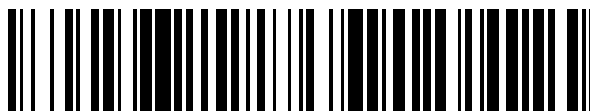


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 710 701**

51 Int. Cl.:

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **23.09.2009 PCT/EP2009/062318**

87 Fecha y número de publicación internacional: **01.04.2010 WO10034738**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **23.09.2009 E 09783323 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **14.11.2018 EP 2346335**

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

30 Prioridad:

24.09.2008 US 99779 P

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

26.04.2019

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)
Carl-Bosch-Strasse 38
67056 Ludwigshafen am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

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

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

ES 2 710 701 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 pirazol para el control de plagas de invertebrados.

La presente invención se refiere a novedosos compuestos de pirazol que pueden usarse para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de artrópodos. La presente invención se refiere además a un método no terapéutico para controlar plagas de invertebrados, un método para proteger el material de propagación de plantas y/o las plantas que crecen a partir de ellos usando estos compuestos. La presente invención se refiere además a material de propagación de plantas y a una composición agrícola que comprende dichos compuestos.

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

Los documentos WO 2003/106427, WO 2004/046129 y JP 2007-77106 describen N-arilamidas derivadas de ácidos pirazol carboxílicos. Se menciona que estos compuestos son útiles para combatir plagas de invertebrados.

Los documentos WO 2004/106324, WO 2004/035545 y WO 2005/040152 describen N-arilo y N-hetarilamidas y las correspondientes tioamidas derivadas de ácidos carboxílicos que comprenden un heterociclo de 5 miembros. Estos compuestos se mencionan por ser útiles como herbicidas.

El documento WO 2007/065664 describe amidas cíclicas, ésteres y tioésteres derivados de ácidos pirazol carboxílicos, en los que el ácido pirazol carboxílico se fusiona a un anillo heteroaromático de 6 miembros. Los compuestos se mencionan por ser útiles en el tratamiento de enfermedades que responden a la modulación de la proteína quinasa.

Los compuestos N-piridin-3-il pirazolo[1,5-a]piridin-3-carboxamida (CAS RN 902557-36-2), N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(3,4- dimetoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida (CAS RN 899524-24-4), N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(2-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida (CAS RN 831184-14-6), N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(3-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida (CAS RN 505071-83-0) han sido divulgados a través de la base de datos "www.chemspider.com" bajo los números ID 20278135, 12522109, 4673425 y 4692549 en la fecha de presentación efectiva, pero no se conocían por sus propiedades pesticidas.

Sharlow E. et al., Assay and Drug Development Technologies, 2007, vol. 5 (6), pp.723-736 divulgan el compuesto N-piridin-3-il pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida (CAS RN 717831-80-6) en relación con ensayos de detección de inhibidores de Quinasa 1 similar a Polo 1.

El documento WO2004/017908 divulga moduladores de receptores de calcio para aplicaciones farmacéuticas. En particular, se divulga el compuesto N-piridin-3-il 5-ciclohexil-7,7-dimetil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida (CAS RN 667930-61- 2).

El documento WO03/037900 divulga métodos para el tratamiento de enfermedades mediante la inhibición del flujo de ión sodio a través de canales de sodio dependientes de voltaje mediante la aplicación de pirazolopirimidinas. En particular, se divulgan los compuestos N-piridin-3-il 5-(4-bromofenil)-7-trifluorometil-pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-carboxamida (CAS RN 333763-55-6), y 3-cloro-5-(4-fluorofenil)-N-(3-piridil)-7-(trifluorometil) pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-carboxamida (CAS RN 334499-74-9).

El documento WO2007/046548 divulga compuestos de pirazolopirimidina como antagonistas del receptor central de cannabinoides para el tratamiento de ciertas enfermedades humanas, tales como enfermedades del sistema nervioso central. En particular, se divulga el compuesto N-piridin-3-il 6-(2-clorofenil)-7-(4-clorofenil) pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida (CAS RN 935451-06-2).

El documento WO2010/017047 divulga el uso de ciertas pirazolopiridinas e imidazopiridinas para el tratamiento de trastornos mieloproliferativos o cáncer. En particular, se divulga el compuesto 4-metoxi-6-(1-metilpirazol-4-il)-N-(3-piridil)pirazolo[1,5-a]piridin-3-carboxamida (CAS RN 1207838-93-4). El documento WO2010/017047 forma la técnica anterior de acuerdo con A.54 (3) EPC.

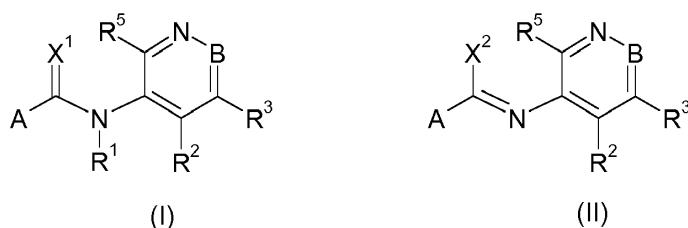
El documento WO2008/116898 divulga derivados de pirazolopirimidina para uso como inhibidores de la estearoil-CoA desaturasa humana. En particular, el compuesto 6-[[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]metil]-N-(3-piridil)pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida (CAS RN 1065080-72- 9).

Los documentos WO02/094791 y WO02/070483 divulgan agentes de control de plagas de invertebrados que contienen al menos dos grupos amida, en donde uno de estos grupos amida puentea dos unidades estructurales cíclicas.

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

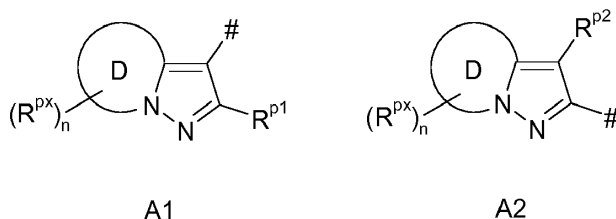
Se ha encontrado que estos objetos se consiguen mediante compuestos de fórmulas I y II, como se definen a continuación, y sus sales y N-óxidos, en particular sus sales agrícola o veterinariamente aceptables.

10 Por lo tanto, un primer objeto de la presente invención se refiere a un método no terapéutico para controlar plagas de invertebrados, cuyo método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o sus terrenos de crianza 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 deben protegerse contra el ataque o infestación de plagas con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de pirazol de fórmulas I o II y las sales y los N-óxidos de los mismos,



15 en donde

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



denota el sitio de enlace al resto de fórmulas I o II, y en donde

20 D es un radical heterocíclico de 5 o 6 miembros fusionado con la unidad estructural pirazol, en donde los miembros del anillo se seleccionan de C, N, O y S, y en donde el radical cíclico puede ser saturado, parcialmente insaturado o aromático., y en donde

R^{p1} es hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, o C₃-C₆-halocicloalquilo;

R^{p2} es hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, o C₃-C₆-halocicloalquilo;

25 n es 0, 1, 2, 3 o 4, y en donde

R^{px} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno y C₂-C₁₀-alquino, en donde los 3 últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes. R^x,

30 o en donde R^{px} se selecciona además de OR^a, SR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, heterocíclico, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₅-C₁₀-cicloalqueno y fenilo, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de R^x y R^y, o en donde

dos radicales R^{px} unidos al mismo miembro del anillo del radical heterocíclico D juntos pueden formar un sustituyente oxo, y en donde

35 dos radicales R^{px} unidos a los miembros del anillo adyacentes del radical heterocíclico D junto con esos miembros del anillo pueden formar un radical carbocíclico o heterocíclico de 3 a 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático fusionado al radical heterocíclico D, en donde los miembros del anillo se seleccionan de C, N, O y S, y en donde el radical cíclico puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo;

B es N o CH;

5 X¹ es S, O o NR^{1a}, en donde R^{1a} se selecciona de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilmetilo, C₃-C₁₀-halocicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-haloalqueno, C₂-C₁₀-alquino, C₁-C₁₀-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, OR^a, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

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

10 R^{2a} se selecciona de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde

15 R^{2b}, R^{2c} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetaril-carbonilo, hetarilsulfonilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los ocho últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi o

20 R^{2b} y R^{2c} junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, que puede llevar un heteroátomo adicional que es seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde

25 R^{2d} se selecciona de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

R¹ es hidrógeno, o C₁-C₃-alquilo;

R² es hidrógeno;

R³ es hidrógeno;

R⁵ es hidrógeno;

35 Y es O o S;

40 R^a, R^b, R^c son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

45 R^d se selecciona de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

50 R^e, R^f son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilcarbonilo, hetarilsulfonilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los ocho últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, o

- 5 R^e y R^f junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, que puede llevar un heteroátomo adicional que es seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 10 R^g, R^h son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 15 Rⁱ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo y fenil-C₁-C₄-alquilo en donde el anillo de fenilo en los dos últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 20 R^x son independientemente unos de otro seleccionados de ciano, nitro, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₁₀-alquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, heterociclilo de 5 a 7 miembros, fenilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, heterociciloxi de 5 a 7 miembros y fenoxi, en donde los últimos 6 radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales. R^y;
- 25 R^y se selecciona de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo .
- 30 Una realización 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 de los mismos, cuyo método comprende tratar la semilla con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de las fórmulas I o II o una sal agrícolamente aceptable o un N-óxido del mismo como se define en el presente documento.
- Una realización adicional de la presente invención se refiere a material de propagación de plantas, que comprende al menos un compuesto de fórmulas I o II y/o una sal agrícolamente aceptable o un N-óxido del mismo como se define aquí.
- 35 Los compuestos de fórmulas I y II y sus sales o N-óxidos no se han descrito anteriormente, con la excepción de N-piridin-3-il pirazolo[1,5-a]piridin-3-carboxamida, N-piridin-3-il pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida, N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(3,4-dimetoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida, N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(2-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida y N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(3-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida, N-piridin-3-il 5-ciclohexil-7,7-dimetil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida, N-piridin-3-il 5-(4-bromofenil)-7-trifluorometil-pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-carboxamida, N-piridin-3-il 6-(2-clorofenil)-7-(4-clorofenil) pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida, 4-metoxi-6-(1-metilpirazol-4-il)-N-(3-piridil)pirazolo[1,5-a]piridin-3-carboxamida; 6-[[4-fluoro-3-(trifluorometil)-fenil]metil]-N-(3-piridil)pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida, y 3-cloro-5-(4-fluorofenil)-N-(3-piridil)-7-(trifluorometil)pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-carboxamida. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a los compuestos de pirazol no descritos anteriormente de fórmula I y II y sus sales, en particular sus sales agrícola o veterinariamente aceptables, y sus N-óxidos.
- 45 Una realización adicional de la presente invención se refiere a una composición agrícola que contiene al menos un compuesto de fórmulas I o II de acuerdo con la invención y/o una sal agrícolamente aceptable o un N-óxido del mismo y al menos un vehículo líquido o sólido.
- Los sustituyentes de los compuestos de fórmulas I o II pueden contener uno o más centros de quiralidad. En este caso, los compuestos de las fórmulas I o II pueden estar presentes en forma de diferentes enantiómeros o diastereómeros, dependiendo de los sustituyentes.
- 50 Los compuestos de fórmula II pueden existir adicionalmente como un isómero cis o trans con respecto al eje N=C. La presente invención se refiere a todos los posibles estereoisómeros de los compuestos de fórmulas I o II, es decir, a enantiómeros o diastereómeros individuales, así como a mezclas de los mismos.
- Los compuestos de fórmulas I o II pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas, tal como la estabilidad, o mostrar diferentes propiedades biológicas, tal como actividades.
- 55

La presente invención incluye compuestos tanto amorfos como cristalinos de fórmulas I o II, mezclas de diferentes estados cristalinos del compuesto respectivo I o II, así como sales amorfas o cristalinas de los mismos.

