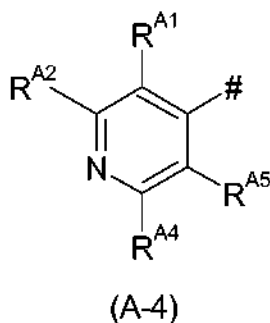
- 5 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-3, se da preferencia a aquellos compuestos en la que  $R^{A2}$  y  $R^{A4}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.
- 10 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-3, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que  $R^{A3}$  se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.
- 15 Preferentemente uno o dos de los sustituyentes  $R^{A2}$ ,  $R^{A3}$  y  $R^{A4}$  son hidrógeno.

Algunos ejemplos de radicales A-3 adecuados son los radicales de fórmulas A-3.1 a A-3.13, como se definen en la Tabla A3.

Tabla A3.

2-Pirimidinilo	(A-3.1)
4-Metil-2-pirimidinilo	(A-3.2)
5-Metil-2-pirimidinilo	(A-3.3)
4-Etil-2-pirimidinilo	(A-3.4)
5-Etil-2-pirimidinilo	(A-3.5)
4-Trifluorometil-2-pirimidinilo	(A-3.6)
5-Trifluorometil-2-pirimidinilo	(A-3.7)
4,5-Dimetil-2-pirimidinilo	(A-3.8)
4,5,6-Trimetil-2-pirimidinilo	(A-3.9)
4-Etil-5-metil-2-pirimidinilo	(A-3.10)
4-Metil-5-etil-2-pirimidinilo	(A-3.11)
4-Trifluorometil-5-metil-2-pirimidinilo	(A-3.12)
4-Metil-5-trifluorometil-2-pirimidinilo	(A-3.13)

- 20 Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula I'.A, a las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos y a los métodos y usos de tales compuestos, en la que  $R^1$  es como se ha definido anteriormente y en particular tiene uno de los significados preferentes y en la que A es un radical A-4,



en el que #,  $R^{A1}$ ,  $R^{A2}$ ,  $R^{A4}$  y  $R^{A5}$  son como se definen en el presente documento.

5 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-4, se da preferencia a aquellos compuestos en la que  $R^{A1}$  y  $R^{A5}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

10 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-4, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que  $R^{A2}$  y  $R^{A4}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

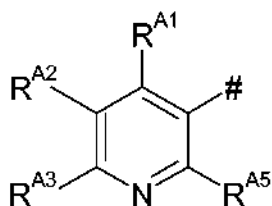
Preferentemente dos o tres de los sustituyentes  $R^{A1}$ ,  $R^{A2}$ ,  $R^{A4}$  y  $R^{A5}$  son hidrógeno.

15 Algunos ejemplos de radicales A-4 adecuados son los radicales de fórmulas A-4.1 a A-4.10, como se definen en la Tabla A4.

Tabla A4.

4-Piridilo	(A-4.1)
2-Metil-4-piridilo	(A-4.2)
2-Cloro-4-piridilo	(A-4.3)
2-Metoxi-4-piridilo	(A-4.4)
2-Nitro-4-piridilo	(A-4.5)
2-Trifluorometil-4-piridilo	(A-4.6)
2-Bromo-4-piridilo	(A-4.7)
2,3-Dimetil-4-piridilo	(A-4.8)
2,5-Dimetil-4-piridilo	(A-4.9)
2,6-Dimetil-4-piridilo	(A-4.10)

20 Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula I'.A, a las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos y a los métodos y usos de tales compuestos, en la que  $R^1$  es como se ha definido anteriormente y en particular tiene uno de los significados preferentes y en la que A es un radical A-5,



(A-5)

en el que #, R<sup>A1</sup>, R<sup>A2</sup>, R<sup>A3</sup> y R<sup>A5</sup> son como se definen en el presente documento.

Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-5, se da preferencia a aquellos compuestos en la que R<sup>A1</sup> y R<sup>A5</sup> se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-5, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que R<sup>A2</sup> se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-5, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que R<sup>A3</sup> se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Preferentemente dos o tres de los sustituyentes R<sup>A1</sup>, R<sup>A2</sup>, R<sup>A3</sup> y R<sup>A5</sup> son hidrógeno.

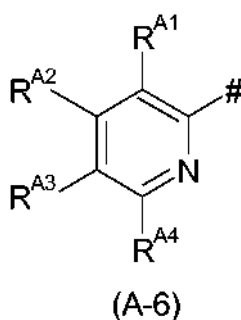
Algunos ejemplos de radicales A-5 adecuados son los radicales de fórmulas A-5.1 a A-5.37, como se definen en la Tabla A5.

Tabla A5.

3-Piridilo	(A-5.1)
2-Metil-3-piridilo	(A-5.2)
2-Cloro-3-piridilo	(A-5.3)
2-Metoxi-3-piridilo	(A-5.4)
2-Nitro-3-piridilo	(A-5.5)
2-Trifluorometil-3-piridilo	(A-5.6)
4-Bromo-3-piridilo	(A-5.7)
4-Metil-3-piridilo	(A-5.8)
4-Cloro-3-piridilo	(A-5.9)
4-Metoxi-3-piridilo	(A-5.10)
4-Nitro-3-piridilo	(A-5.11)
4-Trifluorometil-3-piridilo	(A-5.12)
4-Bromo-3-piridilo	(A-5.13)
5-Metil-3-piridilo	(A-5.14)
5-Cloro-3-piridilo	(A-5.15)
5-Metoxi-3-piridilo	(A-5.16)

5-Nitro-3-piridilo	(A-5.17)
5-Trifluorometil-3-piridilo	(A-5.18)
5-Bromo-3-piridilo	(A-5.19)
6-Metil-3-piridilo	(A-5.20)
6-Cloro-3-piridilo	(A-5.21)
6-Metoxi-3-piridilo	(A-5.22)
6-Nitro-3-piridilo	(A-5.23)
6-Trifluorometil-3-piridilo	(A-5.24)
6-Bromo-3-piridilo	(A-5.25)
2,4-Dimetil-3-piridilo	(A-5.26)
2,5-Dimetil-3-piridilo	(A-5.27)
2,6-Dimetil-3-piridilo	(A-5.28)
2,4-Dicloro-3-piridilo	(A-5.29)
2,5-Dicloro-3-piridilo	(A-5.30)
2,6-Dicloro-3-piridilo	(A-5.31)
2-Metil-4-cloro-3-piridilo	(A-5.32)
2-Metil-5-cloro-3-piridilo	(A-5.33)
2-Metil-6-cloro-3-piridilo	(A-5.34)
2-Cloro-4-metil-3-piridilo	(A-5.35)
2-Cloro-5-metil-3-piridilo	(A-5.36)
2-Cloro-6-metil-3-piridilo	(A-5.37)

5 Otra realización preferente de la invención se refiere a compuestos de piridazina de fórmula I'.A, a las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos y a los métodos y usos de tales compuestos, en la que R<sup>1</sup> es como se ha definido anteriormente y en particular tiene uno de los significados preferentes y en la que A es un radical A-6,



en el que #, R<sup>A1</sup>, R<sup>A2</sup>, R<sup>A3</sup> y R<sup>A4</sup> son como se definen en el presente documento.

10 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-6, se da preferencia a aquellos compuestos en la que R<sup>A1</sup> se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

15 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-6, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que R<sup>A2</sup> y R<sup>A4</sup> se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo,

2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

5 Entre los compuestos de fórmula I'.A en la que A es A-6, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que  $R^{A3}$  se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

Preferentemente dos o tres de los sustituyentes  $R^{A1}$ ,  $R^{A2}$ ,  $R^{A3}$  y  $R^{A4}$  son hidrógeno.

Algunos ejemplos de radicales A-6 adecuados son los radicales de fórmulas A-6.1 a A-6.31, como se definen en la Tabla A6.

10

Tabla A6.

2-Piridilo	(A-6.1)
4-Metil-2-piridilo	(A-6.2)
4-Cloro-2-piridilo	(A-6.3)
4-Metoxi-2-piridilo	(A-6.4)
4-Nitro-2-piridilo	(A-6.5)
4-Trifluorometil-2-piridilo	(A-6.6)
4-Metoxi-2-piridilo	(A-6.7)
5-Metil-2-piridilo	(A-6.8)
5-Cloro-2-piridilo	(A-6.9)
5-Metoxi-2-piridilo	(A-6.10)
5-Nitro-2-piridilo	(A-6.11)
5-Trifluorometil-2-piridilo	(A-6.12)
5-Metoxi-2-piridilo	(A-6.13)
6-Metil-2-piridilo	(A-6.14)
6-Cloro-2-piridilo	(A-6.15)
6-Metoxi-2-piridilo	(A-6.16)
6-Nitro-2-piridilo	(A-6.17)
6-Trifluorometil-2-piridilo	(A-6.18)
6-Metoxi-2-piridilo	(A-6.19)
4,5-Dimetil-2-piridilo	(A-6.20)
5,6-Dimetil-2-piridilo	(A-6.21)
4,6-Dimetil-2-piridilo	(A-6.22)
4,5-Dicloro-2-piridilo	(A-6.23)
5,6-Dicloro-2-piridilo	(A-6.24)
4,6-Dicloro-2-piridilo	(A-6.25)
4-Metil-5-cloro-2-piridilo	(A-6.26)
5-Metil-6-cloro-2-piridilo	(A-6.27)
4-Metil-6-cloro-2-piridilo	(A-6.28)
4-Cloro-5-metil-2-piridilo	(A-6.29)
5-Cloro-6-metil-2-piridilo	(A-6.30)
4-Cloro-6-metil-2-piridilo	(A-6.31)

Entre los compuestos de fórmula I'.A, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en la que A es un radical seleccionado entre los radicales A-1.1 a A-1.173, A-2.1 a A-2.131, A-3.1 a A-3.13, A-4.1 a A-4.10, A-5.1 a A-5.37 y A-6.1 a A-6.31. Entre los compuestos de fórmula I'.A, se da preferencia adicional particular a aquellos compuestos en la que A es un radical seleccionado entre los radicales A-1, A-2 y A-3, y particularmente seleccionado entre los radicales A-1.1 a A-1.173, A-2.1 a A-2.131 y A-3.1 a A-3.13.