5 Las sales de los compuestos de las fórmulas I o II son preferiblemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola y veterinario. Se pueden formar en un método habitual, por ejemplo. Haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión.

Las sales útiles para la agricultura de los compuestos de fórmulas I y II abarcan especialmente las sales de las sales de adición de ácidos de aquellos ácidos cuyos aniones no tienen efectos adversos sobre la acción pesticida de los compuestos de fórmulas I o II.

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

15 Las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los compuestos de fórmulas I o II abarcan especialmente las sales de adición de ácido que son conocidas y aceptadas en la técnica para la formación de sales para uso veterinario. Sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo formado por compuestos de fórmulas I o II que contienen un átomo de nitrógeno básico, por ejemplo un grupo amino, incluye sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales de ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético, ácido maleico, por ejemplo las sales monoácidas o sales diácidas de ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, por ejemplo las sales monoácidas o sales diácidas del ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metanosulfénico, ácido metanosulfónico y ácido succínico.

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

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

30 El término "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 vegetal vegetativo, tales como esquejes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que pueden usarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, retoños y otras partes de las plantas. También se pueden incluir las plántulas y las plantas jóvenes, que se trasplantarán después de la germinación o después de la emergencia del suelo. Estos materiales de propagación de plantas pueden tratarse de manera profiláctica con un compuesto de protección de plantas ya sea en o antes de la siembra o trasplante.

35 El término "plantas" comprende cualquier tipo de plantas, incluidas las "plantas no cultivadas" y en particular las "plantas cultivadas".

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

40 El término "plantas cultivadas" tal como se usa en el presente documento incluye plantas que se han modificado mediante cruzamiento, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas modificadas genéticamente son plantas, cuyo material genético se ha modificado tanto mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que, en circunstancias naturales, no pueden obtenerse fácilmente mediante cruzamiento, mutaciones o recombinación natural. Típicamente, uno o más genes se han integrado en el material genético de una planta modificada genéticamente para mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a, la modificación post-transduccional dirigida de las proteínas (oligo- o polipéptidos), por ejemplo, por glicosilación o adiciones de polímeros tales como unidades estructurales preniladas, acetiladas o farnesiladas o unidades estructurales de PEG (por ejemplo, como se divulga en *Biotechnol Prog.* 2001 Jul-Aug;17(4):720-8., *Protein Eng. Des. Sel.* 2004 Jan;17(1):57-66, *Nat. Protoc.* 2007;2(5):1225-35., *Curr. Opin. Chem. Biol.* 2006 Oct;10(5):487-91. *Epub* 2006 Aug 28., *Biomaterials.* 2001 Mar; 22(5):405-17, *Bioconjug. Chem.* 2005 Jan-Feb;16(1):113-21).

55 El término "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 la hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD); inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS), tal como las sulfonilureas (véanse, por ejemplo, los documentos US 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) o imidazolinonas (véanse, por ejemplo, los documentos US 6.222.100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/0252626, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); inhibidores de

enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS), tales como glifosato (véase, por ejemplo, el documento WO 92/00377); Inhibidores de la glutamina sintetasa (GS), como el glufosinato (véase, por ejemplo, los documentos EP-A-0242236, EP-A-242246) o los herbicidas oxinilo (véase, por ejemplo, los documentos US 5.559.024) como resultado de los métodos convencionales de cruzamiento o ingeniería genética. Varias plantas cultivadas se han vuelto tolerantes a los herbicidas por métodos convencionales de cruzamiento (mutagénesis), por ejemplo, la colza de verano Clearfield® (Canola) es tolerante a las imidazolinonas, por ejemplo imazamox. Los métodos de ingeniería genética se han utilizado para producir plantas cultivadas, tales como soja, algodón, maíz, remolacha y colza, tolerantes a los herbicidas, tal como el glifosato y el glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente bajo los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink. ® (glufosinato).

El término "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye además plantas que son, mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, capaces de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente las conocidas del género bacteriano bacillus, particularmente de bacillus thuringiensis, tales como endotoxinas, por ejemplo CryIA (b), CryIA(c), CryIF, CryIF (a2), Cry-IIA(b), CryIIIA, CryIIIB (b1) o Cry9c; proteínas insecticidas vegetativas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias colonizadoras de nematodos, por ejemplo Photorhabdus spp. o Xenorhabdus spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas arácnidas, toxinas de avispa u otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas de plantas, tales como lectinas de guisantes o de 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), tal como ricina, RIP de maíz, abrina, luffin, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de los esteroides, tal como la 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de la ecdisona o HMG-CoA-reductasa; bloqueadores de los canales iónicos, tal como bloqueadores de los canales de sodio o calcio; hormona juvenil esterasa; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); estilben sintasa, bibencil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención, estas proteínas o toxinas insecticidas deben entenderse expresamente también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o de otra manera modificadas. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios de proteínas (véase, por ejemplo, el documento WO 02/015701). Ejemplos adicionales de tales toxinas o plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar tales toxinas se describen, por ejemplo, en los documentos EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451. 878, WO 03/018810 y WO 03/052073. Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por los expertos en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente imparten a las plantas la producción de estas proteínas contra las plagas dañinas de ciertos grupos taxonómicos de insectos artrópodos, particularmente a los escarabajos (Coleoptera), moscas (Diptera) y mariposas y polillas (Lepidoptera) y a los nematodos parásitos de plantas (Nematoda).

El término "plantas cultivadas", como se usa en el presente documento, incluye además plantas que son mediante el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para aumentar la resistencia o tolerancia de esas plantas a patógenos bacterianos, virales o fúngicos. Ejemplos de tales proteínas son las llamadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo, EP-A 0 392 225), genes de resistencia a enfermedades de las plantas (por ejemplo, cultivares de patata, que expresan genes de resistencia que actúan contra Phytophthora in-festans derivados de la patata silvestre mexicana Solanum bulbocastanum) o T4-lisozym (por ejemplo, cultivares de patata capaces de sintetizar estas proteínas con mayor resistencia contra bacterias como Erwinia amilvora). Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por los expertos en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

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

El término "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, para los cultivos de aceite de ejemplo que producen ácidos grasos omega-3 de cadena larga que promueven la salud o ácidos grasos omega-9 insaturados (por ejemplo, colza Nexera®).

El término "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 materia prima, por ejemplo patatas que producen mayores cantidades de amilopectina. (por ejemplo patata Amflora®).

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

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

5 El término "alquilo" como se usa en el presente documento y en las unidades esructurales alquilo de alcoxi, alquiltio, alquilcarbonilo, alquilsulfino, alquilsulfonilo y alcoxialquilo, denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene usualmente de 1 a 10 átomos de carbono, con frecuencia de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono. Ejemplos de un grupo alquilo son metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, 2-butilo, iso-butilo, tert-butilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, n-heptilo, 1-metilhexilo, 2-metilhexilo, 3-metilhexilo, 4-metilhexilo, 5-metilhexilo, 1-etilpentilo, 2-etilpentilo, 3-etilpentilo, 1-propilpentilo, n-octilo, 1-metiloctilo, 2-metilheptilo, 1-etilhexilo, 2-etilhexilo, 1,2-dimetilhexilo, 1-propilpentilo y 2-propilpentilo.

15 El término "alquileo" (o alcanodiilo) como se usa en este documento en cada caso denota un radical alquilo como se definió anteriormente, en donde un átomo de hidrógeno en cualquier posición del esqueleto de carbono se reemplaza por un sitio de unión adicional, formando así una unidad estructural bivalente.

20 El término "haloalquilo" como se usa en el presente documento y en las unidades estructurales haloalquilo de haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilcarbonilo, haloalquilsulfino y haloalquilsulfonilo, denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene usualmente de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, en donde los átomos de hidrógeno de este grupo están parcial o totalmente reemplazados con átomos de halógeno. Las unidades estructurales haloalquilo preferidas se seleccionan de C₁-C₄ haloalquilo, más preferiblemente de C₁-C₂ haloalquilo, en particular de C₁-C₂ fluoroalquilo 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 este documento denota en cada caso un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que se une a través de un átomo de oxígeno en cualquier posición en el grupo alquilo y generalmente tiene de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 carbonos. átomos, preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono. Ejemplos de un grupo alcoxi son metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, n-butiloxi, 2-butiloxi, iso-butiloxi, terc-butiloxi y similares.

30 El término "haloalcoxi" como se usa aquí denota en cada caso un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, frecuentemente de 1 a 6 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, en donde los átomos de hidrógeno de este grupo están parcial o totalmente reemplazados por átomos de halógeno, en particular átomos de flúor. Las unidades estructurales haloalcoxi preferidas incluyen C₁-C₄ haloalcoxi, en particular C₁-C₂ fluoroalcoxi, tal como fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y similares.

35 El término "cicloalquilo" como se usa en el presente documento y en las unidades estructurales cicloalquilo de cicloalquil-alquilo, por ejemplo cicloalquil-metilo, denota en cada caso un radical carbocíclico saturado mono- o bicíclico que tiene generalmente de 3 a 10, o preferiblemente de 3 a 6 átomos de carbono, tal 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 y similares.

40 El término "cicloalqueno", como se usa en el presente documento, denota en cada caso un radical carbocíclico mono o bicíclico parcialmente insaturado que tiene generalmente de 5 a 10, o preferiblemente de 5 a 8 átomos de carbono, tal como ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, biciclo[2.2.2]octenilo y similares.

45 El término "halocicloalquilo" como se usa en el presente documento y en las unidades estructurales halocicloalquilo de C₃-C₁₀- halocicloalquilo denota en cada caso un radical cicloalifático mono o bicíclico que tiene generalmente de 3 a 10 átomos de carbono o de 3 a 6 átomos de carbono, en donde al menos uno, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 de los átomos de hidrógeno se reemplazan por halógeno, en particular por flúor o cloro.

50 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-fluorociclopentilo, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-difluorociclopentilo, 1-,2- y 3-clorociclopentilo, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-diclorociclopentilo y similares.

El término "alqueno" como se usa en el presente documento denota en cada caso un radical hidrocarburo individualmente insaturado que tiene generalmente de 2 a 10, o preferiblemente de 2 a 4 átomos de carbono, tales como vinilo, alilo (2-propen-1-il), 1-propen-1-ilo, 2-propen-2-ilo, methallil (2-metilprop-2-en-1-il), 2-buten-1-ilo, 3-buten-1-ilo, 2-penten-1-ilo, 3-penten-1-ilo, 4-penten-1-ilo, 1-metilbut-2-en-1-ilo, 2-etilprop-2-en-1-ilo y similares.