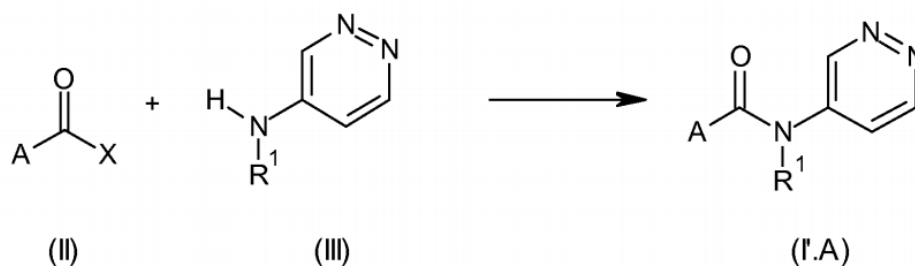
Tabla B

línea	radical R1
1	hidrógeno
2	metilo
3	etilo
4	n-propilo
5	isopropilo
6	2-fluoroetilo
7	2-cloroetilo
8	2-brometilo
9	2,2-difluoroetilo
10	2,2-dicloroetilo
11	2,2-dibromoetilo
12	2,2,2-Trifluoroetilo
13	metoximetilo
14	etoximetilo
15	2-metoxietilo
16	2-etoxietilo;

Los compuestos de fórmula I'.A se pueden preparar mediante los métodos convencionales de química orgánica, por ejemplo mediante los métodos que se describen en lo sucesivo en el presente documento o en los ejemplos de trabajo:

Los compuestos de fórmula I'.A se pueden preparar, por ejemplo, de acuerdo con el método que se representa en el esquema 1 por reacción del derivado de ácido carboxílico activado II con un compuesto de 4-aminopiridazina III (véase, por ejemplo, Houben-Weyl: "Methoden der organ. Chemie" [Methods of Organic Chemistry], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, Nueva York 1985, Volumen E5, pp. 941-1045). Los derivados de ácido carboxílico activados II son, por ejemplo, haluros, ésteres activados, anhídridos, azidas, tales como cloruros, fluoruros, bromuros, ésteres de para-nitrofenilo, ésteres de pentafluorofenilo, N-hidroxisuccinimidas o ésteres hidroxibenzotriazol-1-ilo. En el esquema 1, los radicales A y R<sup>1</sup> tienen los significados mencionados anteriormente y en particular los significados mencionados como preferentes, X es un grupo saliente adecuado tal como halógeno, N<sub>3</sub>, para-nitrofenoxi o pentafluorofenoxi y similares.

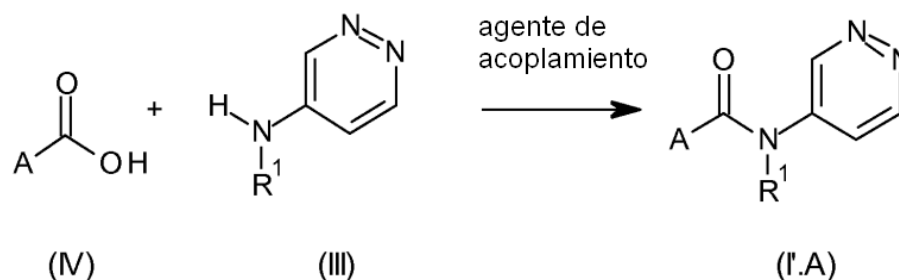
Esquema 1:





Los compuestos activados de fórmula I'.A también se pueden preparar, por ejemplo, por reacción del ácido carboxílico IV y el compuesto de 4-aminopiridazina III, en presencia de un agente de acoplamiento de acuerdo con el esquema 2. En el esquema 2, los radicales A y R<sup>1</sup> tienen los significados dados anteriormente y en particular los significados dados como preferentes.

Esquema 2:



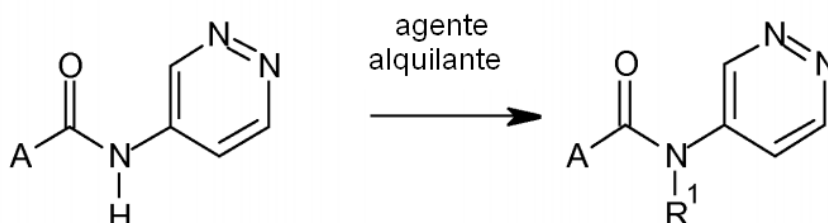
5

Algunos agentes de acoplamiento adecuados son, por ejemplo:

- 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;
- 10 - 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-isobutiloxicarbonil-1,2-dihidroquinolina [Y. Kiso, H. Yajima, J. Chem. Soc., Chem. Commun. 1972, 942];
- agentes de acoplamiento basados en sales de fosfonio, por ejemplo hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio [B. Castro, J.R. Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219], hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-il-oxi)tripirrolidinofosfonio [J. Coste *et al.*, Tetrahedron Lett. 1990, 31, 205];
- 15 - agentes de acoplamiento basados en sales de uronio o que tienen una estructura de N-óxido de guanidinio, por ejemplo hexafluorofosfato de N,N,N',N'-tetrametil-O-(1H-benzotriazol-1-il)uronio [R. Knorr, A. Trzeciak, W. Bannwarth, D. Gillissen, Tetrahedron Lett. 1989, 30, 1927], tetrafluoroborato de N,N,N',N'-tetrametil-O-(benzotriazol-1-il)uronio, hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)dipiperidinocarbenio [S. Chen, J. Xu, Tetrahedron Lett. 1992, 33, 647];
- 20 - agentes de acoplamiento que forman cloruros de ácido, por ejemplo cloruro bis-(2-oxo-oxazolidinil)fosfínico [J. Diago-Mese-quer, Synthesis 1980, 547].

Los compuestos de fórmula I'.A<sub>1</sub> en la que R<sup>1</sup> es diferente de hidrógeno también se pueden preparar por alquilación de las amidas I'.A (en la que R<sup>1</sup> es hidrógeno y que se puede obtener de acuerdo con el esquema 1 o 2) usando agentes alquilantes adecuados en presencia de bases, como se muestra en el esquema 3.

Esquema 3:



25

Los ácidos carboxílicos IV y sus derivados activados II así como el compuesto de 4-aminopiridazina III se conocen en la técnica o están disponibles en el mercado o se pueden preparar mediante métodos conocidos en la literatura.

Los N-óxidos de los compuestos de fórmula I'.A, se pueden preparar por oxidación de los compuestos I, de acuerdo con métodos convencionales de preparación de N-óxidos heteroaromáticos, por ejemplo mediante el método descrito por C. Botteghi *et al.* en Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31.

30

Como regla general, los compuestos de fórmula I'.A se pueden preparar mediante los métodos descritos anteriormente. Si no se pudieran preparar compuestos individuales mediante las rutas descritas anteriormente, se pueden preparar por derivatización de otros compuestos I'.A o mediante modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas. Por ejemplo, en casos individuales, ciertos compuestos de I'.A se pueden preparar ventajosamente a partir de otros compuestos I'.A mediante hidrólisis de éster, amidación, esterificación, escisión de éter, olefinación, reducción, oxidación y similares.

Las mezclas de reacción se procesan de forma habitual, por ejemplo por mezcla con agua, separación de las fases y, si fuera apropiado, purificación de los productos en bruto por cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sobre gel de sílice. Algunos de los compuestos intermedios y los productos finales se pueden obtener en forma de aceites viscosos incoloros o de color pardo pálido que se liberan o purifican de componentes volátiles a presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los compuestos intermedios y los productos finales se obtienen en forma de sólidos, se pueden purificar por recristalización o trituración.

Debido a su excelente actividad, los compuestos de fórmula general I'.A se pueden usar para controlar plagas de invertebrados.

Por lo tanto, la presente invención también proporciona un método para controlar plagas de invertebrados, método que comprende tratar las plagas, su suministro de alimento, su hábitat o su criadero o una planta cultivada, material de propagación de plantas (tales como una semilla), suelo, área, material o entorno en el que las plagas crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación de plantas (tales como una semilla), suelos, superficies o espacios que se protegen del ataque o infestación de plagas con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de fórmula (I'.A), una sal del mismo, un N-óxido del mismo o una sal de un N-óxido del mismo, o una composición como se ha definido anteriormente.

Preferentemente, el método de la invención sirve para proteger material de propagación de plantas (tal como una semilla) y la planta que crece a partir del mismo del ataque o infestación de plagas de invertebrados y comprende tratar el material de propagación de plantas (tal como una semilla) con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de fórmula (I'.A) o una sal agrícolamente aceptable del mismo, N-óxido del mismo o sal de un N-óxido del mismo como se ha definido anteriormente o con una cantidad plaguicida eficaz de una composición agrícola como se ha definido anteriormente y se hace posteriormente. El método de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación de plantas, material de suelo, etc.) que se ha tratado de acuerdo con la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, proporcionando de ese modo, por ejemplo, protección a una planta que crece a partir de un material de propagación de plantas tratado (tal como una semilla), no teniendo que ser tratada la propia planta.

En el sentido de la presente invención, las "plagas de invertebrados" se seleccionan preferentemente entre artrópodos y nematodos, más preferentemente entre insectos, arácnidos y nematodos perjudiciales, e incluso más preferentemente entre insectos, ácaros y nematodos.

La invención también proporciona una composición agrícola para combatir tales plagas de invertebrados, que comprende tal cantidad de al menos un compuesto de fórmula general I'.A o al menos una sal agrícolamente útil del mismo, N-óxido del mismo o sal de un N-óxido del mismo y al menos un vehículo agrícolamente aceptable líquido y/o sólido inerte que tiene una acción plaguicida y, si se desea, al menos un tensioactivo.

Tal composición puede contener un único compuesto activo de fórmula I'.A o una sal del mismo, un N-óxido del mismo o una sal de un N-óxido del mismo o una mezcla de varios compuestos I'.A activos o sus sales de acuerdo con la presente invención. La composición de acuerdo con la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

Los compuestos de fórmula I'.A y las composiciones plaguicidas que los comprenden son agentes eficaces para controlar plagas de artrópodos y nematodos. Algunas plagas de invertebrados controladas por los compuestos de fórmula I'.A incluyen, por ejemplo insectos del orden de los lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea gryosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*,

*Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusiani* y *Zeiraphera canadensis*;

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

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

15 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*;

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

homópteros (Homoptera), por ejemplo *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia 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 pyriaria*, *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*, *Trialetodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantii*, y *Viteus vitifolii*;

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

ortópteros (Orthoptera), por ejemplo *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *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*;

aracnoideos, tales como arácnidos (Acarina), por ejemplo de las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y Eriophyidae spp. tales como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; Tarsonemidae spp. tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*;

50 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*;

55 sifonápteros, por ejemplo *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.

Las composiciones y los compuestos de fórmula I.A son útiles para el control de nematodos parásitos de plantas tales como nematodos inductores de agallas, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, y otras especies de *Meloidogyne*;

60 nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies de *Heterodera*; nematodos de agalla de semilla, especies de *Anguina*; nematodos de tallo y foliares, especies de *Aphelenchoides*; nematodos de aguijón, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos de pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos anulares, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*,

65

5 *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de Ditylenchus; nematodos de punzón, especies de Dolichodorus; nematodos espirales, *Helicotylenchus multincinctus* y otras especies de Helicotylenchus; nematodos de vaina y vainoides, especies de Hemicicliophora y especies de Hemicriconemoides; especies de Hirshmanniella; nematodos de lanza, especies de Hoploaimus; falsos nematodos inductores de agallas, especies de Nacobbus; nematodos de aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de Longidorus; nematodos de alfiler, especies de Paratylenchus; nematodos de lesión, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de Pratylenchus; nematodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies de Radopholus; nematodos reniformes, *Rotylenchus robustus* y otras especies de Rotylenchus; especies de Scutellonema; nematodos de raíz gruesa, *Trichodorus primitivus* y otras especies de Trichodorus, especies de Paratrichodorus; nematodos del raquitismo, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de Tylenchorhynchus; nematodos de cítricos, especies de Tylenchulus; nematodos de daga, especies de Xiphinema; y otras especies de nematodos parásitos de plantas.

15 En una realización preferente de la invención, los compuestos de fórmula I.A se usan para controlar insectos, en particular insectos de los órdenes Lepidoptera, Coleoptera, Thysanoptera y Homoptera. Los compuestos de fórmula I.A de acuerdo con la presente invención son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes Thysanoptera y Homoptera.

20 Los compuestos de fórmula formula I.A o las composiciones plaguicidas que los comprenden se pueden usar para proteger plantas o cultivos en crecimiento del ataque o infestación de plagas de invertebrados, especialmente insectos, ácaros o arácnidos por contacto de la planta/cultivo con una cantidad plaguicida eficaz de los compuestos de fórmula I.A. El término "cultivo" se refiere a cultivos tanto en crecimiento como cosechados.

Los compuestos de fórmula I.A se pueden convertir en las formulaciones habituales, por ejemplo soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos finos, polvos, pastas y gránulos. La forma de uso depende del fin particular pretendido; en cada caso, se debería asegurar una distribución fina y uniforme del compuesto de acuerdo con la invención.

25 Las formulaciones se preparan de forma conocida (véanse, por ejemplo, para revisión, los documentos de Patente US 3.060.084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, los documentos de Patente 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 & Sons, Inc., Nueva York, 1961, Hance *et al.*, Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8)), por ejemplo por extensión del compuesto activo con los auxiliares adecuados para la formulación de productos agroquímicos, tales como disolventes y/o vehículos, si se desea emulgentes, tensioactivos y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, y para la formulación de tratamiento de semillas también opcionalmente colorantes y/o aglutinantes y/o agentes gelificantes.

40 Algunos ejemplos de disolventes adecuados son agua, disolventes aromáticos (por ejemplo, productos de Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, 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 disolventes.

Algunos emulgentes adecuados son emulgentes no iónicos y aniónicos (por ejemplo éteres de polioxietileno y alcohol graso, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

45 Algunos ejemplos de dispersantes son licores residuales de lignina-sulfito y metilcelulosa.

50 Algunos tensioactivos adecuados usados son sales de metales alcalinos, metales alcalinotérreos y amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y glicol éteres sulfatados de alcoholes grasos, además condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietileno octilfenol éter, isoctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenol poliglicol éteres, tributilfenil poliglicol éter, triestearilfenil poliglicol éter, alcoholes de alquilaril poliéter, condensados de alcoholes y alcoholes grasos con óxido de etileno, aceite de ricino etoxilado, polioxietileno alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, acetal de alcohol láurico de poliglicol éter, ésteres de sorbitol, licores de desecho de lignosulfito y metilcelulosa.

55

- 5 Algunas sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleosas pulverizables directamente son las fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tales como queroseno o gasolina diésel, además aceites de alquitrán de hulla y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftaleno alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, disolventes altamente polares, por ejemplo, dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.
- También se pueden añadir a la formulación agentes anticongelantes tales como glicerina, etilenglicol, propilenglicol y bactericidas tales como.
- 10 Algunos agentes antiespumantes adecuados son, por ejemplo, agentes antiespumantes basados en silicio o estearato de magnesio.
- Un conservante adecuado es, por ejemplo, diclorofeno.
- Las formulaciones de tratamiento de semillas pueden comprender además aglutinantes y opcionalmente colorantes.
- 15 Los aglutinantes se pueden añadir para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Algunos aglutinantes adecuados son copolímeros en bloque, tensioactivos de OE/OP, pero también alcoholes polivinílicos, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas, (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos, acetatos de polivinilo, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.
- Opcionalmente, también se pueden incluir colorantes en la formulación. Algunos colorantes o tintes adecuados para formulaciones de tratamiento de semillas son rodamina B, pigmento rojo C.I. 112, disolvente rojo C.I. 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento pardo 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.
- 20
- 25 Un ejemplo de un agente gelificante es carragenano (Satiagel®).
- Los polvos, materiales para dispersión y productos espolvoreables pueden prepararse por mezcla o molienda conjunta de las sustancias activas con un vehículo sólido.
- Los gránulos, por ejemplo gránulos revestidos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, se pueden preparar por unión de los compuestos activos con vehículos sólidos.
- 30 Algunos ejemplos de vehículos sólidos son minerales tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, atapulgita, caliza, cal, creta, arcilla calcareoferruginosa, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal tales como harina de cereales, harina de corteza de árbol, polvo de madera y harina de cáscara de nuez, celulosa en polvo y otros vehículos sólidos.
- 35 En general, las formulaciones comprenden de un 0,01 a un 95 % en peso, preferentemente de un 0,1 a un 90 % en peso, del compuesto o compuestos activos. En este caso, el compuesto o compuestos activos se emplean con una pureza de un 90 % a un 100 % en peso, preferentemente de un 95 % a un 100 % en peso (de acuerdo con el espectro de RMN).
- 40 Con fines de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas se pueden diluir de 2 a 10 veces, lo que conduce a concentraciones en las preparaciones listas para usar de un 0,01 a un 60 % en peso de compuesto activo, preferentemente de un 0,1 a un 40 % en peso.
- 45 Los compuestos de fórmula I'.A se pueden usar como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de los mismos, por ejemplo en forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones pulverizables directamente, emulsiones, dispersiones de aceite, pastas, productos espolvoreables, materiales o gránulos para dispersar, mediante pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión o vertido. Las formas de uso dependen enteramente de los fines pretendidos; se pretende asegurar en cada caso la distribución más fina posible del compuesto o compuestos activos de acuerdo con la invención.
- 50 Las formas de uso acuosas se pueden preparar a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humedecibles (polvos pulverizables, dispersiones de aceite) por adición de agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones de aceite, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o disolvente, se pueden homogeneizar en agua por

medio de un agente humectante, adhesivo, dispersante o emulgente. Sin embargo, también es posible preparar concentrados compuestos por una sustancia activa, agente humectante, adhesivo, dispersante o emulgente y, si fuera apropiado, disolvente o aceite, y tales concentrados son adecuados para dilución con agua.

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

El compuesto o compuestos activos también se pueden usar con éxito en procesos de volumen ultrabajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más de un 95 % en peso de compuesto activo, o incluso aplicar el compuesto activo sin aditivos.

Los siguientes son ejemplos de formulaciones:

10 1. Productos para dilución con agua para aplicaciones foliares. Con fines de tratamiento de semillas, tales productos se pueden aplicar a la semilla diluidos o sin diluir.

A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

15 Se disuelven 10 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 90 partes en peso de agua o un disolvente soluble en agua. Alternativamente, se añaden agentes humectantes u otros auxiliares. El compuesto o compuestos activos se disuelven tras dilución con agua, mediante lo que se obtiene una formulación con un 10 % (p/p) del compuesto o compuestos activos.

B) Concentrados dispersables (DC)

20 Se disuelven 20 partes en peso del compuesto o compuestos activos 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 lo que se obtiene una formulación con un 20 % (p/p) del compuesto o compuestos activos.

C) Concentrados emulsionables (EC)

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

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

30 Se disuelven 25 partes en peso del compuesto o compuestos activos en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina de preparar emulsiones (por ejemplo, Ultraturax) y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, mediante lo que se obtiene una formulación con un 25 % (p/p) del compuesto o compuestos activos.

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

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

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

40 Se muelen finamente 50 partes en peso del compuesto o compuestos activos con adición de 50 partes en peso de dispersantes y agentes humectantes y se preparan en forma de gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de aparatos técnicos (por ejemplo extrusión, torre de pulverización, lecho fluido). La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto o compuestos activos, mediante lo que se obtiene una formulación con un 50 % (p/p) del compuesto o compuestos activos.

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

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

H) Formulación de gel (GF)

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

2. Productos para aplicarse sin diluir para aplicaciones foliares. Con fines de tratamiento de semillas, tales productos se pueden aplicar a la semilla diluidos o sin diluir.

I) Polvos espolvoreables (DP, DS)

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

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

20 Se muelen finamente 0,5 partes en peso del compuesto o compuestos activos y se asocian con 95,5 partes en peso de vehículos, mediante lo que se obtiene una formulación con un 0,5 % (p/p) del compuesto o compuestos activos. Los métodos actuales son extrusión, secado por pulverización o lecho fluido. Esto da gránulos que se aplican sin diluir para uso foliar.

K) Soluciones ULV (UL)

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

30 Los compuestos de fórmula I'.A también son adecuados para el tratamiento de materiales de propagación de plantas (tales como una semilla). Algunas formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación de gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a la semilla diluidas o sin diluir. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de pregerminar las últimas.

35 En una realización preferente, se usa una formulación FS para el tratamiento de semillas. Por lo general, una formulación FS puede comprender de 1 a 800 g/l de ingrediente activo, de 1 a 200 g/l de tensioactivo, de 0 a 200 g/l de agente anticongelante, de 0 a 400 g/l de aglutinante, de 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un disolvente, preferentemente agua.

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

45 Se pueden añadir diversos tipos de aceites, agentes humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros plaguicidas, o bactericidas a los ingredientes activos, si fuera apropiado inmediatamente antes de su uso (mezcla en tanque). Estos agentes se mezclan habitualmente con los agentes de acuerdo con la invención en una proporción en peso de 1:10 a 10:1.

Los compuestos de fórmula I'.A son eficaces tanto por contacto (a través de suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, partes de la planta o partes del animal) como por ingestión (cebo o parte de la planta).

Para uso frente a hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas, los compuestos de fórmula I'.A se usan preferentemente en una composición de cebo.

5 El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos se pueden conformar en diversas conformaciones y formas adecuadas para la aplicación respectiva, por ejemplo, gránulos, bloques, barras, discos. Se pueden llenar con cebos líquidos diversos dispositivos para asegurar una aplicación apropiada, por ejemplo envases abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de goteo o fuentes de evaporación. Los geles se pueden basar en matrices acuosas u aceitosas y se pueden formular según necesidades particulares en términos de adherencia, retención de humedad o características de envejecimiento.

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

Las formulaciones de los compuestos de fórmula I'.A en forma de aerosoles (por ejemplo, en botes pulverizadores), pulverizadores de aceite o pulverizadores de bomba son altamente deseables para el usuario no profesional para  
20 controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosol están compuestas preferentemente por el compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona), hidrocarburos de parafina (por ejemplo, querosenos) que tienen intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250 °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua y además auxiliares  
25 tales como emulgentes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene de 3 a 7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites perfumados tales como aceites de éter, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, si fuera apropiado estabilizantes tales como benzoato sódico, tensioactivos anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si fuera necesario, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso o las mezclas de  
30 estos gases.

Las formulaciones de pulverización de aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se usa ningún propelente.

Los compuestos de fórmula I'.A y sus respectivas composiciones también se pueden usar en bobinas para mosquitos y fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles para polillas, pastillas para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

35 Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática, y leishmaniasis) con compuestos de fórmula I'.A y sus respectivas composiciones también comprenden tratar superficies de cabañas y casas, pulverización del aire e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestir, mosquiteras, trampas para mosca tsé tsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, tela, artículos tejidos, no tejidos, material o láminas de malla y toldos comprenden  
40 preferentemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Algunos repelentes adecuados son, por ejemplo N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, lactona del ácido (2-hidroximetilciclohexil)acético, 2-etil-1,3-hexandiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no usado para control de insectos tal como {(+/-)-3-ailil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (esbiotrina), un repelente derivado de o idéntico a extractos de  
45 plantas tales como limoneno, eugenol, (+)-eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos de plantas en bruto de plantas tales como *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Cymbopogon martinii*, *Cymbopogon citratus* (hierba de limón), *Cymopogan nardus* (citronella). Algunos aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, entre polímeros y copolímeros de ésteres de vinilo de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo y acrilato de metilo,  
50 hidrocarburos mono y dietilénicamente insaturados, tales como estireno, y dienos alifáticos, tales como butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteras se realiza en general por inmersión del material textil en emulsiones o dispersiones de los compuestos activos de fórmula I'.A o pulverización de los mismos sobre las mosquiteras.