55 El término "alquino" como se usa en este documento denota en cada caso un radical hidrocarburo individualmente insaturado que tiene usualmente de 2 a 10, o preferiblemente de 2 a 4 átomos de carbono, tales como etinilo, propargilo

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

5 El término "alcoialquilo" como se usa en el presente documento se refiere a alquilo lineal o ramificado que tiene usualmente de 1 a 4 átomos de carbono, en donde 1 de esos átomos de carbono porta un radical alcoxi que usualmente tiene de 1 a 10, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono. Ejemplos son CH_2OCH_3 , $\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$, n-propoximetilo, $\text{CH}_2\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$, n-butoximetilo, (1-metilpropoxi)-metilo, (2-metilpropoxi)metilo, $\text{CH}_2\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, 2-(metoxi)etilo, 2-(etoxi)etilo, 2-(n-propoxi)-etilo, 2-(1-metiletoxi)-etilo, 2-(n-butoxi)etilo, 2-(1-metilpropoxi)-etilo, 2-(2-metilpropoxi)-etilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)-etilo, 2-(metoxi)-propilo, 2-(etoxi)-propilo, 2-(n-propoxi)-propilo, 2-(1-metiletoxi)-propilo, 2-(n-butoxi)-propilo, 2-(1-metilpropoxi)-propilo, 2-(2-metilpropoxi)-propilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)-propilo, 3-(metoxi)-propilo, 3-(etoxi)-propilo, 3-(n-propoxi)-propilo, 3-(1-metiletoxi)-propilo, 3-(n-butoxi)-propilo, 3-(1-metilpropoxi)-propilo, 3-(2-metilpropoxi)-propilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)-propilo, 2-(metoxi)-butilo, 2-(etoxi)-butilo, 2-(n-propoxi)-butilo, 2-(1-metiletoxi)-butilo, 2-(n-butoxi)-butilo, 2-(1-metilpropoxi)-butilo, 2-(2-metilpropoxi)-butilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)-butilo, 3-(metoxi)-butilo, 3-(etoxi)-butilo, 3-(n-propoxi)-butilo, 3-(1-metiletoxi)-butilo, 3-(n-butoxi)-butilo, 3-(1-metilpropoxi)-butilo, 3-(2-metilpropoxi)-butilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)-butilo, 4-(metoxi)-butilo, 4-(etoxi)-butilo, 4-(n-propoxi)-butilo, 4-(1-metiletoxi)-butilo, 4-(n-butoxi)-butilo, 4-(1-metilpropoxi)-butilo, 4-(2-metilpropoxi)-butilo, 4-(1,1-dimetiletoxi)-butilo y similares.

20 El término "alquilcarbonilo" (o alquil-C(=O)-) como se usa en este documento se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada que usualmente tiene de 1 a 10 (= alquilcarbonilo $\text{C}_1\text{-C}_{10}$), preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono (= $\text{C}_1\text{-C}_4$ alquilcarbonilo) que está unido a través del carbono de un grupo carbonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalquilcarbonilo" como se usa en este documento se refiere a un grupo alquilcarbonilo como se mencionó anteriormente, en donde los átomos de hidrógeno están parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo.

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

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

El término "alquilsulfino" (o alquilsulfoxilo; o alquil-S(=O)-), como se usa en este documento, se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada que usualmente tiene de 1 a 10 (= $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ alquilsulfino), preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfino $\text{C}_1\text{-C}_4$), que está unido a través del átomo de azufre de un grupo sulfino en cualquier posición en el grupo alquilo.

35 El término "haloalquilsulfino" como se usa en el presente documento se refiere a un grupo alquilsulfino como se mencionó anteriormente en el que los átomos de hidrógeno están parcial o totalmente sustituidos con flúor, cloro, bromo y/o yodo.

40 El término "alquilsulfonilo" (o alquil-S(=O)₂-) como se usa en este documento se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena lineal o ramificada que usualmente tiene de 1 a 10 átomos de carbono (= $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ alquilsulfonilo), preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono (= $\text{C}_1\text{-C}_4$ alquilsulfonilo), que está unido a través del átomo de azufre de un grupo sulfonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

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

45 El término "heterociclilo" incluye en general radicales heterocíclicos monocíclicos de 5, 6, 7 u 8 miembros y radicales heterocíclicos bicíclicos de 8 a 10 miembros, los radicales mono y bicíclicos pueden ser saturados, insaturados o aromáticos (= hetarilo). Los radicales heterocíclicos mono y bicíclicos usualmente comprenden 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros del anillo.

50 El término "hetarilo" incluye radicales heteroaromáticos monocíclicos de 5 o 6 miembros que comprenden como miembros de anillo 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S. Ejemplos de radicales 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-

tiadiazolilo, triazolilo, por ejemplo 1H-, 2H- o 3H-1,2,3-triazol-4-ilo, 2H-triazol-3-ilo, 1H-, 2H-, o 4H-1,2,4-triazolilo y tetrazolilo, es decir 1H- o 2H-tetrazolilo.

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

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

20 El término "radical heterocíclico de 5 o 6 miembros fusionado con la unidad estructural pirazol" como se usa en este documento se refiere a radicales heterocíclicos monocíclicos saturados, insaturados o aromáticos de 5 o 6 miembros que comprenden como parte del heterociclo el enlace C-N de la unidad estructural pirazol. Tales radicales heterocíclicos fusionados pueden contener 1 o 2 heteroátomos adicionales como miembros del anillo seleccionados de O, N y S. Ejemplos de tales radicales heterocíclicos fusionados son "piridina fusionada" junto con el pirazol que forma una unidad estructural pirazolo[1,5-a]piridina (= 3,4-diazainden), "pirimidina fusionada" junto con el pirazol que forma una unidad estructural pirazolo[1,5-a]pirimidina o pirazolo[1,5-c]pirimidina o "tetrahidropirimidina fusionada" junto con el pirazol que forma por ejemplo una unidad estructural 4,5,6,7-tetrahidropirazolo-[1,5-a]pirimidina o 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-c]pirimidina.

30 Los términos "fenilalquilo" y "fenoxialquilo" se refieren a fenilo o fenoxi, respectivamente, que se unen a través de un grupo alquilo que tiene generalmente de 1 a 4 átomos de carbono, en particular un grupo metilo (= fenilmetilo), al resto de la molécula, ejemplos que incluyen bencilo, 1-feniletilo, 2-feniletilo, 2-fenoxietilo y similares.

Los términos "heterociclilalquilo" y "hetarilalquilo" se refieren a heterociclilo o hetarilo, respectivamente, como se define anteriormente que se unen a través de un grupo alquilo que tiene generalmente de 1 a 4 átomos de carbono, en particular un grupo metilo (= heterocicliimetilo o hetarilmetilo, respectivamente), para el resto de la molécula.

35 Las observaciones hechas a continuación con respecto a las realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmulas I o II son válidas por sí solas y, preferiblemente, en combinación entre sí. Las observaciones hechas a continuación con respecto a las realizaciones preferidas de las variables además son válidas con respecto a los compuestos de fórmulas I o II, así como con respecto a los usos y métodos de acuerdo con la invención y la composición de acuerdo con la presente invención.

40 Una realización preferida de la invención se refiere a métodos y usos de compuestos de pirazol de la fórmula I, a sus sales, a sus N-óxidos y a tales compuestos, excepto los descritos previamente como se listan anteriormente.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a aquellos compuestos, en los que X¹ en la fórmula I es oxígeno, azufre o un resto N-R^{1a}. Se da particular preferencia a aquellos compuestos de fórmula I en donde X¹ es oxígeno.

45 Entre los compuestos de la fórmula I, en donde X¹ es NR^{1a}, se da preferencia a aquellos compuestos, en donde R^{1a} es C₁-C₆-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. En particular, R^{1a} es C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-alquenilo, C₃-C₆-alquinilo o C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo.

55 Otra realización de la presente invención se refiere a compuestos de pirazol de fórmula II y a las sales y N-óxidos de los mismos, excepto los descritos previamente como se listan anteriormente. En los compuestos de la fórmula II, se da preferencia a aquellos compuestos en los que X² en la fórmula II es OR^{2a} o SR^{2d}. En estos compuestos R^{2a} o R^{2d} es preferiblemente C₁-C₄-alquilo, C₂-C₄-alquenilo, C₂-C₄-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo o C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo. Igualmente se da preferencia a los compuestos de fórmula II, en donde X² es NR^{2b}R^{2c}. En estos compuestos R^{2b} y R^{2c} preferiblemente se seleccionan independientemente uno del otro, de C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo o C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo o R^{2b} y R^{2c}, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo saturado,

unido a nitrógeno de 5 o 6 miembros que puede comprender un heteroátomo adicional seleccionado de O, S y N, por ejemplo siendo NR^{2b}R^{2c} 1-pirrolidinilo, 1-piperidinilo, 1-piperazinilo, 4-morfolinilo o 4-tiomorfolinilo.

Una segunda realización específica de la presente invención se refiere a compuestos de fórmulas I o II, en donde B es N. Entre los compuestos de las fórmulas I o II, en donde B es N, se prefieren aquellos en los que los radicales R², R³ y R⁵ tiene los significados preferidos.

Entre los compuestos de las fórmulas I o II, se da preferencia a aquellos compuestos en donde R^{px} se selecciona de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los últimos tres radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, o en donde R^{px} se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfonilo y C₁-C₄-haloalquilsulfonilo.

Más preferiblemente R^{px} se selecciona de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo y fenilo, en donde el fenilo puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi. En particular R^{px} se selecciona de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo.

Entre los compuestos de las fórmulas I o II, se da preferencia adicional a aquellos compuestos en los que n es 0, 1 o 2. Más preferiblemente, n es 0, es decir, el radical heterocíclico fusionado D no está sustituido.

Entre los compuestos de las fórmulas I o II, se da preferencia a aquellos compuestos en donde n es 0, 1 o 2. Más preferiblemente n es 0, es decir the fused heterocyclic radical D es unsubstituted.

Entre los compuestos de las fórmulas I o II, se da preferencia a aquellos compuestos en donde el radical heterocíclico fusionado D comprende 0, 1 o 2 heteroátomos adicionales seleccionados de O, N o S como miembros del anillo. Más preferiblemente el radical heterocíclico fusionado D se selecciona de piridina fusionada, dihidropiridina, tetrahidropiridina, pirazina, dihidropirazina, tetrahidropirazina, pirimidina, dihidropirimidina, tetrahidropirimidina, piridazina, dihidropiridazina y tetrahidropiridazina, es decir D junto con la unidad estructural pirazol forman un radical derivado de pirazolo[1,5-a]piridina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-a]piridina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]piridina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridina, pirazolo[1,5-a]pirazina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-a]pirazina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirazina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-a]pirimidina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-a]pirimidina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirimidina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidina, pirazolo[1,5-c]pirimidina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-c]pirimidina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-c]pirimidina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-c]pirimidina, pirazolo[1,5-b]piridazina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-b]piridazina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-b]piridazina y 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-b]piridazina. En particular D junto con la unidad estructural pirazol forman un radical derivado de pirazolo[1,5-a]pirazina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-a]pirazina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirazina, pirazolo[1,5-c]pirimidina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-c]pirimidina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-c]pirimidina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-c]pirimidina, pirazolo[1,5-b]piridazina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-b]piridazina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-b]piridazina y 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-b]piridazina.

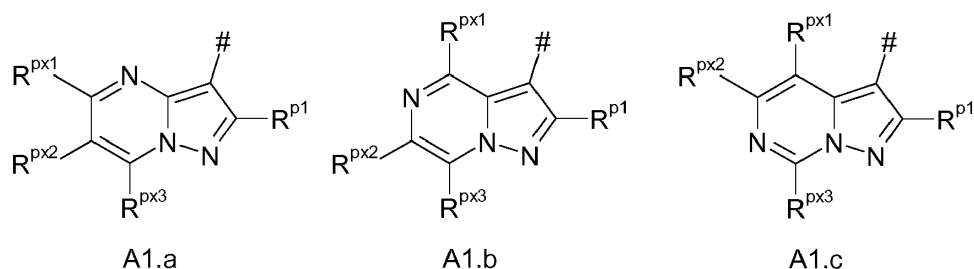
El término "radical derivado de" como se usa en este contexto se relaciona con radicales de fórmulas A1 y A2 que comprenden como estructura central el heterociclo fusionado indicado, en donde esta estructura central lleva los sustituyentes R^{p1}, R^{p2} y (R^{px})_n, así como el sitio de unión # como se indica para los radicales de fórmulas A1 y A1.