Los métodos que se pueden emplear para el material de propagación de plantas, en particular las semillas son, en principio, todas las técnicas de tratamiento de semillas adecuadas y especialmente de desinfección de semillas  
55 conocidas en la materia, tales como revestimiento de semillas (por ejemplo, peletización de semillas), espolvoreo de semillas y embebido de semillas (por ejemplo, empapado de semillas). Aquí, "tratamiento de semillas" se refiere a



5 todos los métodos que ponen en contacto entre sí material de propagación de plantas, en particular semillas, y los compuestos de fórmula I'.A, y "desinfección de semillas" a métodos de tratamiento de semillas que proporcionan las semillas con una cantidad de los compuestos de fórmula I'.A, o una sal del mismo, un N-óxido del mismo o una sal de un N-óxido del mismo, es decir, que generan un material de propagación de plantas, en particular de la semilla, que comprende el compuesto de fórmula I'.A, o una sal del mismo, un N-óxido del mismo o una sal de un N-óxido del mismo. En principio, el tratamiento se puede aplicar al material de propagación de plantas, en particular a la semilla, en cualquier momento desde la recolección del material de propagación de plantas, en particular de la semilla, hasta la siembra del material de propagación de plantas, en particular de la semilla. El material de propagación de plantas, en particular la semilla, se puede tratar inmediatamente antes, o durante, la plantación del material de propagación de plantas, en particular de la semilla, por ejemplo usando el método de "maceta". Sin embargo, el tratamiento también se puede llevar a cabo varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de desinfección de semilla, sin observarse una reducción considerable de la eficacia.

15 De forma conveniente, el tratamiento se aplica a material de propagación de plantas sin sembrar, en particular a semilla sin sembrar. Como se usa en el presente documento, la expresión "semillas sin sembrar" pretende incluir una semilla en cualquier período desde la recolección de la semilla hasta la siembra de la semilla en el suelo con fines de germinación y crecimiento de la planta.

20 Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento en el que el material de propagación de plantas, en particular la semilla, se mezcla, en un dispositivo adecuado, por ejemplo un dispositivo de mezcla para la mezcla sólida o sólida/líquida de compañeros, con la cantidad deseada de formulaciones de tratamiento de semillas, como tales o después de dilución previa con agua, hasta que la composición se distribuye uniformemente sobre la semilla. Si fuera apropiado, esto va seguido de una etapa de secado.

Los compuestos de fórmula I'.A o los enantiómeros o las sales veterinariamente aceptables de los mismos también son adecuados, en particular, para usarse para combatir parásitos en animales.

25 Por lo tanto, un objetivo adicional de la presente invención es proporcionar nuevos métodos para controlar parásitos en animales (ectoparásitos). Otro objetivo de la invención es proporcionar plaguicidas más seguros para animales. Otro objetivo de la invención es además proporcionar plaguicidas para animales que se puedan usar en dosis menores que los plaguicidas existentes. Y otro objetivo de la invención es proporcionar plaguicidas para animales, que proporcionen un control residual prolongado de los parásitos.

30 La invención también se refiere a composiciones que contienen una cantidad parasiticida eficaz de los compuestos de fórmula I'.A o los enantiómeros o las sales veterinariamente aceptables de los mismos y un vehículo aceptable, para combatir parásitos en animales.

35 La presente invención también proporciona un método no terapéutico para tratar, controlar, prevenir y proteger animales frente a la infestación e infección mediante ectoparásitos, que comprende aplicar a un lugar una cantidad parasiticida eficaz que un compuesto de fórmula I'.A o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composición que lo comprenda.

40 La presente invención también proporciona un método para tratar, controlar, prevenir y proteger animales frente a la infestación e infección mediante ectoparásitos, que comprende administrar por vía oral, tópica o parenteral o aplicar a los animales una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de fórmula I'.A o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos o una composición que lo comprenda.

45 La invención también proporciona un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales frente a la infestación o infección mediante ectoparásitos que comprende incluir una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de fórmula I'.A o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos en una composición que comprende para tratar, controlar, prevenir o proteger animales frente a la infestación o infección mediante dichos parásitos.

La invención se refiere además al uso de los compuestos de fórmula I para tratar, controlar, prevenir o proteger animales frente a la infestación o infección mediante ectoparásitos.

50 La invención se refiere también al uso de un compuesto de fórmula I'.A, o una composición que lo comprende, para la fabricación de un medicamento para el tratamiento terapéutico de animales frente a infecciones o infestaciones mediante ectoparásitos.

La actividad de los compuestos frente a plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de ectoparásitos en y sobre animales, que requiere, por ejemplo, dosificaciones bajas no eméticas en el caso de aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad, y manipulación segura.

Sorprendentemente, se ha descubierto que los compuestos de fórmula I'.A, sus sales y sus N-óxidos, son adecuados para combatir ectoparásitos en y sobre animales.

5 Los compuestos de fórmula I'.A o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables o N-óxidos de los mismos y las composiciones que los comprenden se usan preferentemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones de animales que incluyen animales de sangre caliente (incluyendo seres humanos). Por ejemplo, son adecuados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado, ovejas, cerdos, camellos, venados, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, burros, gamos y renos, y también en animales de peletería tales como visón, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos.

10 Los compuestos de fórmula I'.A o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y las composiciones que los comprenden se usan preferentemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

15 Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos mordedores, garrapatas, estros nasales, moscas malófagas, moscas mordedoras, moscas muscoides, moscas, larvas de mosca miasítica, chinches, jejenes, mosquitos y pulgas.

Los compuestos de fórmula I'.A o los enantiómeros o sales veterinariamente aceptables de los mismos y las composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y no sistémico de ectoparásitos. Son agentes activos frente a la totalidad o algunos estadios de desarrollo.

20 Los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, sus N-óxidos y las sales de sus N-óxidos son especialmente útiles para combatir ectoparásitos, en particular ectoparásitos insectos.

Los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, sus N-óxidos y las sales de 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*,

25 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 antropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonina* 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*,

40 piojos (Phthiraptera), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurytarnus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*,

45 garrapatas y ácaros parásitos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo *Ixodes scapularis*, *Ixodes holociclus*, *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*,

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.,

50 chinches (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* ssp., *Panstrongylus* ssp. y *Arlus critatus*,

anopluros, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., y *Solenopotes* spp,

malófagos (subórdenes *Armblycerina* e *Ischnocerina*), por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp.

5 Los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, sus N-óxidos y las sales de sus N-óxidos y las composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes *Diptera*, *Siphonaptera* e *Ixodida*.

Además, es especialmente preferente el uso de la fórmula I'.A, sus sales, sus N-óxidos y las sales de sus N-óxidos y las composiciones que los contienen para combatir mosquitos.

El uso de los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, sus N-óxidos y las sales de sus N-óxidos y las composiciones que los contienen para combatir moscas es una realización preferente adicional de la presente invención.

10 Además, es especialmente preferente el uso de los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, sus N-óxidos y las sales de sus N-óxidos y las composiciones que los contienen para combatir pulgas.

El uso de los compuestos de fórmula formula I'.A, sus sales, sus N-óxidos y las sales de sus N-óxidos y las composiciones que los contienen para combatir garrapatas es una realización preferente adicional de la presente invención.

15 Los compuestos de fórmula I'.A pueden ser eficaces tanto por contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, mantas o partes del animal) como por ingestión (por ejemplo, cebos).

La presente invención se refiere al uso terapéutico y no terapéutico de los compuestos de fórmula I'.A para controlar y/o combatir parásitos en y/o sobre animales.

20 Los compuestos de fórmula I'.A se pueden usar para proteger a los animales del ataque o la infestación mediante parásitos poniéndolos en contacto con una cantidad parasitaria eficaz de los compuestos de fórmula I'.A. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre el parásito, por ejemplo también en su sitio, y opcionalmente también administrar los compuestos/composiciones directamente sobre el animal) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones en el sitio del parásito). El contacto del parásito a través de la aplicación en su sitio es un ejemplo de un uso no terapéutico de los  
25 compuestos de fórmula I'.A.

"Sitio", como se ha definido anteriormente, significa el hábitat, suministro de alimento, criadero, área, material o entorno en el que crece o puede crecer un parásito fuera del animal. Los compuestos de la invención también se pueden aplicar de forma preventiva a los lugares en los que se espera la aparición de las plagas o parásitos.

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

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

35 Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de fórmula I'.A se pueden formular en forma de alimentos para animales, premezclas de alimentos para animales, concentrados de alimentos para animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pócimas, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de fórmula I'.A se pueden administrar a los animales en el agua que beben. Para la administración oral, la forma de dosificación elegida debería proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I'.A, preferentemente de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

40 Alternativamente, los compuestos de fórmula I'.A se pueden administrar a los animales por vía parenteral, por ejemplo, mediante inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmula I'.A se pueden dispersar o disolver en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de fórmula I'.A se pueden formular en un implante para administración subcutánea. Además, los compuestos de fórmula I'.A se pueden administrar por vía transdérmica a los animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación elegida debería proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a  
45 100 mg/kg de peso corporal del animal por día de los compuestos de fórmula I'.A.

Los compuestos de de fórmula I'.A también se pueden aplicar por vía tópica a los animales en forma de baños, polvos finos, polvos, collares, medallones, pulverizadores, champús, formulaciones de tratamiento por aplicación y lavado puntuales y en pomadas o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, los baños

y pulverizaciones contienen habitualmente de 0,5 ppm a 5000 ppm y preferentemente de 1 ppm a 3000 ppm de los compuestos de fórmula I'.A. Además, los compuestos de fórmula I'.A se pueden formular en forma de marcas auriculares para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado y ovejas.

Algunas preparaciones adecuadas son:

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

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

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

- 10 preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, microgránulos, comprimidos, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalaciones, y artículos conformados que contienen el compuesto activo.

Las composiciones adecuadas para inyección se preparan por disolución del ingrediente activo en un disolvente adecuado y opcionalmente adición de ingredientes adicionales tales como ácidos, bases, sales tampón, conservantes, solubilizantes. Las soluciones se filtran y se llenan estériles.

- 15 Los disolventes adecuados son disolventes fisiológicamente tolerables tales como agua, alcoholes tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, y las mezclas de los mismos.

Los compuestos activos se pueden disolver opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables que son adecuados para inyección.

- 20 Los solubilizantes adecuados son disolventes que estimulan la disolución del compuesto activo en el disolvente principal o evitan su precipitación. Algunos ejemplos son polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite de ricino polioxietilado, y éster de sorbitán polioxietilado. Algunos conservantes adecuados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico, y n-butanol.

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

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

- 30 Las soluciones para su uso sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo con lo que se ha descrito anteriormente para las soluciones para inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.

Otros disolventes adecuados son polipropilenglicol, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicol alquil éter, por ejemplo dipropilenglicol monometil éter, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcitol, solcetal, carbonato de propileno, y las mezclas de los mismos.

- 35 Puede ser ventajoso añadir espesantes durante la preparación. Algunos 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.

- 40 Los geles se aplican a o se extienden sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan por tratamiento de soluciones que se han preparado como se ha descrito en el caso de las soluciones para inyección con suficiente espesante, lo que da como resultado un material transparente que tiene una consistencia de tipo pomada. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.

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

- 45 Las formulaciones de tratamiento por lavado se preparan por disolución, suspensión o emulsión del compuesto activo en disolventes o mezclas de disolventes compatibles con la piel adecuados. Si fuera apropiado, se añaden otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, fotoestabilizadores y

adhesivos.

5 Algunos disolventes 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 alquilenglicol alquil éteres tales como dipropilenglicol monometil éter, dietilenglicol monobutil 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 N-metilpirrolidona, N-butilpirrolidona o N-octilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oximetilen-1,3-dioxolano y glicerol formal.

10 Algunos colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para su uso en animales y que se puedan disolver o suspender.

Algunas sustancias promotoras de la absorción son, por ejemplo, DMSO, aceites de extensión 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.

15 Algunos antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito potásico, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

Algunos fotoestabilizadores adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

Algunos adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliácridatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatina.

Las emulsiones se pueden administrar por vía oral, dérmica o en forma de inyecciones.

20 Las emulsiones son de tipo agua en aceite o de tipo aceite en agua.

Se preparan por disolución del compuesto activo en la fase hidrófoba o en la fase hidrófila y homogenización de esto con el disolvente de la otra fase con la ayuda de emulgentes adecuados y, si fuera apropiado, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizadores, sustancias potenciadoras de la viscosidad.

25 Algunas fases hidrófobas (aceites) adecuadas son:

30 parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendra, aceite de ricino, triglicéridos sintéticos tales como diglicérido caprílico/cáprico, mezclas de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de longitud de cadena C<sub>8</sub>-C<sub>12</sub> u otros ácidos grasos naturales seleccionados especialmente, mezclas de glicéridos parciales de ácidos grasos saturados o insaturados que también contienen posiblemente grupos hidroxilo, mono y diglicéridos de ácidos grasos C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>, ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, pelargonato de dipropilenglicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C<sub>16</sub>-C<sub>18</sub>, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>, estearato de isopropilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos céreos tales como grasa sintética de gándula uropígea de pato, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo y mezclas de ésteres relacionados con los últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleílico y ácidos grasos tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

35 Algunas fases hidrófilas adecuadas son: agua, alcoholes tales como propilenglicol, glicerol, sorbitol y las mezclas de los mismos.

40 Algunos emulgentes adecuados son:

45 tensioactivos no iónicos, por ejemplo aceite de ricino polietoxilado, monooleato de sorbitán polietoxilado, monoestearato de sorbitán, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol éter; tensioactivos anfífilos tales como N-lauril-p-iminodipropionato de sodio o lecitina; tensioactivos aniónicos, tales como lauril sulfato sódico, sulfatos de alcohol graso éter, sal de monoetanolamina de éster de ácido mono/dialquil poliglicol éter ortofosfórico;

tensioactivos catiónicos, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

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

- 5 Las suspensiones se pueden administrar por vía oral o tópica/dérmica. Se preparan por suspensión del compuesto activo en un agente de suspensión, si fuera apropiado con adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizadores.

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

- 10 Algunos agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulgentes dados anteriormente.

Otros auxiliares que se pueden mencionar son los dados anteriormente.

Las preparaciones semisólidas se puede administrar por vía oral o tópica/dérmica. Difieren de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente únicamente en su mayor viscosidad.

- 15 Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si fuera apropiado con adición de auxiliares, y se conforma en la forma deseada.

Los excipientes adecuados son todas sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Los que se usan son sustancias inorgánicas y orgánicas. Algunas sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro sódico, carbonatos tales como carbonato de calcio, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice precipitado coloidal, o fosfatos. Algunas sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, comestibles y alimentos tales como leche en polvo, harina animal, harinas de grano y grano triturado, almidones.

- 20 Algunos auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes, y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

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

- 25 En general, "cantidad parasiticida eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesario para conseguir un efecto observable en el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y retirada, destrucción, o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad parasiticida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. La cantidad parasiticida eficaz de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones reinantes tales como efecto y duración parasiticida deseados, especie diana, modo de aplicación, y similares.

Las composiciones que se pueden usar en la invención pueden comprender generalmente de aproximadamente un 0,001 a un 95 % del compuesto de fórmula I'.A.

- 35 Generalmente, es favorable aplicar los compuestos de fórmula I'.A en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferentemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

Las preparaciones listas para uso contienen los compuestos que actúan frente a parásitos, preferentemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a un 80 por ciento en peso, preferentemente de un 0,1 a un 65 por ciento en peso, más preferentemente de un 1 a un 50 por ciento en peso, lo más preferentemente de un 5 a un 40 por ciento en peso.

- 40 Las preparaciones que se diluyen antes de su uso contienen los compuestos que actúan frente a ectoparásitos en concentraciones de un 0,5 a un 90 por ciento en peso, preferentemente de un 1 a un 50 por ciento en peso.

Además, las preparaciones comprenden los compuestos de fórmula I'.A frente a endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a un 2 por ciento en peso, preferentemente de un 0,05 a un 0,9 por ciento en peso, de forma muy particularmente preferente de un 0,005 a un 0,25 por ciento en peso.

- 45 En una realización preferente de la presente invención, las composiciones que comprenden los compuestos de fórmula I'.A se aplican por vía dérmica/tópica.

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

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

10 Para la preparación de los artículos conformados, se usan plásticos termoplásticos y flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Algunos 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 fórmula I'.A. Se da una lista detallada de plásticos y elastómeros, así como de los procedimientos de preparación para las partículas conformadas, por ejemplo, en el documento de Patente WO 03/086075.

15 Las composiciones que se usan de acuerdo con la presente invención también pueden contener otros ingredientes activos, por ejemplo otros plaguicidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros plaguicidas, o bactericidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de las plantas, protectores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales se pueden usar secuencialmente o en combinación con las composiciones descritas anteriormente, y si fuera apropiado también se añaden inmediatamente antes de su uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, la planta o plantas se pueden pulverizar con una composición de la presente invención ya sea antes o después de tratarse con otros ingredientes activos.

20 Estos agentes se puede mezclar con los agentes usados de acuerdo con la invención en una proporción en peso de 1:10 a 10:1. La mezcla de los compuestos de fórmula I'.A o las composiciones que los comprenden en la forma de uso como plaguicidas con otros plaguicidas da como resultado frecuentemente un espectro de acción plaguicidas más amplio.

25 La siguiente lista M de plaguicidas junto con los que se pueden usar los compuestos de fórmula I'.A de la invención y con los que se podrían producir efectos sinérgicos potenciales, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no imponer ninguna limitación:

30 M.1. Organo(tio)fosfatos: acefato, azamethifós, azinfós-etilo, azinfós-metilo, cloretoxifós, clorfenvinfós, clormefós, clorpirifós, clorpirifós-metilo, cumafós, cianofós, demetón-S-metilo, diazinón, diclorvós/ DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, disulfotón, EPN, etión, etoprofós, famfur, fenamifós, fenitrotión, fentiión, flupirazofós, fostiazato, heptenofós, isoxatiión, malatiión, mecarbam, metamidofós, metidatiión, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratiión, paratiión-metilo, fentoato, forato, fosalono, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifós-metilo, profenofós, propetamfós, protiofós, piraclorofós, piridafentiión, quinalfós, sulfotep, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometón, triazofós, triclorfón, vamidotión;

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

40 M.3. Piretroides: acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofén, teflutrina, tetrametrina, tralometrina y transflutrina;

M.4. Miméticos de hormonas juveniles: hidropreno, quinopreno, metopreno, fenoxicarb y piriproxifén;

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

M.6. Compuestos antagonistas de los canales de cloruro activados por GABA: clordano, endosulfán, gamma-HCH (lindano); etiprol, fipronil, pirafuprol y piriprol;

M.7. Activadores de los canales de cloruro: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina;

50 M.8. Compuestos METI I: fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifén, piridabén, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, rotenona;

- M.9. Compuestos METI II y III: acequinocil, fluaciprim, hidrametilnón;
- M.10. Desacopladores de la fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;
- M.11. Inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotina, cihexatina, diafentiurón, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifón;
- 5 M.12. Alteradores de la muda: ciromazina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida;
- M.13. Sinergistas: butóxido de piperonilo, tribufós;
- M.14. Compuestos bloqueadores de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;
- M.15. Fumigadores: bromuro de metilo, fluoruro de cloropicrina sulfurilo;
- M.16. Bloqueantes selectivos de alimentación: crilotia, pimetrozina, flonicamid;
- 10 M.17. Inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, hexitiazox, etoxazol;
- M.18. Inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezina, bistriflurón, clorfluzaurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón;
- M.19. Inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofén, espiromesifén, espirotetramat;
- M.20. Agonistas octopaminérgicos: amitraz;
- 15 M.21. Moduladores de receptor de rianodina: flubendiamida y (R)- y (S)-3-cloro-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida (M21.1);
- M.22. Varios: fosforo de aluminio, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bórax, bromopropilato, cianuro, cienopirafén, ciflumetofén, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridalilo, pirifluquinazón, azufre, compuestos de azufre orgánico, tartrato de antimonio y potasio, sulfoxaflor, 4-but-2-iniloxi-6-(3,5-dimetil-piperidin-1-il)-2-fluoro-pirimidina (M22.1), 3-benzoilamino-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-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-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-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(tetrahidro-furan-2-ilmetil)-benzamida (M22.6), 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.7), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.8), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazolo-5-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.9), 4-[[[(6-cloro-pirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.10), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.11), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.12), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.13), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.14), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.15), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.16), éster de 1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[[(2-ciclopropilacetil)oxil]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-diilo] del ácido ciclopropanoacético (M22.17), 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-metil-fenoxi)-3-(6-metil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (M22.18),
- 20
- 25
- 30
- 35
- M.23. N-R'-2,2-dihalo-1-R" ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)-hidrazona, en las que R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R" es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo;
- M.24. Antranilamidas: clorantraniliprol, ciantraniliprol, [4-ciano-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-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);
- 40
- 45



M.25. Compuestos de malononitrilo:  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ , (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)malononitrilo),  $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$  (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)-malonodinitrilo);

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

Los compuestos disponibles en el mercado del grupo M se pueden encontrar en "The Pesticide Manual", 13ª edición, British Crop Protection Council (2003) entre otras publicaciones.