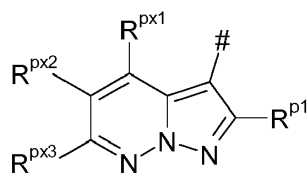
Una realización particular de la invención se refiere a compuestos de fórmulas I o II, en donde A es un radical A1.

En particular R^{p1} es hidrógeno.

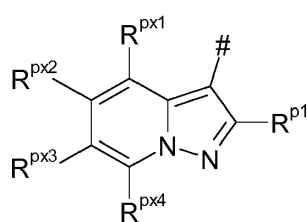
Ejemplos de radicales adecuados A1 se muestran en las tablas 1.1 a 1.11 más adelante.

Tabla 1.1: Ejemplos de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d o A1.e,





A1.d



A1.e

en donde

5 R^{p1} es hidrógeno y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.1a.1 a A1.1a.31, A1.1a.42 a A1.1a.91 y A1.1a.117 a A1.1a.141; radicales A1.1b.1 a A1.1b.31, A1.1b.42 a A1.1b.91 y A1.1b.117 a A1.1b.141; radicales A1.1c.1 a A1.1c.31, A1.1c.42 a A1.1c.91 y A1.1c.117 a A1.1c.141; radicales A1.1d.1 a A1.1d.31, A1.1d.42 a A1.1d.91 y A1.1d.117 a A1.1d.141) y en los radicales de fórmula A1.e, R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.1e.1 -A1.1e.191).

Tabla A

línea	R^{px1}	R^{px2}	R^{px3}	R^{px4} (*)
1	H	H	H	H
2	CH ₃	H	H	H
3	C ₂ H ₅	H	H	H
4	CH(CH ₃) ₂	H	H	H
5	ciclopropilo	H	H	H
6	CH ₂ F	H	H	H
7	CHF ₂	H	H	H
8	CF ₃	H	H	H
9	F	H	H	H
10	Cl	H	H	H
11	CN	H	H	H
12	H	CH ₃	H	H
13	H	C ₂ H ₅	H	H
14	H	CH(CH ₃) ₂	H	H
15	H	ciclopropilo	H	H
16	H	CH ₂ F	H	H
17	H	CHF ₂	H	H

ES 2 710 701 T3

line	R ^{px1}	R ^{px2}	R ^{px3}	R ^{px4} (*)
18	H	CF ₃	H	H
19	H	F	H	H
20	H	Cl	H	H
21	H	CN	H	H
22	H	H	CH ₃	H
23	H	H	C ₂ H ₅	H
24	H	H	CH(CH ₃) ₂	H
25	H	H	ciclopropilo	H
26	H	H	CH ₂ F	H
27	H	H	CHF ₂	H
28	H	H	CF ₃	H
29	H	H	F	H
30	H	H	Cl	H
31	H	H	CN	H
32	H	H	H	CH ₃
33	H	H	H	C ₂ H ₅
34	H	H	H	CH(CH ₃) ₂
35	H	H	H	ciclopropilo
36	H	H	H	CH ₂ F
37	H	H	H	CHF ₂
38	H	H	H	CF ₃
39	H	H	H	F
40	H	H	H	Cl
41	H	H	H	CN
42	CH ₃	CH ₃	H	H
43	CF ₃	CH ₃	H	H

ES 2 710 701 T3

line	R ^{px1}	R ^{px2}	R ^{px3}	R ^{px4} (*)
44	F	CH ₃	H	H
45	Cl	CH ₃	H	H
46	CN	CH ₃	H	H
47	CH ₃	CF ₃	H	H
48	CF ₃	CF ₃	H	H
49	F	CF ₃	H	H
50	Cl	CF ₃	H	H
51	CN	CF ₃	H	H
52	CH ₃	F	H	H
53	CF ₃	F	H	H
54	F	F	H	H
55	Cl	F	H	H
56	CN	F	H	H
57	CH ₃	Cl	H	H
58	CF ₃	Cl	H	H
59	F	Cl	H	H
60	Cl	Cl	H	H
61	CN	Cl	H	H
62	CH ₃	CN	H	H
63	CF ₃	CN	H	H
64	F	CN	H	H
65	Cl	CN	H	H
66	CN	CN	H	H
67	CH ₃	H	CH ₃	H
68	CF ₃	H	CH ₃	H
69	F	H	CH ₃	H

ES 2 710 701 T3

line	R ^{px1}	R ^{px2}	R ^{px3}	R ^{px4} (*)
70	Cl	H	CH ₃	H
71	CN	H	CH ₃	H
72	CH ₃	H	CF ₃	H
73	CF ₃	H	CF ₃	H
74	F	H	CF ₃	H
75	Cl	H	CF ₃	H
76	CN	H	CF ₃	H
77	CH ₃	H	F	H
78	CF ₃	H	F	H
79	F	H	F	H
80	Cl	H	F	H
81	CN	H	F	H
82	CH ₃	H	Cl	H
83	CF ₃	H	Cl	H
84	F	H	Cl	H
85	Cl	H	Cl	H
86	CN	H	Cl	H
87	CH ₃	H	CN	H
88	CF ₃	H	CN	H
89	F	H	CN	H
90	Cl	H	CN	H
91	CN	H	CN	H
92	CH ₃	H	H	CH ₃
93	CF ₃	H	H	CH ₃
94	F	H	H	CH ₃
95	Cl	H	H	CH ₃

ES 2 710 701 T3

line	R ^{px1}	R ^{px2}	R ^{px3}	R ^{px4} (*)
96	CN	H	H	CH ₃
97	CH ₃	H	H	CF ₃
98	CF ₃	H	H	CF ₃
99	F	H	H	CF ₃
100	Cl	H	H	CF ₃
101	CN	H	H	CF ₃
102	CH ₃	H	H	F
103	CF ₃	H	H	F
104	F	H	H	F
105	Cl	H	H	F
106	CN	H	H	F
107	CH ₃	H	H	Cl
108	CF ₃	H	H	Cl
109	F	H	H	Cl
110	Cl	H	H	Cl
111	CN	H	H	Cl
112	CH ₃	H	H	CN
113	CF ₃	H	H	CN
114	F	H	H	CN
115	Cl	H	H	CN
116	CN	H	H	CN
117	H	CH ₃	CH ₃	H
118	H	CF ₃	CH ₃	H
119	H	F	CH ₃	H
120	H	Cl	CH ₃	H
121	H	CN	CH ₃	H

ES 2 710 701 T3

line	R ^{px1}	R ^{px2}	R ^{px3}	R ^{px4} (*)
122	H	CH ₃	CF ₃	H
123	H	CF ₃	CF ₃	H
124	H	F	CF ₃	H
125	H	Cl	CF ₃	H
126	H	CN	CF ₃	H
127	H	CH ₃	F	H
128	H	CF ₃	F	H
129	H	F	F	H
130	H	Cl	F	H
131	H	CN	F	H
132	H	CH ₃	Cl	H
133	H	CF ₃	Cl	H
134	H	F	Cl	H
135	H	Cl	Cl	H
136	H	CN	Cl	H
137	H	CH ₃	CN	H
138	H	CF ₃	CN	H
139	H	F	CN	H
140	H	Cl	CN	H
141	H	CN	CN	H
142	H	CH ₃	H	CH ₃
143	H	CF ₃	H	CH ₃
144	H	F	H	CH ₃
145	H	Cl	H	CH ₃
146	H	CN	H	CH ₃
147	H	CH ₃	H	CF ₃

ES 2 710 701 T3

line	R ^{px1}	R ^{px2}	R ^{px3}	R ^{px4} (*)
148	H	CF ₃	H	CF ₃
149	H	F	H	CF ₃
150	H	Cl	H	CF ₃
151	H	CN	H	CF ₃
152	H	CH ₃	H	F
153	H	CF ₃	H	F
154	H	F	H	F
155	H	Cl	H	F
156	H	CN	H	F
157	H	CH ₃	H	Cl
158	H	CF ₃	H	Cl
159	H	F	H	Cl
160	H	Cl	H	Cl
161	H	CN	H	Cl
162	H	CH ₃	H	CN
163	H	CF ₃	H	CN
164	H	F	H	CN
165	H	Cl	H	CN
166	H	CN	H	CN
167	H	H	CH ₃	CH ₃
168	H	H	CF ₃	CH ₃
169	H	H	F	CH ₃
170	H	H	Cl	CH ₃
171	H	H	CN	CH ₃
172	H	H	CH ₃	CF ₃
173	H	H	CF ₃	CF ₃

ES 2 710 701 T3

line	R ^{px1}	R ^{px2}	R ^{px3}	R ^{px4} (*)
174	H	H	F	CF ₃
175	H	H	Cl	CF ₃
176	H	H	CN	CF ₃
177	H	H	CH ₃	F
178	H	H	CF ₃	F
179	H	H	F	F
180	H	H	Cl	F
181	H	H	CN	F
182	H	H	CH ₃	Cl
183	H	H	CF ₃	Cl
184	H	H	F	Cl
185	H	H	Cl	Cl
186	H	H	CN	Cl
187	H	H	CH ₃	CN
188	H	H	CF ₃	CN
189	H	H	F	CN
190	H	H	Cl	CN
191	H	H	CN	CN
(*) solamente para los radicales de fórmulas A1.e o A2.e				

5 Tabla 1.2: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es CH₃ y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1}, R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.2a.1 a A1.2a.31, A1.2a.42 a A1.2a.91 y A1.2a.117 a A1.2a.141; radicales A1.2b.1 a A1.2b.31, A1.2b.42 a A1.2b.91 y A1.2b.117 a A1.2b.141; radicales A1.2c.1 a A1.2c.31, A1.2c.42 a A1.2c.91 y A1.2c.117 a A1.2c.141; radicales A1.2d.1 a A1.2d.31, A1.2d.42 a A1.2d.91 y A1.2d.117 a A1.2d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1}, R^{px2}, R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.2e.1-A1.2e.191).

10 Tabla 1.3: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es C₂H₅ y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1}, R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.3a.1 a A1.3a.31, A1.3a.42 a A1.3a.91 y A1.3a.117 a A1.3a.141; radicales A1.3b.1 a A1.3b.31, A1.3b.42 a A1.3b.91 y A1.3b.117 a A1.3b.141; radicales A1.3c.1 a A1.3c.31, A1.3c.42 a A1.3c.91 y A1.3c.117 a A1.3c.141; radicales A1.3d.1 a A1.3d.31, A1.3d.42 a A1.3d.91 y A1.3d.117 a A1.3d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1}, R^{px2}, R^{px3} y R^{px4} son como se definen en
15 cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.3e.1-A1.3e.191).

Tabla 1.4: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es $CH(CH_3)_2$ y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.4a.1 a A1.4a.31, A1.4a.42 a A1.4a.91 y A1.4a.117 a A1.4a.141; radicales A1.4b.1 a A1.4b.31, A1.4b.42 a A1.4b.91 y A1.4b.117 a A1.4b.141; radicales A1.4c.1 a A1.4c.31, A1.4c.42 a A1.4c.91 y A1.4c.117 a A1.4c.141; radicales A1.4d.1 a A1.4d.31, A1.4d.42 a A1.4d.91 y A1.4d.117 a A1.4d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.4e.1-A1.4e.191).