10 Las tioamidas de fórmula M6.1 y su preparación se han descrito en el documento de Patente WO 98/28279. La lepimectina se conoce de Agro Project, PJB Publications Ltd, noviembre de 2004. Benclotiaz y su preparación se han descrito el documento de Patente EP-A1 454621. Metidatió y Paraoxón y su preparación se han descrito en Farm Chemicals Handbook, Volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. Acetoprol y su preparación se han descrito en el documento de Patente WO 98/28277. Metaflumizone y su preparación se han descrito en el documento de Patente EP-A1 462 456. Flupirazofós se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988, p. 237-243 y en el documento de Patente US 4822779. Pirafluprol y su preparación se han descrito en los documentos de Patente JP 2002193709 y WO 01/00614. Piriprol y su preparación se han descrito en los documentos de Patente WO 98/45274 y US 6335357. Amidoflumet y su preparación se han descrito en los documentos de Patente US 6221890 y JP 21010907. Flufenerim y su preparación se han descrito en los documentos de Patente WO 03/007717 y WO 03/007718. AKD 1022 y su preparación se han descrito en el documento de Patente US 6300348. Clorantraniliprol se ha descrito en los documentos de Patente WO 01/70671, WO 03/015519 y WO 05/118552. Ciantraniliprol se ha descrito en los documentos de Patente WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. Las antranilamidas M 24.1 a M 24.6 se han descrito en los documentos de Patente WO 2008/72743 y WO 200872783. La ftalamida M 21.1 se conoce del documento de Patente WO 2007/101540. Ciflumetofén y su preparación se han descrito en el documento de Patente WO 04/080180. El compuesto de aminoquinazolinona pirifluquinazón se ha descrito en el documento de Patente EP A 109 7932. La sulfoximina sulfoxaflor se ha descrito en los documentos de Patente WO 2006/060029 y WO 2007/149134. El compuesto de alquinil éter M22.1 se describe, por ejemplo, en el documento de Patente JP 2006131529. Los compuestos de azufre orgánico se han descrito en el documento de Patente WO 2007060839. El compuesto de carboxamida M 22.2 se conoce el documento de Patente WO 2007/83394. Los compuestos de oxazolina M 22.3 a M 22.6 se han descrito en el documento de Patente WO 2007/074789. Los compuestos de furanona M 22.7 a M 22.16 se han descrito, por ejemplo, en el documento de Patente WO 2007/115644. El derivado de piripiropeno M 22.17 se ha descrito en los documentos de Patente WO 2008/66153 y WO 2008/108491. El compuesto de piridazina M 22.18 se ha descrito en el documento de Patente JP 2008/115155. Los compuestos de malononitrilo se han descrito en los documentos de Patente WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694.

35 Algunos compañeros de mezcla fungicidas son, en particular, los seleccionados entre el grupo que consiste en acilalaninas tales como benalaxil, metalaxil, ofurace, oxadixil, derivados de amina tales como aldiform, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina, tridemorf, anilino pirimidinas tales como pirimetanil, mepanipirim o cirodinil, antibióticos tales como cicloheximida, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomina, azoles tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalil, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefón, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol, dicarboximidias tales como iprodión, miclozolina, procimidón, vinclozolina, ditiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, polycarbamato, tiram, ziram, zineb, 45 compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomil, boscalida, carbendazim, carboxina, oxicarboxina, ciazofamida, dazomet, ditianón, famoxadón, fenamidón, fenarimol, fuberidazol, flutolanil, furametpir, isoprotilano, mepronil, nuarimol, probenazol, proquinazida, pirifenox, piroquilón, quinoxifen, siltiofam, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiadinil, triciclazol, triforina, fungicidas de cobre tales como mezcla de Burdeos, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato básico de cobre, 50 derivados de nitrofenilo tales como binapacril, dinocap, dinobuton, nitroftalisopropil, fenilpirroles tales como fenpiclonil o fludioxonil, azufre, otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamida, clorotalonil, ciflufenamida, cimoxanil, diclomezin, diclocimet, dietofencarb, edifenfós, etaboxam, fenhexamida, acetato de fentina, fenoxanil, ferimzona, 55 fluazinam, fosetil, fosetil-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenón, pencicurón, propamocarb, ftalida, toloclofós-metilo, quintozeno, zoxamida, estrobilurinas tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina o trifloxistrobina, derivados de ácido sulfénico tales como captafol, captán, diclofluanida, folpet, toliifluanida, cinamamidas y análogos 60 tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

5 La plaga de invertebrados, es decir, artrópodos y nematodos, la planta, suelo o agua en los que la planta crece se pueden poner en contacto con el compuesto o compuestos de fórmula I'.A o la composición o composiciones que los contienen mediante cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente a la plaga de invertebrados o planta - por lo general a las hojas, tallos o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al sitio de la plaga de invertebrados o planta).

10 Además, las plagas de invertebrados se pueden controlar poniendo en contacto la plaga la diana, su fuente de alimento, hábitat, criadero o su sitio con una cantidad plaguicida eficaz de los compuestos de fórmula I'.A, una sal de los mismos, un N-óxido de los mismos o una sal de un N-óxido de los mismos. Como tal, la aplicación se puede llevar a cabo antes o después de la infección del sitio, cultivos en crecimiento, o cultivos cosechados por la plaga.

"Sitio" significa un hábitat, criadero, plantas cultivadas, material de propagación de plantas (tal como una semilla), suelo, área, material o entorno en el que una plaga o parásito crece o puede crecer.

15 En general, "cantidad plaguicida eficaz" significa la cantidad de ingrediente activo necesario para conseguir un efecto observable en el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y retirada, destrucción o disminución de otro modo de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad plaguicida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. La cantidad plaguicida eficaz de las composiciones variará de acuerdo con las condiciones reinantes tales como el efecto y duración plaguicidas deseados, clima, especie diana, sitio, modo de aplicación, y similares.

20 Los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, el N-óxido de los mismos y las sales del N-óxido de los mismos y las composiciones que comprenden dichos compuestos se pueden usar para proteger materiales de madera tales como árboles, vallas de madera, traviesas, etc. y edificios tales como casas, edificios anexos, fábricas, pero también materiales de construcción, mobiliario, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc. de hormigas y/o termitas, y para controlar que hormigas y termitas no dañen cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos se aplican no solo a la superficie del suelo circundante o al suelo bajo tierra con el fin de proteger materiales de madera, sino que también se pueden aplicar a artículos de serrería tales como superficies de hormigón bajo el suelo, postes de nicho, vigas, contrachapado, mobiliario, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, medios tableros, etc. y artículos de vinilo tales como alambres eléctricos revestidos, láminas de vinilo, material aislante térmico tal como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación frente a hormigas que dañan cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de hormigas o similar.

Los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, el N-óxido de los mismos y las sales del N-óxido de los mismos también se pueden aplicar preventivamente a los lugares en los que se espera la aparición de las plagas.

35 Los compuestos de fórmula I'.A, sus sales, el N-óxido de los mismos y las sales del N-óxido de los mismos también se pueden usar para proteger plantas en crecimiento del ataque o la infestación de plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad plaguicida eficaz de los compuestos de fórmula I'.A, una sal de los mismos, un N-óxido de los mismos o una sal de un N-óxido de los mismos. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente a la plaga y/o planta - por lo general a las hojas, tallos o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al sitio de la plaga y/o planta).

40 En el caso de tratamiento de suelo o de aplicación al lugar o nido de residencia de las plagas, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m<sup>2</sup>, preferentemente de 0,001 a 20 g por 100 m<sup>2</sup>.

Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m<sup>2</sup> de material tratado, de forma deseable de 0,1 g a 50 g por m<sup>2</sup>.

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

Para su uso en composiciones de cebo, el contenido habitual de ingrediente activo es de un 0,001 % en peso a un 15 % en peso, de forma deseable de un 0,001 % en peso a un 5 % en peso de compuesto activo.

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

Para su uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de la presente invención puede estar en el intervalo de 0,1 g a 4000 g por hectárea, de forma deseable de 25 g a 600 g por

hectárea, de forma más deseable de 50 g a 500 g por hectárea.

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

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

### I. Ejemplos de preparación

Los procedimientos descritos en los siguientes ejemplos de preparación se usaron para preparar compuestos adicionales de fórmula I'.A mediante la modificación apropiada de los materiales de partida. Los compuestos resultantes, junto con los datos físicos, se enumeran en la tabla C posterior.

10 Los productos se caracterizaron mediante HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento, espectrometría de masas). La HPLC se llevó a cabo usando una columna analítica RP-18 (Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania) que se operó a 40 °C. Acetonitrilo con un 0,1 % en volumen de una mezcla de ácido trifluoroacético/agua y un 0,1 % en volumen de ácido trifluoroacético sirvieron como fase móvil; caudal: 1,8 ml/min y volumen de inyección: 2 µl. La espectrometría de masas se puede llevar a cabo usando un espectrómetro de masas cuadrupolar con ionización por electronebulización a 80 V en modo positivo.

#### Ejemplo 1: piridazin-4-il metil amida del ácido 2-Ciclopropil-4-metil-pirimidina-5-carboxílico

Se disolvió ácido 2-ciclopropil-4-metil-pirimidina-5-carboxílico (200 mg, 1,12 mmol) en diclorometano anhidro (20 ml). Se añadieron secuencialmente 4-*N,N*-dimetilaminopiridina (23 mg, 0,2 mmol) y *N,N*-diisopropil carbodiimida (0,17 ml, 1,12 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Se disolvió *N*-metilaminopiridazina (147 mg, 1,35 mmol) en diclorometano anhidro (5 ml) y se añadió junto con piridina (0,35 ml, 1,12 mmol) a la mezcla de reacción. La agitación a temperatura ambiente se continuó durante 15 horas. El progreso de la reacción se controló por cromatografía en capa fina (diclorometano/metanol 9:1). La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano (50 ml), se lavó dos veces con agua destilada (5 ml cada vez). La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico y el disolvente orgánico se evaporó al vacío. El producto en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida (diclorometano/metanol, gradiente: 100/0 a 90/10 (v/v), duración: 50 min). El compuesto del título se aisló en forma de un aceite parduzco (119 mg, rendimiento: 39 %, pureza: 95 %). HPLC-MS: tiempo de retención: 1,752 min,  $[M^+ + 1] = 270,1$ .

Los compuestos de la siguiente fórmula I'.Aa, que se prepararon de acuerdo con el método mencionado anteriormente, junto con sus datos fisicoquímicos se recopilan en la siguiente tabla C (Ejemplos 1 a 72). En cada caso,  $R^{1'}$  y  $A'$  tienen los significados dados en la línea correspondiente de la tabla C. Los compuestos de los Ejemplos 1-3, 5, 7-36, 38, 39, 41-55, 59 y 62-72 son de acuerdo con la invención, mientras que los compuestos de los Ejemplos 4, 6, 37, 40, 56-58, 60 y 61 no son de acuerdo con la invención.

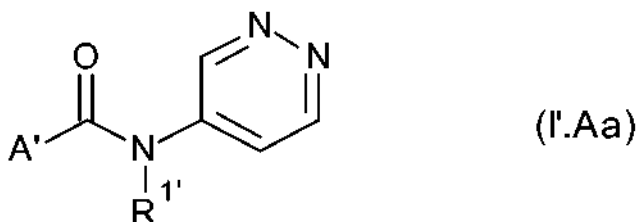


Tabla C. Compuestos de fórmula I'.Aa preparados de acuerdo con el método mencionado anteriormente

Ejemplo	$R^{1'}$	A	Datos fisicoquímicos: t.r. [min]	Datos fisicoquímicos: $m/z^*$
1	CH <sub>3</sub>	2-ciclopropil-4-metil-5-pirimidinilo	1,752	269,1
2	H	2-trifluorometil-4-metil-5-pirimidinilo	1,777	283,2
3	CH <sub>3</sub>	2-trifluorometil-4-metil-5-pirimidinilo	1,844	297,2
4	CH <sub>3</sub>	2-metiltio-5-pirimidinilo	1,521	261,3
5	CH <sub>3</sub>	4-trifluorometil-5-pirimidinilo	1,587	283,2
6	H	2-metiltio-5-pirimidinilo	1,564	247,3

## ES 2 589 792 T3

Ejemplo	R <sup>1</sup>	A	Datos fisicoquímicos: t.r. [min]	Datos fisicoquímicos: m/z <sup>*</sup> )
7	H	4-trifluorometil-5-pirimidinilo	1,484	269,2
8	H	2-metil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	1,197	283,2
9	H	2,4-dimetil-5-pirimidinilo	1,257	229,2
10	CH <sub>3</sub>	2,4-dimetil-5-pirimidinilo	1,217	243,3
11	H	2-ciclopropil-4-metil-5-pirimidinilo	1,720	255,3
12	H	6-ciclopropil-5-metil-4-pirimidinilo	1,970	256,1
13	CH <sub>3</sub>	6-ciclopropil-5-metil-4-pirimidinilo	1,857	270,1
14	H	2-metil-5-pirimidinilo	1,137	216,1
15	CH <sub>3</sub>	2-metil-5-pirimidinilo	1,048	230,1
16	H	6-trifluorometil-5-metil-4-pirimidinilo	2,117	284,0
17	H	4-metil-5-pirimidinilo	1,139	216,0
18	H	5-pirimidinilo	0,893	202,1
19	CH <sub>3</sub>	5-pirimidinilo	0,803	216,0
20	H	6-isobutil-5-metil-4-pirimidinilo	2,280	272,2
21	CH <sub>3</sub>	6-isobutil-5-metil-4-pirimidinilo	2,152	286,1
22	H	2-ciclopropilmetil-6-metil-5-pirimidinilo	1,844	270,1
23	CH <sub>3</sub>	2-ciclopropilmetil-6-metil-5-pirimidinilo	1,860	284,1
24	CH <sub>3</sub>	4-metil-5-pirimidinilo	1,055	230,1
25	CH <sub>3</sub>	2-(2-metoxietil)-6-metil-5-pirimidinilo	1,419	288,1
26	H	2-isobutil-6-metil-5-pirimidinilo	1,971	272,1
27	CH <sub>3</sub>	2-isobutil-6-metil-5-pirimidinilo	2,005	286,2
28	H	2-trifluorometil-4-pirimidinilo	1,612	270,1
29	CH <sub>3</sub>	2-trifluorometil-4-pirimidinilo	1,745	284,0
30	CH <sub>3</sub>	5,6-dimetil-4-pirimidinilo	1,319	244,1
31	CH <sub>3</sub>	5-metil-6-etil 4-pirimidinilo	1,610	258,0
32	H	5-metil-6-etil 4-pirimidinilo	1,743	244,0
33	H	5,6-dimetil-4-pirimidinilo	1,480	230,1
34	H	2-pirimidinilo	0,890	202,0
35	CH <sub>3</sub>	2-pirimidinilo	0,914	216,0
36	CH <sub>3</sub>	2-piridilo	1,127	214,2
37	CH <sub>3</sub>	5-nitro-2-piridilo	1,404	259,2
38	CH <sub>3</sub>	6-metoxi-2-piridilo	1,605	244,3
39	H	2-piridilo	1,346	200,2
40	H	5-nitro-2-piridilo	1,495	245,2
41	H	6-metoxi-2-piridilo	1,736	230,2
42	CH <sub>3</sub>	6-cloro-3-piridilo	1,405	248,7
43	CH <sub>3</sub>	2-cloro-3-piridilo	1,356	248,7

Ejemplo	R <sup>1</sup>	A	Datos fisicoquímicos: t.r. [min]	Datos fisicoquímicos: m/z <sup>*</sup> )
44	CH <sub>3</sub>	5-bromo-3-piridilo	1,541	293,1
45	CH <sub>3</sub>	3-piridilo	0,774	214,2
46	CH <sub>3</sub>	4-trifluorometil-3-piridilo	1,663	282,3
47	H	6-cloro-3-piridilo	1,488	234,6
48	H	2-cloro-3-piridilo	1,242	234,6
49	H	5-bromo-3-piridilo	1,565	279,1
50	H	4-trifluorometil-3-piridilo	1,556	268,2
51	H	3-piridilo	0,737	200,2
52	CH <sub>3</sub>	4-piridilo	0,721	214,2
53	H	4-piridilo	0,741	200,2
54	H	6-(2-metoxietil)-5-metil-4-pirimidinilo	1,657	274,1
55	CH <sub>3</sub>	6-(2-metoxietil)-5-metil-4-pirimidinilo	1,556	288,2
56	H	4-piridazinilo	0,715	202,1
57	CH <sub>3</sub>	4-piridazinilo	0,741	216,1
58	H	2-pirazinilo	1,145	202,0
59	CH <sub>3</sub>	6-trifluorometil-5-metil-4-pirimidinilo	2,113	298,0
60	H	2-metiltio-4-metil-5-pirimidinilo	1,849	262,0
61	CH <sub>3</sub>	2-metiltio-4-metil-5-pirimidinilo	1,839	276,0
62	H	4-(1-fluoroetil)-5-pirimidinilo	1,428	248,1
63	CH <sub>3</sub>	4-(1-fluoroetil)-5-pirimidinilo	1,513	262,1
64	H	2-metil-4-(1-fluoroetil)-5-pirimidinilo	1,573	262,1
65	CH <sub>3</sub>	2-metil-4-(1-fluoroetil)-5-pirimidinilo	1,672	276,1
66	H	2-etil-4-metil-5-pirimidinilo	1,470	244,2
67	CH <sub>3</sub>	2-etil-4-metil-5-pirimidinilo	1,492	258,1
68	CH <sub>3</sub>	2-metil-4-trifluorometil-5-pirimidinilo	1,880	298,0
69	H	2-isopropil-4-metil-5-pirimidinilo	1,858	258,2
70	CH <sub>3</sub>	2-isopropil-4-metil-5-pirimidinilo	1,872	272,2
71	H	2-terc-butil-4-metil-5-pirimidinilo	2,354	272,1
72	CH <sub>3</sub>	2-terc-butil-4-metil-5-pirimidinilo	2,416	286,2
t.r. = tiempo de retención por HPLC *) m/z de los picos [M] <sup>+</sup>				

## II. Evaluación de la actividad plaguicida:

### II.1 Pulgón del algodón (*Aphis gossypii*, estadios de vida mixtos)

5 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona en forma de 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 trabajo para las que se prepararon diluciones inferiores en 50 % de acetona:50 % de agua (v/v). Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución con un volumen de un 0,01 % (v/v).

- 5 Se infestaron plantas de algodón en el estadio de cotiledón con pulgones antes del tratamiento colocando una hoja fuertemente infestada de la colonia principal de pulgones en la parte superior de cada cotiledón. Se permitió que los pulgones se transfirieran durante una noche para conseguir una infestación de 80-100 pulgones por planta y se retiró la hoja hospedadora. Las plantas infestadas se pulverizaron a continuación con un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana extractora del pulverizador, se retiraron del pulverizador, y a continuación se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo iluminación fluorescente con un período de luz de 24 h a 25 °C y un 20-40 % de humedad relativa. La mortalidad de pulgones en las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad en las plantas de control sin tratar, se determinó después de 5 días.
- 10 En este ensayo, los compuestos 2, 3, 9, 10, 22, 23, 24, 30, 31, 32, 33, 37, 42, 43, 44, 45, 46, 50, 51, 52, 53, 64 y 65 respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.
- Los compuestos 1, 11, 14, 15, 17, 25, 66, 67 y 68 respectivamente, a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.
- 15 II.2 Pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*, estadios de vida mixtos)
- Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona en forma de 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 trabajo para las que se prepararon diluciones inferiores en 50 % de acetona:50 % de agua (v/v). Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución con un volumen de un 0,01 % (v/v).
- 20 Se infestaron plantas de pimiento morrón en el estadio de primera hoja antes del tratamiento colocando hojas fuertemente infestadas de la colonia principal en la parte superior de las plantas de tratamiento. Se permitió que los pulgones se transfirieran durante una noche para conseguir una infestación de de 30-50 pulgones por planta y las se retiraron hojas hospedadoras. Las plantas infestadas se pulverizaron a continuación con un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana extractora del pulverizador, se retiraron, y a continuación se mantuvieron en una cámara de crecimiento bajo iluminación fluorescente con un período de luz de 24 h a 25 °C y un 20-40 % de humedad relativa. La mortalidad de pulgones en las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad en las plantas de control sin tratar, se determinó después de 5 días.
- 25 En este ensayo, los compuestos 2, 3, 9, 10, 13, 22, 23, 24, 42, 43, 44, 45, 46, 52, 53, 60, 61, 64 y 70 respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.
- Los compuestos 1, 8, 11, 15, 17, 25, 26, 27, 66, 67 y 68 respectivamente, a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.
- 35 II.3 Pulgón negro de las leguminosas (*Aphis craccivora*)
- Los compuestos activos se formularon en acetona:agua 50:50 (vol:vol). La solución de ensayo se preparó en el día de uso.
- Se pulverizaron plantas de haba en maceta colonizadas con 100 - 150 pulgones de diversos estadios después de que se hubiera registrado la población de la plaga. La reducción de la población se evaluó después de 24, 72, y 120 horas.
- 40 En este ensayo, los compuestos 1, 2, 3, 6, 8, 9, 10, 11, 14, 16, 17, 18, 19, 23, 24, 25, 26, 27, 30, 32, 33, 42, 44, 45, 47, 48, 51, 52, 53, 54, 60, 64, 65, 66, 67, 68 y 69 respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 90 % en comparación con los controles sin tratar.
- II.4 Mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia argentifolii*, adultos)
- 45 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona en forma de 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 trabajo para las que se prepararon diluciones inferiores en 50 % de acetona:50 % de agua (v/v). Se incluyó un tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución con un volumen de un 0,01 % (v/v).

Se pulverizaron plantas de algodón en el estadio de cotiledón (una planta por maceta) mediante un pulverizador de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización atomizadora. Las plantas se secaron en la campana extractora del pulverizador y a continuación se retiraron del pulverizador. Cada maceta se puso en una taza de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (de aproximadamente 3-5 días de edad).

- 5 Los insectos se recogieron usando un aspirador y una tubería no tóxica de 0,6 cm Tygon® (R-3603) conectada a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recogidos, se insertó a continuación con cuidado en el suelo que contenía la planta tratada, permitiendo que los insectos se arrastraran fuera de la punta para alcanzar las hojas para alimentarse. Las tazas se cubrieron con una tapa perforada reutilizable (malla de poliéster de 150 micrómetros de malla PeCap de Tetko, Inc.). Las plantas de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento a 25 °C y un 20-40 % de humedad relativa durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (período de luz de 24 horas) para evitar atrapar calor dentro de la taza. La mortalidad se evaluó 3 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control sin tratar.

En este ensayo, los compuestos 2, 3, 9, 10, 22, 23, 48, 50 y 64 respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.

- 15 Los compuestos 1, 8, 11, 12, 14, 26, 27 y 66 y respectivamente, a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.

#### II.5 Pulgón de la veza (*Megoura viciae*)

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

- 20 Se colocaron discos de hojas de habichuelas en placas de microtitulación llenas con un 0,8 % de agar-agar y 2,5 ppm de OPUS™. Los discos de hojas se pulverizaron con 2,5 ml de la solución de ensayo y se colocaron de 5 a 8 pulgones adulto en las placas de microtitulación que a continuación se cerraron y se mantuvieron a  $23 \pm 1$  °C y  $50 \pm 5$  % de humedad relativa bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó basándose en los pulgones reproducidos vivos. A continuación se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de los pulgones.