Tabla 1.5: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es ciclopropilo y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.5a.1 a A1.5a.31, A1.5a.42 a A1.5a.91 y A1.5a.117 a A1.5a.141; radicales A1.5b.1 a A1.5b.31, A1.5b.42 a A1.5b.91 y A1.5b.117 a A1.5b.141; radicales A1.5c.1 a A1.5c.31, A1.5c.42 a A1.5c.91 y A1.5c.117 a A1.5c.141; radicales A1.5d.1 a A1.5d.31, A1.5d.42 a A1.5d.91 y A1.5d.117 a A1.5d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.5e.1-A1.5e.191).

Tabla 1.6: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es CH_2F y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.6a.1 a A1.6a.31, A1.6a.42 a A1.6a.91 y A1.6a.117 a A1.6a.141; radicales A1.6b.1 a A1.6b.31, A1.6b.42 a A1.6b.91 y A1.6b.117 a A1.6b.141; radicales A1.6c.1 a A1.6c.31, A1.6c.42 a A1.6c.91 y A1.6c.117 a A1.6c.141; radicales A1.6d.1 a A1.6d.31, A1.6d.42 a A1.6d.91 y A1.6d.117 a A1.6d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.6e.1-A1.6e.191).

Tabla 1.7: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es CHF_2 y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.7a.1 a A1.7a.31, A1.7a.42 a A1.7a.91 y A1.7a.117 a A1.7a.141; radicales A1.7b.1 a A1.7b.31, A1.7b.42 a A1.7b.91 y A1.7b.117 a A1.7b.141; radicales A1.7c.1 a A1.7c.31, A1.7c.42 a A1.7c.91 y A1.7c.117 a A1.7c.141; radicales A1.7d.1 a A1.7d.31, A1.7d.42 a A1.7d.91 y A1.7d.117 a A1.7d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.7e.1-A1.7e.191).

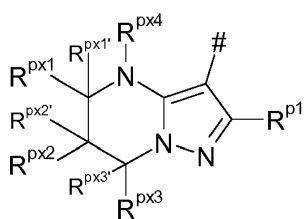
Tabla 1.8: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es CF_3 y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.8a.1 a A1.8a.31, A1.8a.42 a A1.8a.91 y A1.8a.117 a A1.8a.141; radicales A1.8b.1 a A1.8b.31, A1.8b.42 a A1.8b.91 y A1.8b.117 a A1.8b.141; radicales A1.8c.1 a A1.8c.31, A1.8c.42 a A1.8c.91 y A1.8c.117 a A1.8c.141; radicales A1.8d.1 a A1.8d.31, A1.8d.42 a A1.8d.91 y A1.8d.117 a A1.8d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.8e.1-A1.8e.191).

Tabla 1.9: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es F y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.9a.1 a A1.9a.31, A1.9a.42 a A1.9a.91 y A1.9a.117 a A1.9a.141; radicales A1.9b.1 a A1.9b.31, A1.9b.42 a A1.9b.91 y A1.9b.117 a A1.9b.141; radicales A1.9c.1 a A1.9c.31, A1.9c.42 a A1.9c.91 y A1.9c.117 a A1.9c.141; radicales A1.9d.1 a A1.9d.31, A1.9d.42 a A1.9d.91 y A1.9d.117 a A1.9d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.9e.1-A1.9e.191).

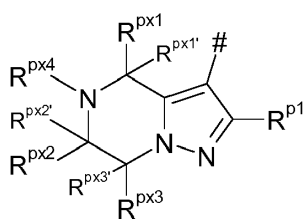
Tabla 1.10: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es Cl y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.10a.1 a A1.10a.31, A1.10a.42 a A1.10a.91 y A1.10a.117 a A1.10a.141; radicales A1.10b.1 a A1.10b.31, A1.10b.42 a A1.10b.91 y A1.10b.117 a A1.10b.141; radicales A1.10c.1 a A1.10c.31, A1.10c.42 a A1.10c.91 y A1.10c.117 a A1.10c.141; radicales A1.10d.1 a A1.10d.31, A1.10d.42 a A1.10d.91 y A1.10d.117 a A1.10d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.10e.1-A1.10e.191).

Tabla 1.11: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c, A1.d y A1.e, en donde R^{p1} es CN y en los radicales de las fórmulas A1.a, A1.b, A1.c o A1.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A1.11a.1 a A1.11a.31, A1.11a.42 a A1.11a.91 y A1.11a.117 a A1.11a.141; radicales A1.11b.1 a A1.11b.31, A1.11b.42 a A1.11b.91 y A1.11b.117 a A1.11b.141; radicales A1.11c.1 a A1.11c.31, A1.11c.42 a A1.11c.91 y A1.11c.117 a A1.11c.141; radicales A1.11d.1 a A1.11d.31, A1.11d.42 a A1.11d.91 y A1.11d.117 a A1.11d.141) y en los radicales de fórmula A1.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.11e.1-A1.11e.191).

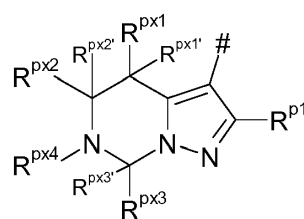
Tabla 1.12: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k,



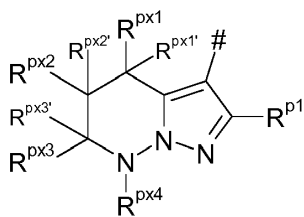
A1.f



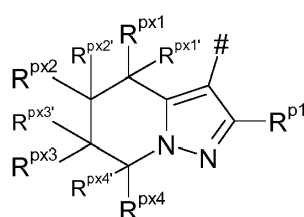
A1.g



A1.h



A1.i



A1.k

en donde R^{p1} , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.12f.1 a A1.12f.191; radicales A1.12g.1 a A1.12g.191; radicales A1.12h.1 a A1.12h.191; radicales A1.12i.1 a A1.12i.191; radicales A1.12k.1 a A1.12k.191).

5

Tabla 1.13: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es CH_3 , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.13f.1 a A1.13f.191; radicales A1.13g.1 a A1.13g.191; radicales A1.13h.1 a A1.13h.191; radicales A1.13i.1 a A1.13i.191; radicales A1.13k.1 a A1.13k.191).

Tabla 1.14: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es C_2H_5 , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.14f.1 a A1.14f.191; radicales A1.14g.1 a A1.14g.191; radicales A1.14h.1 a A1.14h.191; radicales A1.14i.1 a A1.14i.191; radicales A1.14k.1 a A1.14k.191).

10

Tabla 1.15: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es $CH(CH_3)_2$, R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.15f.1 a A1.15f.191; radicales A1.15g.1 a A1.15g.191; radicales A1.15h.1 a A1.15h.191; radicales A1.15i.1 a A1.15i.191; radicales A1.15k.1 a A1.15k.191).

15

Tabla 1.16: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es ciclopropilo, R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.16f.1 a A1.16f.191; radicales A1.16g.1 a A1.16g.191; radicales A1.16h.1 a A1.16h.191; radicales A1.16i.1 a A1.16i.191; radicales A1.16k.1 a A1.16k.191).

20

Tabla 1.17: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es CH_2F , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.17f.1 a A1.17f.191; radicales A1.17g.1 a A1.17g.191; radicales A1.17h.1 a A1.17h.191; radicales A1.17i.1 a A1.17i.191; radicales A1.17k.1 a A1.17k.191).

25

Tabla 1.18: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es CHF_2 , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.18f.1 a A1.18f.191; radicales A1.18g.1 a A1.18g.191; radicales A1.18h.1 a A1.18h.191; radicales A1.18i.1 a A1.18i.191; radicales A1.18k.1 a A1.18k.191).

Tabla 1.19: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es CF_3 , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.19f.1 a A1.19f.191; radicales A1.19g.1 a A1.19g.191; radicales A1.19h.1 a A1.19h.191; radicales A1.19i.1 a A1.19i.191; radicales A1.19k.1 a A1.19k.191).

30

Tabla 1.20: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es F , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.20f.1 a A1.20f.191; radicales A1.20g.1 a A1.20g.191; radicales A1.20h.1 a A1.20h.191; radicales A1.20i.1 a A1.20i.191; radicales A1.20k.1 a A1.220k.191).

35

Tabla 1.21: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es Cl , R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en

cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.21f.1 a A1.21f.191; radicales A1.21g.1 a A1.21g.191; radicales A1.21h.1 a A1.21h.191; radicales A1.21i.1 a A1.21i.191; radicales A1.21k.1 a A1.21k.191).

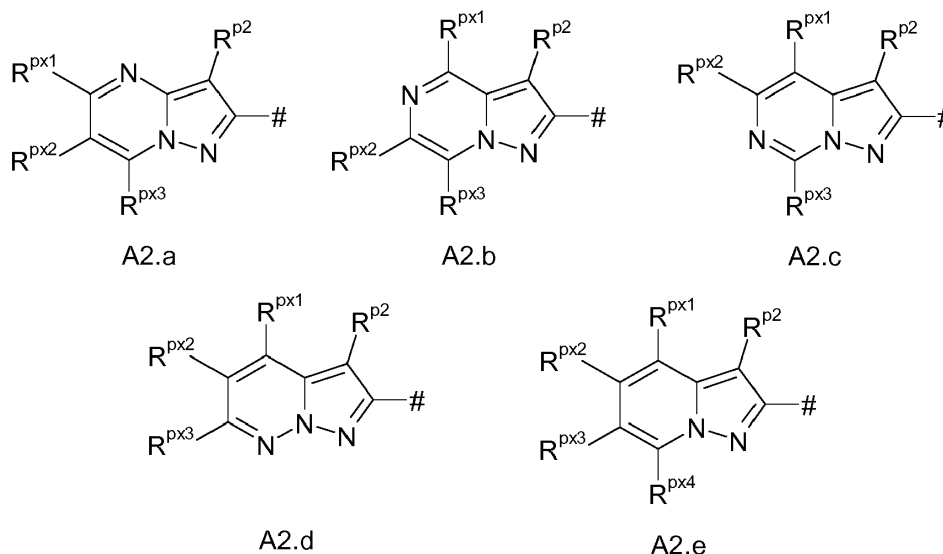
5 Tabla 1.22: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A1 son los radicales de las fórmulas A1.f, A1.g, A1.h, A1.i o A1.k, en donde R^{p1} es CN, R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A1.22f.1 a A1.22f.191; radicales A1.22g.1 a A1.22g.191; radicales A1.22h.1 a A1.22h.191; radicales A1.22i.1 a A1.22i.191; radicales A1.22k.1 a A1.22k.191).

Otra realización particular de la invención se refiere a compuestos de fórmulas I o II, en donde A es un radical A2.

En particular R^{p2} es hidrógeno.

Ejemplos de radicales adecuados A2 se muestran en las tablas 2.1 a 2.11 más adelante.

10 Tabla 2.1: Ejemplos de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e,



en donde

15 R^{p2} es hidrógeno y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.1a.1 a A2.1a.31, A2.1a.42 a A2.1a.91 y A2.1a.117 a A2.1a.141; radicales A2.1b.1 a A2.1b.31, A2.1b.42 a A2.1b.91 y A2.1b.117 a A2.1b.141; radicales A2.1c.1 a A2.1c.31, A2.1c.42 a A2.1c.91 y A2.1c.117 a A2.1c.141; radicales A2.1d.1 a A2.1d.31, A2.1d.42 a A2.1d.91 y A2.1d.117 a A2.1d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.1e.1 a A2.1e.191).

20 Tabla 2.2: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es CH_3 y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.2a.1 a A2.2a.31, A2.2a.42 a A2.2a.91 y A2.2a.117 a A2.2a.141; radicales A2.2b.1 a A2.2b.31, A2.2b.42 a A2.2b.91 y A2.2b.117 a A2.2b.141; radicales A2.2c.1 a A2.2c.31, A2.2c.42 a A2.2c.91 y A2.2c.117 a A2.2c.141; radicales A2.2d.1 a A2.2d.31, A2.2d.42 a A2.2d.91 y A2.2d.117 a A2.2d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.2e.1 a A2.2e.191).

30 Tabla 2.3: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es C_2H_5 y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.3a.1 a A2.3a.31, A2.3a.42 a A2.3a.91 y A2.3a.117 a A2.3a.141; radicales A2.3b.1 a A2.3b.31, A2.3b.42 a A2.3b.91 y A2.3b.117 a A2.3b.141; radicales A2.3c.1 a A2.3c.31, A2.3c.42 a A2.3c.91 y A2.3c.117 a A2.3c.141; radicales A2.3d.1 a A2.3d.31, A2.3d.42 a A2.3d.91 y A2.3d.117 a A2.3d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.3e.1 a A2.3e.191).

35 Tabla 2.4: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es $CH(CH_3)_2$ y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.4a.1 a A2.4a.31, A2.4a.42 a A2.4a.91 y A2.4a.117 a A2.4a.141; radicales A2.4b.1 a A2.4b.31, A2.4b.42 a A2.4b.91 y A2.4b.117 a A2.4b.141; radicales A2.4c.1 a A2.4c.31, A2.4c.42 a A2.4c.91 y A2.4c.117 a A2.4c.141; radicales A2.4d.1 a A2.4d.31, A2.4d.42 a A2.4d.91 y A2.4d.117 a A2.4d.141).

A2.4d.91 y A2.4d.117 a A2.4d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.4e.1 a A2.4e.191).

5 Tabla 2.5: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es ciclopropilo y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.5a.1 a A2.5a.31, A2.5a.42 a A2.5a.91 y A2.5a.117 a A2.5a.141; radicales A2.5b.1 a A2.5b.31, A2.5b.42 a A2.5b.91 y A2.5b.117 a A2.5b.141; radicales A2.5c.1 a A2.5c.31, A2.5c.42 a A2.5c.91 y A2.5c.117 a A2.5c.141; radicales A2.5d.1 a A2.5d.31, A2.5d.42 a A2.5d.91 y A2.5d.117 a A2.5d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.5e.1 a A2.5e.191).

10 Tabla 2.6: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es CH_2F y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.6a.1 a A2.6a.31, A2.6a.42 a A2.6a.91 y A2.6a.117 a A2.6a.141; radicales A2.6b.1 a A2.6b.31, A2.6b.42 a A2.6b.91 y A2.6b.117 a A2.6b.141; radicales A2.6c.1 a A2.6c.31, A2.6c.42 a A2.6c.91 y A2.6c.117 a A2.6c.141; radicales A2.6d.1 a A2.6d.31, A2.6d.42 a A2.6d.91 y A2.6d.117 a A2.6d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.6e.1 a A2.6e.191).

20 Tabla 2.7: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es CHF_2 y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.7a.1 a A2.7a.31, A2.7a.42 a A2.7a.91 y A2.7a.117 a A2.7a.141; radicales A2.7b.1 a A2.7b.31, A2.7b.42 a A2.7b.91 y A2.7b.117 a A2.7b.141; radicales A2.7c.1 a A2.7c.31, A2.7c.42 a A2.7c.91 y A2.7c.117 a A2.7c.141; radicales A2.7d.1 a A2.7d.31, A2.7d.42 a A2.7d.91 y A2.7d.117 a A2.7d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.7e.1 a A2.7e.191).

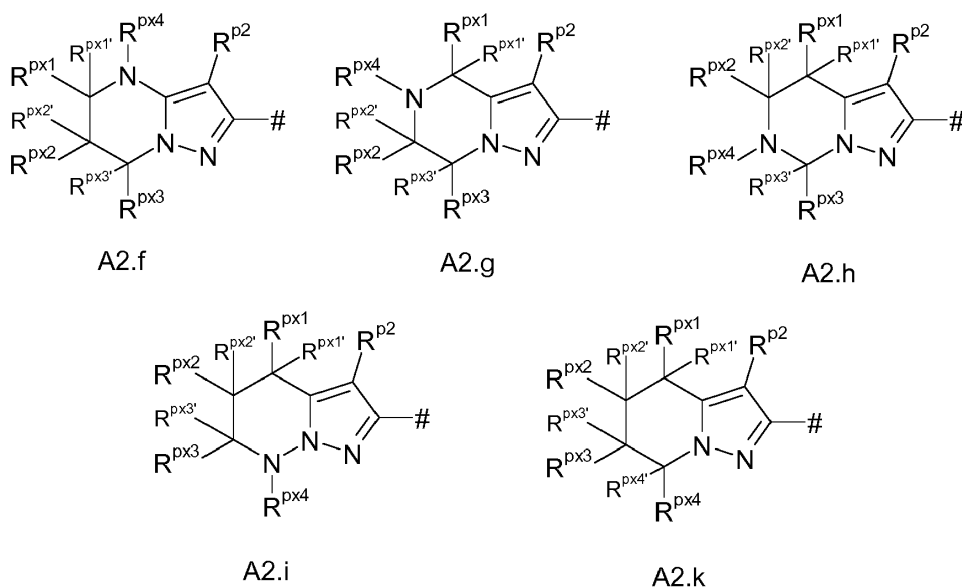
25 Tabla 2.8: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es CF_3 y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.8a.1 a A2.8a.31, A2.8a.42 a A2.8a.91 y A2.8a.117 a A2.8a.141; radicales A2.8b.1 a A2.8b.31, A2.8b.42 a A2.8b.91 y A2.8b.117 a A2.8b.141; radicales A2.8c.1 a A2.8c.31, A2.8c.42 a A2.8c.91 y A2.8c.117 a A2.8c.141; radicales A2.8d.1 a A2.8d.31, A2.8d.42 a A2.8d.91 y A2.8d.117 a A2.8d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.8e.1 a A2.8e.191).

30 Tabla 2.9: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es F y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.9a.1 a A2.9a.31, A2.9a.42 a A2.9a.91 y A2.9a.117 a A2.9a.141; radicales A2.9b.1 a A2.9b.31, A2.9b.42 a A2.9b.91 y A2.9b.117 a A2.9b.141; radicales A2.9c.1 a A2.9c.31, A2.9c.42 a A2.9c.91 y A2.9c.117 a A2.9c.141; radicales A2.9d.1 a A2.9d.31, A2.9d.42 a A2.9d.91 y A2.9d.117 a A2.9d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.9e.1 a A2.9e.191).

40 Tabla 2.10: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es Cl y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.10a.1 a A2.10a.31, A2.10a.42 a A2.10a.91 y A2.10a.117 a A2.10a.141; radicales A2.10b.1 a A2.10b.31, A2.10b.42 a A2.10b.91 y A2.10b.117 a A2.10b.141; radicales A2.10c.1 a A2.10c.31, A2.10c.42 a A2.10c.91 y A2.10c.117 a A2.10c.141; radicales A2.10d.1 a A2.10d.31, A2.10d.42 a A2.10d.91 y A2.10d.117 a A2.10d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} and R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.10e.1 a A2.10e.191).

45 Tabla 2.11: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e, en donde R^{p2} es CN y en los radicales de las fórmulas A2.a, A2.b, A2.c o A2.d R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 31, 42 a 91 y 117 a 141 de la tabla A (radicales A2.11a.1 a A2.11a.31, A2.11a.42 a A2.11a.91 y A2.11a.117 a A2.11a.141; radicales A2.11b.1 a A2.11b.31, A2.11b.42 a A2.11b.91 y A2.11b.117 a A2.11b.141; radicales A2.11c.1 a A2.11c.31, A2.11c.42 a A2.11c.91 y A2.11c.117 a A2.11c.141; radicales A2.11d.1 a A2.11d.31, A2.11d.42 a A2.11d.91 y A2.11d.117 a A2.11d.141) y en los radicales de fórmula A2.e R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.11e.1 a A2.11e.191).

50 Tabla 2.12: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k,



en donde R^{p2} , $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.12f.1 a A2.12f.191; radicales A2.12g.1 a A2.12g.191; radicales A2.12h.1 a A2.12h.191; radicales A2.12i.1 a A2.12i.191; radicales A2.12k.1 a A2.12k.191).

Tabla 2.13: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es CH_3 , $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.13f.1 a A2.13f.191; radicales A2.13g.1 a A2.13g.191; radicales A2.13h.1 a A2.13h.191; radicales A2.13i.1 a A2.13i.191; radicales A2.13k.1 a A2.13k.191).

Tabla 2.14: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es C_2H_5 , $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.14f.1 a A2.14f.191; radicales A2.14g.1 a A2.14g.191; radicales A2.14h.1 a A2.14h.191; radicales A2.14i.1 a A2.14i.191; radicales A2.14k.1 a A2.14k.191).

Tabla 2.15: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es $CH(CH_3)_2$, $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.15f.1 a A2.15f.191; radicales A2.15g.1 a A2.15g.191; radicales A2.15h.1 a A2.15h.191; radicales A2.15i.1 a A2.15i.191; radicales A2.15k.1 a A2.15k.191).

Tabla 2.16: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es ciclopropilo, $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.16f.1 a A2.16f.191; radicales A2.16g.1 a A2.16g.191; radicales A2.16h.1 a A2.16h.191; radicales A2.16i.1 a A2.16i.191; radicales A2.16k.1 a A2.16k.191).

Tabla 2.17: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es CH_2F , $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.17f.1 a A2.17f.191; radicales A2.17g.1 a A2.17g.191; radicales A2.17h.1 a A2.17h.191; radicales A2.17i.1 a A2.17i.191; radicales A2.17k.1 a A2.17k.191).

Tabla 2.18: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es CHF_2 , $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.18f.1 a A2.18f.191; radicales A2.18g.1 a A2.18g.191; radicales A2.18h.1 a A2.18h.191; radicales A2.18i.1 a A2.18i.191; radicales A2.18k.1 a A2.18k.191).

Tabla 2.19: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es CF_3 , $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.19f.1 a A2.19f.191; radicales A2.19g.1 a A2.19g.191; radicales A2.19h.1 a A2.19h.191; radicales A2.19i.1 a A2.19i.191; radicales A2.19k.1 a A2.19k.191).

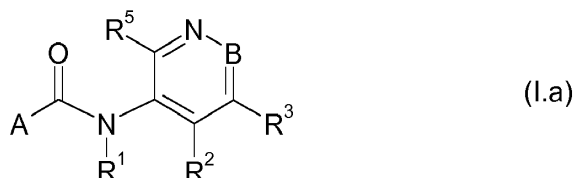
Tabla 2.20: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es F, $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.20f.1 a A2.20f.191; radicales A2.20g.1 a A2.20g.191; radicales A2.20h.1 a A2.20h.191; radicales A2.20i.1 a A2.20i.191; radicales A2.20k.1 a A2.220k.191).

Tabla 2.21: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es Cl, $R^{px1'}$, $R^{px2'}$ y $R^{px3'}$ y $R^{px4'}$ son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en

cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.21f.1 a A2.21f.191; radicales A2.21g.1 a A2.21g.191; radicales A2.21h.1 a A2.21h.191; radicales A2.21i.1 a A2.21i.191; radicales A2.21k.1 a A2.21k.191).