- 25 En este ensayo, los compuestos 1, 2, 3, 8, 9, 10, 11, 16, 22, 23, 24, 26, 27, 43, 44, 45, 46, 48, 50, 51, 53, 60, 62, 64, 65, 66, 68, 69, 70 y 72, respectivamente con una concentración de la solución de ensayo de 2500 mg/l mostraron una mortalidad de al menos un 90 %.

#### II.6 Actividad frente a pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*)

- 30 Para evaluar el control del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) a través de medios sistémicos, la unidad de ensayo consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contenían dieta artificial líquida bajo una membrana artificial.

- 35 Los compuestos se formularon usando una solución que contenía un 75 % v/v de agua y un 25 % v/v de DMSO. Se pipetearon diferentes concentraciones de los compuestos formulados en la dieta de pulgón, usando un pipeteador a medida, con dos duplicados. Después de la aplicación, se colocaron de 5 a 8 pulgones adultos en la membrana artificial dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. A continuación se permitió que los pulgones succionan la dieta de pulgón tratada y se incubaron a aproximadamente  $23 \pm 1$  °C y aproximadamente un 50 + 5 % de humedad relativa durante 3 días. A continuación se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de los pulgones.

- 40 En este ensayo, los compuestos 1, 2, 3, 8, 9, 10, 11, 15, 18, 19, 22, 23, 24, 29, 30, 31, 32, 34, 46, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 60, 61, 64, 66, 67, 68, 69 y 70, respectivamente, a 2500 ppm mostraron un 100 % de mortalidad en comparación con los controles sin tratar.

#### II.7 Actividad en los ensayos hidropónicos frente a pulgones verdes del melocotonero (*Myzus persicae*)

- 45 Se hicieron crecer plantas de pimiento verde (*Capsicum annuum* L., variedad 'California Wonder') en un invernadero desde la semilla hasta el estadio de segunda hoja (BBCH 12) en Scott's Metro-Mix® 360 (1-2 plantas por 2¼" cuadradas de maceta). Las hojas del cotiledón se retiran y las raíces se aclaran en agua corriente hasta que quedan exentas de suelo. Las raíces se mantienen húmedas bajo una capa de papel mojado hasta que todas las plantas se han preparado.

- 50 Se prepara una solución de trabajo de 3400 ppm de cada compuesto de ensayo usando acetona de calidad de reactivo como disolvente. Las diluciones posteriores de 100 y 10 ppm se preparan a partir de esta solución de trabajo con diluciones finales en agua desionizada en botellas de vidrio de color ámbar de 100 ml. Se coloca una planta con la raíz desnuda en cada botella usando una sección de tapón de espuma para asegurar centralmente el tallo en el cuello de la botella. Las raíces desnudas se sumergen completamente en las suspensiones de ensayo.

Las plantas hospedadoras se colocan en una cámara de crecimiento de plantas en condiciones de iluminación fluorescente GroLux® (40 W), durante 24 horas a  $25 \pm 2$  °C y un 20-40 % de humedad relativa.

5 Después de la exposición de las raíces desnudas a las suspensiones de ensayo, se colocan trozos plantas de pimiento infestadas con pulgones verdes del melocotonero (*Myzus persicae*) en la parte superior de las hojas de ensayo. Se permite que los insectos se transfieran desde las hojas hospedadoras para conseguir una infestación de 40-50 insectos por planta. Se deja que el ensayo transcurra durante 3 días en la misma cámara de crecimiento que se había usado anteriormente. Las evaluaciones incluyen estimaciones de la reducción de la densidad de población de pulgones con respecto a la densidad media de pulgones en las plantas de control sin tratar. Las respuestas fitotóxicas de las plantas hospedadoras también se registran en este momento.

10 En este ensayo, los compuestos 2, 3, 9, 10 y 11, respectivamente a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.

#### II.8 Actividad en los ensayos hidropónicos frente a pulgones del algodón (*Aphis gossypii*)

15 Se hacen crecer plantas de algodón (*Gossypium hirsutum*, variedad Sure Grow 747') en un invernadero desde la semilla hasta el estadio de segunda hoja (BBCH 12) en Scott's Metro-Mix® 360 (1-2 plantas por 2¼" cuadradas de maceta). Las hojas del cotiledón se retiran y las raíces se aclaran en agua corriente hasta que quedan exentas de suelo. Las raíces se mantienen húmedas bajo una capa de papel mojado hasta que todas las plantas se han preparado.

20 Se prepara una solución de trabajo de 3400 ppm de cada compuesto de ensayo usando acetona de calidad de reactivo como disolvente. Las diluciones posteriores de 100 y 10 ppm se preparan a partir de esta solución de trabajo con diluciones finales en agua desionizada en botellas de vidrio de color ámbar de 100 ml. Se coloca una planta con la raíz desnuda en cada botella usando una sección de tapón de espuma para asegurar centralmente el tallo en el cuello de la botella. Las raíces desnudas se sumergen completamente en las suspensiones de ensayo. Las plantas hospedadoras se colocan en una cámara de crecimiento de plantas en condiciones de iluminación fluorescente GroLux® (40 W), durante 24 horas a  $25 \pm 2$  °C y un 20-40 % de humedad relativa.

25 Después de la exposición de las raíces desnudas a las suspensiones de ensayo, se colocan trozos plantas de algodón infestadas con pulgones del algodón (*Aphis gossypii*) en la parte superior de las hojas de ensayo. Se permite que los insectos se transfieran desde las hojas hospedadoras para conseguir una infestación de 40-50 insectos por planta. Se deja que el ensayo transcurra durante 3 días en la misma cámara de crecimiento que se había usado anteriormente. Las evaluaciones incluyen estimaciones de la reducción de la densidad de población de pulgones con respecto a la densidad media de pulgones en las plantas de control sin tratar. Las respuestas fitotóxicas de las plantas hospedadoras también se registran en este momento.

30 En este ensayo, los compuestos 2, 3, 9, y 10, respectivamente a 100 ppm mostraron una mortalidad de al menos un 75 % en comparación con los controles sin tratar.

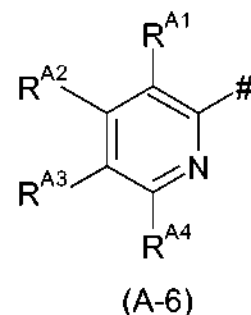
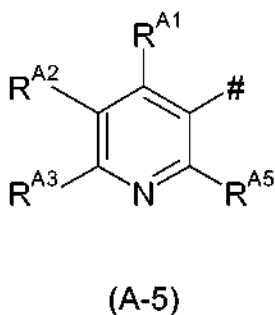
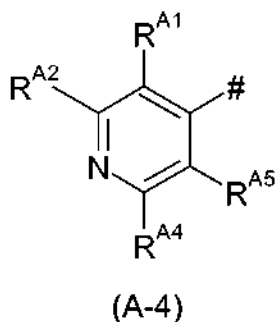
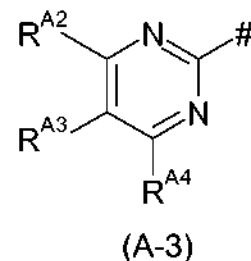
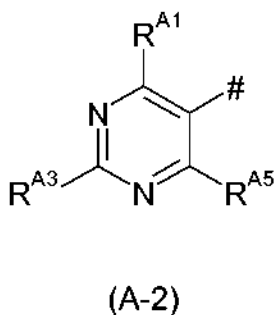
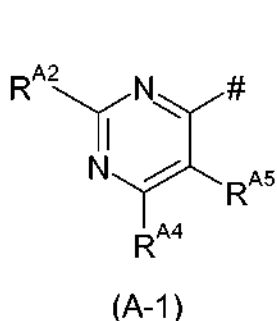


## REIVINDICACIONES

1. Compuestos de piridazina de fórmula I'.A, las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos,



5 donde el radical A se selecciona entre los radicales de fórmulas A-1, A-2, A-3, A-4, A-5 y A-6:



en las que: # representa el punto de unión al resto de la fórmula I'.A, y en las que

10  $R^{A1}$ ,  $R^{A5}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-CN, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-OR<sup>a</sup>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y heterociclilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, en las que cicloalquilo y heterociclilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R<sup>y</sup> iguales o diferentes;

15  $R^{A2}$ ,  $R^{A4}$  se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-CN, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-OR<sup>a</sup>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y heterociclilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, en las que cicloalquilo y heterociclilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R<sup>y</sup> iguales o diferentes;

20  $R^{A3}$  se selecciona entre hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-CN, alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-OR<sup>a</sup>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, y heterociclilo saturado de 3 a 7 miembros-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, en la que cicloalquilo y heterociclilo en los 3 últimos radicales mencionados pueden estar no sustituidos o pueden portar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes R<sup>y</sup> iguales o diferentes;

$R^1$  se selecciona entre hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>;

R<sup>a</sup> se selecciona entre hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

R<sup>y</sup> se selecciona entre halógeno, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

excepto para los compuestos de fórmula I'.A,

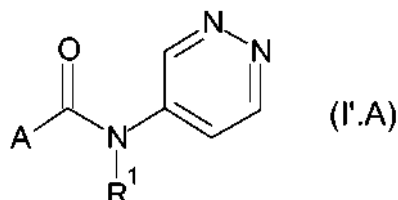
5 en la que R<sup>1</sup> es hidrógeno y A se selecciona entre el grupo que consiste en 2,6-difluoro-4-piridilo, 2,6-dicloro-4-piridilo, 2,6-dibromo-4-piridilo y 2,6-diiodo-4-piridilo.

2. Los compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en los que R<sup>A1</sup> y R<sup>A5</sup>, si estuvieran presentes, se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluoro-metoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

3. Los compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en los que R<sup>A2</sup> y R<sup>A4</sup>, si estuvieran presentes, se seleccionan independientemente entre sí entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluoro-metoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

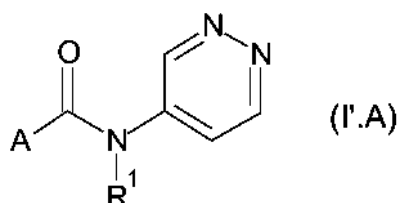
4. Los compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en los que R<sup>A3</sup>, si estuviera presente, se selecciona entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, isobutilo, ciclopropilmetilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, difluorometoximetilo, trifluorometoximetilo, cianometilo, 2-metoxi-1-etilo, 2-difluorometoxi-1-etilo, 2-trifluorometoxi-1-etilo y 2-ciano-1-etilo.

5. El uso no terapéutico de los compuestos de fórmula I'.A



25 donde los radicales A y R<sup>1</sup> son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos, para controlar plagas de invertebrados.

6. Un método para proteger material de propagación de plantas y/o las plantas que crecen a partir del mismo, método que comprende tratar el material de propagación de plantas con una cantidad plaguicida eficaz de un compuesto de la fórmula I'.A



30 donde los radicales A y R<sup>1</sup> son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos.

7. Una composición agrícola que contiene al menos un compuesto de piridazina que se selecciona entre los compuestos de piridazina de fórmula I'.A, las sales de los mismos, los N-óxidos de los mismos y las sales de los N-óxidos de los mismos, y al menos un vehículo agrícolamente aceptable, de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.