5 Tabla 1.22: Ejemplos adicionales de radicales adecuados A2 son los radicales de las fórmulas A2.f, A2.g, A2.h, A2.i o A2.k, en donde R^{p2} es CN, R^{px1} , R^{px2} y R^{px3} y R^{px4} son hidrógeno y R^{px1} , R^{px2} , R^{px3} y R^{px4} son como se definen en cualquiera de las líneas 1 a 191 de la tabla A (radicales A2.22f.1 a A2.22f.191; radicales A2.22g.1 a A2.22g.191; radicales A2.22h.1 a A2.22h.191; radicales A2.22i.1 a A2.22i.191; radicales A2.22k.1 a A2.22k.191).

Una realización muy preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula I y a sus sales o N-óxidos, en donde X^1 es O. Estos compuestos se denominan en lo sucesivo como compuestos.I.a.



10 En la fórmula I.a, las variables A, B, R^1 , R^2 , R^3 y R^5 son como se definió anteriormente.

Una realización preferida particular de la presente invención se refiere a compuestos de la fórmula I.a y a sus sales o N-óxidos, en donde

15 A es un radical A1, como se definió anteriormente, en particular un radical A1 en donde D, n, R^{px} y R^{p1} tienen uno de los significados preferidos, más particularmente un radical A1.a, A1.b, A1.c, A1.d o A1.e como se define en cualquiera de las tablas 1.1 a 1.11, por ejemplo un radical seleccionado de los radicales pirazol A1.1a.1 a A1.11a.141 o A1.1b.1 a A1.11b.141;

R^1 es lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R^2 hidrógeno;

R^3 hidrógeno;

20 R^5 es hidrógeno; y

B es N o CH.

Ejemplos de compuestos de esta realización preferida particular son los compuestos como se definen en las siguientes tablas 3 a 442.

25 Tabla 3: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R^1 , R^2 , R^3 y R^5 son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1a.1 a A1.1a.31, A1.1a.42 a A1.1a.91 y A1.1a.117 a A1.1a.141, como se define en la tabla 1.1.

Tabla 4: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R^1 , R^2 , R^3 y R^5 son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1a.1 a A1.1a.31, A1.1a.42 a A1.1a.91 y A1.1a.117 a A1.1a.141, como se define en la tabla 1.1.

30 Tabla 5: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R^1 es CH_3 , R^2 , R^3 y R^5 son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1a.1 a A1.1a.31, A1.1a.42 a A1.1a.91 y A1.1a.117 a A1.1a.141, como se define en la tabla 1.1.

35 Tabla 6: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R^1 es CH_3 , R^2 , R^3 y R^5 son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1a.1 a A1.1a.31, A1.1a.42 a A1.1a.91 y A1.1a.117 a A1.1a.141, como se define en la tabla 1.1.

Tabla 7: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R^1 , R^2 , R^3 y R^5 son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1b.1 a A1.1b.31, A1.1b.42 a A1.1b.91 y A1.1b.117 a A1.1b.141, como se define en la tabla 1.1.

40 Tabla 8: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R^1 , R^2 , R^3 y R^5 son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1b.1 a A1.1b.31, A1.1b.42 a A1.1b.91 y A1.1b.117 a A1.1b.141, como se define en la tabla 1.1.

Tabla 9: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R^1 es CH_3 , R^2 , R^3 y R^5 son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1b.1 a A1.1b.31, A1.1b.42 a A1.1b.91 y A1.1b.117 a A1.1b.141, como se define en la tabla 1.1.

- Tabla 10: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1b.1 a A1.1b.31, A1.1b.42 a A1.1b.91 y A1.1b.117 a A1.1b.141, como se define en la tabla 1.1.
- 5 Tabla 11: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1c.1 a A1.1c.31, A1.1c.42 a A1.1c.91 y A1.1c.117 a A1.1c.141, como se define en la tabla 1.1.
- Tabla 12: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1c.1 a A1.1c.31, A1.1c.42 a A1.1c.91 y A1.1c.117 a A1.1c.141, como se define en la tabla 1.1.
- 10 Tabla 13: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1c.1 a A1.1c.31, A1.1c.42 a A1.1c.91 y A1.1c.117 a A1.1c.141, como se define en la tabla 1.1.
- Tabla 14: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1c.1 a A1.1c.31, A1.1c.42 a A1.1c.91 y A1.1c.117 a A1.1c.141, como se define en la tabla 1.1.
- 15 Tabla 15: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1d.1 a A1.1d.31, A1.1d.42 a A1.1d.91 y A1.1d.117 a A1.1d.141, como se define en la tabla 1.1.
- Tabla 16: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1d.1 a A1.1d.31, A1.1d.42 a A1.1d.91 y A1.1d.117 a A1.1d.141, como se define en la tabla 1.1.
- 20 Tabla 17: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1d.1 a A1.1d.31, A1.1d.42 a A1.1d.91 y A1.1d.117 a A1.1d.141, como se define en la tabla 1.1.
- 25 Tabla 18: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.1d.1 a A1.1d.31, A1.1d.42 a A1.1d.91 y A1.1d.117 a A1.1d.141, como se define en la tabla 1.1.
- Tabla 19: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales radicales A1.1e.1-A1.1e.191, como se define en la tabla 1.1.
- 30 Tabla 20: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales radicales A1.1e.1-A1.1e.191, como se define en la tabla 1.1.
- Tabla 21: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales radicales A1.1e.1-A1.1e.191, como se define en la tabla 1.1.
- 35 Tabla 22: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales radicales A1.1e.1-A1.1e.191, como se define en la tabla 1.1.
- 40 Tablas 23 a 42: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.2, es decir los radicales A1.2a.1 a A1.2a.31, A1.2a.42 a A1.2a.91 y A1.2a.117 a A1.2a.141, o los radicales A1.2b.1 a A1.2b.31, A1.2b.42 a A1.2b.91 y A1.2b.117 a A1.2b.141, o los radicales A1.2c.1 a A1.2c.31, A1.2c.42 a A1.2c.91 y A1.2c.117 a A1.2c.141, o los radicales A1.2d.1 a A1.2d.31, A1.2d.42 a A1.2d.91 y A1.2d.117 a A1.2d.141, o los radicales A1.2e.1 a A1.2e.191.
- 45 Tablas 43 a 62: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.3, es decir los radicales A1.3a.1 a A1.3a.31, A1.3a.42 a A1.3a.91 y A1.3a.117 a A1.3a.141, o los radicales A1.3b.1 a A1.3b.31, A1.3b.42 a A1.3b.91 y A1.3b.117 a A1.3b.141, o los radicales A1.3c.1 a A1.3c.31, A1.3c.42 a A1.3c.91 y A1.3c.117 a A1.3c.141, o los radicales A1.3d.1 a A1.3d.31, A1.3d.42 a A1.3d.91 y A1.3d.117 a A1.3d.141, o los radicales A1.3e.1 a A1.3e.191.
- 50 Tablas 63 a 82: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.4, es decir los radicales A1.4a.1 a A1.4a.31, A1.4a.42 a A1.4a.91 y A1.4a.117 a A1.4a.141, o los radicales A1.4b.1 a

A1.4b.31, A1.4b.42 a A1.4b.91 y A1.4b.117 a A1.4b.141, o los radicales A1.4c.1 a A1.4c.31, A1.4c.42 a A1.4c.91 y A1.4c.117 a A1.4c.141, o los radicales A1.4d.1 a A1.4d.31, A1.4d.42 a A1.4d.91 y A1.4d.117 a A1.4d.141, o los radicales A1.4e.1 a A1.4e.191.

5 Tablas 83 a 102: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.5, es decir los radicales A1.5a.1 a A1.5a.31, A1.5a.42 a A1.5a.91 y A1.5a.117 a A1.5a.141, o los radicales A1.5b.1 a A1.5b.31, A1.5b.42 a A1.5b.91 y A1.5b.117 a A1.5b.141, o los radicales A1.5c.1 a A1.5c.31, A1.5c.42 a A1.5c.91 y A1.5c.117 a A1.5c.141, o los radicales A1.5d.1 a A1.5d.31, A1.5d.42 a A1.5d.91 y A1.5d.117 a A1.5d.141, o los radicales A1.5e.1 a A1.5e.191.

10 Tablas 103 a 122: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.6, es decir los radicales A1.6a.1 a A1.6a.31, A1.6a.42 a A1.6a.91 y A1.6a.117 a A1.6a.141, o los radicales A1.6b.1 a A1.6b.31, A1.6b.42 a A1.6b.91 y A1.6b.117 a A1.6b.141, o los radicales A1.6c.1 a A1.6c.31, A1.6c.42 a A1.6c.91 y A1.6c.117 a A1.6c.141, o los radicales A1.6d.1 a A1.6d.31, A1.6d.42 a A1.6d.91 y A1.6d.117 a A1.6d.141, o los radicales A1.6e.1 a A1.6e.191.

20 Tablas 123 a 142: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.7, es decir los radicales A1.7a.1 a A1.7a.31, A1.7a.42 a A1.7a.91 y A1.7a.117 a A1.7a.141, o los radicales A1.7b.1 a A1.7b.31, A1.7b.42 a A1.7b.91 y A1.7b.117 a A1.7b.141, o los radicales A1.7c.1 a A1.7c.31, A1.7c.42 a A1.7c.91 y A1.7c.117 a A1.7c.141, o los radicales A1.7d.1 a A1.7d.31, A1.7d.42 a A1.7d.91 y A1.7d.117 a A1.7d.141, o los radicales A1.7e.1 a A1.7e.191.

25 Tablas 143 a 162: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.8, es decir los radicales A1.8a.1 a A1.8a.31, A1.8a.42 a A1.8a.91 y A1.8a.117 a A1.8a.141, o los radicales A1.8b.1 a A1.8b.31, A1.8b.42 a A1.8b.91 y A1.8b.117 a A1.8b.141, o los radicales A1.8c.1 a A1.8c.31, A1.8c.42 a A1.8c.91 y A1.8c.117 a A1.8c.141, o los radicales A1.8d.1 a A1.8d.31, A1.8d.42 a A1.8d.91 y A1.8d.117 a A1.8d.141, o los radicales A1.8e.1 a A1.8e.191.

30 Tablas 163 a 182: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.9, es decir los radicales A1.9a.1 a A1.9a.31, A1.9a.42 a A1.9a.91 y A1.9a.117 a A1.9a.141, o los radicales A1.9b.1 a A1.9b.31, A1.9b.42 a A1.9b.91 y A1.9b.117 a A1.9b.141, o los radicales A1.9c.1 a A1.9c.31, A1.9c.42 a A1.9c.91 y A1.9c.117 a A1.9c.141, o los radicales A1.9d.1 a A1.9d.31, A1.9d.42 a A1.9d.91 y A1.9d.117 a A1.9d.141, o los radicales A1.9e.1 a A1.9e.191.

35 Tablas 183 a 202: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.10, es decir los radicales A1.10a.1 a A1.10a.31, A1.10a.42 a A1.10a.91 y A1.10a.117 a A1.10a.141, o los radicales A1.10b.1 a A1.10b.31, A1.10b.42 a A1.10b.91 y A1.10b.117 a A1.10b.141, o los radicales A1.10c.1 a A1.10c.31, A1.10c.42 a A1.10c.91 y A1.10c.117 a A1.10c.141, o los radicales A1.10d.1 a A1.10d.31, A1.10d.42 a A1.10d.91 y A1.10d.117 a A1.10d.141, o los radicales A1.10e.1 a A1.10e.191.

40 Tablas 203 a 222: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.11, es decir los radicales A1.11a.1 a A1.11a.31, A1.11a.42 a A1.11a.91 y A1.11a.117 a A1.11a.141, o los radicales A1.11b.1 a A1.11b.31, A1.11b.42 a A1.11b.91 y A1.11b.117 a A1.11b.141, o los radicales A1.11c.1 a A1.11c.31, A1.11c.42 a A1.11c.91 y A1.11c.117 a A1.11c.141, o los radicales A1.11d.1 a A1.11d.31, A1.11d.42 a A1.11d.91 y A1.11d.117 a A1.11d.141, o los radicales A1.11e.1 a A1.11e.191.

Tabla 223: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12f.1 a A1.12f.191, como se define en la tabla 1.12.

50 Tabla 224: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12f.1 a A1.12f.191, como se define en la tabla 1.12.

Tabla 225: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12f.1 a A1.12f.191, como se define en la tabla 1.12.

55 Tabla 226: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12f.1 a A1.12f.191, como se define en la tabla 1.12.

- Tabla 227: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12g.1 a A1.12g.191, como se define en la tabla 1.12.
- 5 Tabla 228: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12g.1 a A1.12g.191, como se define en la tabla 1.12.
- Tabla 229: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12g.1 a A1.12g.191, como se define en la tabla 1.12.
- 10 Tabla 230: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12g.1 a A1.12g.191, como se define en la tabla 1.12.
- 15 Tabla 231: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12h.1 a A1.12h.191, como se define en la tabla 1.12.
- Tabla 232: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12h.1 a A1.12h.191, como se define en la tabla 1.12.
- 20 Tabla 233: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12h.1 a A1.12h.191, como se define en la tabla 1.12.
- Tabla 234: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12h.1 a A1.12h.191, como se define en la tabla 1.12.
- 25 Tabla 235: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12i.1 a A1.12i.191, como se define en la tabla 1.12.
- 30 Tabla 236: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12i.1 a A1.12i.191, como se define en la tabla 1.12.
- Tabla 237: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12i.1 a A1.12i.191, como se define en la tabla 1.12.
- 35 Tabla 238: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12i.1 a A1.12i.191, como se define en la tabla 1.12.
- Tabla 239: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12k.1 a A1.12k.191, como se define en la tabla 1.12.
- 40 Tabla 240: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12k.1 a A1.12k.191, como se define en la tabla 1.12.
- 45 Tabla 241: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12k.1 a A1.12k.191, como se define en la tabla 1.12.
- Tabla 242: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A1 seleccionado de los radicales A1.12k.1 a A1.12k.191, como se define en la tabla 1.12.
- 50 Tablas 243 a 262: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.13, es decir los radicales radicales A1.13f.1 a A1.13f.191; o los radicales A1.13g.1 a A1.13g.191; o los radicales A1.13h.1 a A1.13h.191; o los radicales A1.13i.1 a A1.13i.191; o los radicales A1.13k.1 a A1.13k.191.

Tablas 263 a 282: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.14, es decir los radicales radicales A1.14f.1 a A1.14f.191; o los radicales A1.14g.1 a A1.14g.191; o los radicales A1.14h.1 a A1.14h.191; o los radicales A1.14i.1 a A1.14i.191; o los radicales A1.14k.1 a A1.14k.191.

- 5 Tablas 283 a 302: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.15, es decir los radicales radicales A1.15f.1 a A1.15f.191; o los radicales A1.15g.1 a A1.15g.191; o los radicales A1.15h.1 a A1.15h.191; o los radicales A1.15i.1 a A1.15i.191; o los radicales A1.15k.1 a A1.15k.191.

- 10 Tablas 303 a 322: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.16, es decir los radicales radicales A1.16f.1 a A1.16f.191; o los radicales A1.16g.1 a A1.16g.191; o los radicales A1.16h.1 a A1.16h.191; o los radicales A1.16i.1 a A1.16i.191; o los radicales A1.16k.1 a A1.16k.191.

- 15 Tablas 323 a 342: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.17, es decir los radicales radicales A1.17f.1 a A1.17f.191; o los radicales A1.17g.1 a A1.17g.191; o los radicales A1.17h.1 a A1.17h.191; o los radicales A1.17i.1 a A1.17i.191; o los radicales A1.17k.1 a A1.17k.191.

- 20 Tablas 343 a 362: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.18, es decir los radicales radicales A1.18f.1 a A1.18f.191; o los radicales A1.18g.1 a A1.18g.191; o los radicales A1.18h.1 a A1.18h.191; o los radicales A1.18i.1 a A1.18i.191; o los radicales A1.18k.1 a A1.18k.191.

Tablas 363 a 382: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.19, es decir los radicales radicales A1.19f.1 a A1.19f.191; o los radicales A1.19g.1 a A1.19g.191; o los radicales A1.19h.1 a A1.19h.191; o los radicales A1.19i.1 a A1.19i.191; o los radicales A1.19k.1 a A1.19k.191.

- 25 Tablas 383 a 402: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.20, es decir los radicales radicales A1.20f.1 a A1.20f.191; o los radicales A1.20g.1 a A1.20g.191; o los radicales A1.20h.1 a A1.20h.191; o los radicales A1.20i.1 a A1.20i.191; o los radicales A1.20k.1 a A1.20k.191.

- 30 Tablas 403 a 422: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.21, es decir los radicales radicales A1.21f.1 a A1.21f.191; o los radicales A1.21g.1 a A1.21g.191; o los radicales A1.21h.1 a A1.21h.191; o los radicales A1.21i.1 a A1.21i.191; o los radicales A1.21k.1 a A1.21k.191.

- 35 Tablas 423 a 442: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A1 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 1.22, es decir los radicales radicales A1.22f.1 a A1.22f.191; o los radicales A1.22g.1 a A1.22g.191; o los radicales A1.22h.1 a A1.22h.191; o los radicales A1.22i.1 a A1.22i.191; o los radicales A1.22k.1 a A1.22k.191.

Otra realización preferida particular de la presente invención se refiere a compuestos de la fórmula I.a y a sus sales o N-óxidos, en donde

- 40 A es un radical A2, como se define anteriormente, en particular un radical A2 en donde D, n, R^{Px} y R^{P1} tienen uno de los significados preferidos, más particularmente un radical A2.a, A2.b, A2.c, A2.d o A2.e como se define en cualquiera de las tablas 2.1 a 2.11, por ejemplo un radical seleccionado de los radicales pirazol A2.1a.1 a A2.11a.141 o A2.1b.1 a A2.11b.141;

R¹ es hidrógeno o C₁-C₃-alquilo; lo más preferiblemente hidrógeno, metilo o etilo;

R² hidrógeno;

- 45 R³ hidrógeno;

R⁵ es hidrógeno; y

B es N o CH.

Ejemplos de compuestos de esta realización preferida particular son los compuestos como se definen en las siguientes tablas 443 a 882.

- 50 Tabla 443: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.1a.1 a A2.1a.31, A2.1a.42 a A2.1a.91 y A2.1a.117 a A2.1a.141, como se define en la tabla 2.1.

Tabla 461: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales radicales A2.1e.1-A2.1e.191, como se define en la tabla 2.1.

5 Tabla 462: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales radicales A2.1e.1-A2.1e.191, como se define en la tabla 2.1.

10 Tablas 463 a 482: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.2, es decir los radicales A2.2a.1 a A2.2a.31, A2.2a.42 a A2.2a.91 y A2.2a.117 a A2.2a.141, o los radicales A2.2b.1 a A2.2b.31, A2.2b.42 a A2.2b.91 y A2.2b.117 a A2.2b.141, o los radicales A2.2c.1 a A2.2c.31, A2.2c.42 a A2.2c.91 y A2.2c.117 a A2.2c.141, o los radicales A2.2d.1 a A2.2d.31, A2.2d.42 a A2.2d.91 y A2.2d.117 a A2.2d.141, o los radicales A2.2e.1 a A2.2e.191.

15 Tablas 483 a 502: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.3, es decir los radicales A2.3a.1 a A2.3a.31, A2.3a.42 a A2.3a.91 y A2.3a.117 a A2.3a.141, o los radicales A2.3b.1 a A2.3b.31, A2.3b.42 a A2.3b.91 y A2.3b.117 a A2.3b.141, o los radicales A2.3c.1 a A2.3c.31, A2.3c.42 a A2.3c.91 y A2.3c.117 a A2.3c.141, o los radicales A2.3d.1 a A2.3d.31, A2.3d.42 a A2.3d.91 y A2.3d.117 a A2.3d.141, o los radicales A2.3e.1 a A2.3e.191.

20 Tablas 503 a 522: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.4, es decir los radicales A2.4a.1 a A2.4a.31, A2.4a.42 a A2.4a.91 y A2.4a.117 a A2.4a.141, o los radicales A2.4b.1 a A2.4b.31, A2.4b.42 a A2.4b.91 y A2.4b.117 a A2.4b.141, o los radicales A2.4c.1 a A2.4c.31, A2.4c.42 a A2.4c.91 y A2.4c.117 a A2.4c.141, o los radicales A2.4d.1 a A2.4d.31, A2.4d.42 a A2.4d.91 y A2.4d.117 a A2.4d.141, o los radicales A2.4e.1 a A2.4e.191.

25 Tablas 523 a 542: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.5, es decir los radicales A2.5a.1 a A2.5a.31, A2.5a.42 a A2.5a.91 y A2.5a.117 a A2.5a.141, o los radicales A2.5b.1 a A2.5b.31, A2.5b.42 a A2.5b.91 y A2.5b.117 a A2.5b.141, o los radicales A2.5c.1 a A2.5c.31, A2.5c.42 a A2.5c.91 y A2.5c.117 a A2.5c.141, o los radicales A2.5d.1 a A2.5d.31, A2.5d.42 a A2.5d.91 y A2.5d.117 a A2.5d.141, o los radicales A2.5e.1 a A2.5e.191.

30 Tablas 543 a 562: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.6, es decir los radicales A2.6a.1 a A2.6a.31, A2.6a.42 a A2.6a.91 y A2.6a.117 a A2.6a.141, o los radicales A2.6b.1 a A2.6b.31, A2.6b.42 a A2.6b.91 y A2.6b.117 a A2.6b.141, o los radicales A2.6c.1 a A2.6c.31, A2.6c.42 a A2.6c.91 y A2.6c.117 a A2.6c.141, o los radicales A2.6d.1 a A2.6d.31, A2.6d.42 a A2.6d.91 y A2.6d.117 a A2.6d.141, o los radicales A2.6e.1 a A2.6e.191.

40 Tablas 563 a 582: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.7, es decir los radicales A2.7a.1 a A2.7a.31, A2.7a.42 a A2.7a.91 y A2.7a.117 a A2.7a.141, o los radicales A2.7b.1 a A2.7b.31, A2.7b.42 a A2.7b.91 y A2.7b.117 a A2.7b.141, o los radicales A2.7c.1 a A2.7c.31, A2.7c.42 a A2.7c.91 y A2.7c.117 a A2.7c.141, o los radicales A2.7d.1 a A2.7d.31, A2.7d.42 a A2.7d.91 y A2.7d.117 a A2.7d.141, o los radicales A2.7e.1 a A2.7e.191.

45 Tablas 583 a 602: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.8, es decir los radicales A2.8a.1 a A2.8a.31, A2.8a.42 a A2.8a.91 y A2.8a.117 a A2.8a.141, o los radicales A2.8b.1 a A2.8b.31, A2.8b.42 a A2.8b.91 y A2.8b.117 a A2.8b.141, o los radicales A2.8c.1 a A2.8c.31, A2.8c.42 a A2.8c.91 y A2.8c.117 a A2.8c.141, o los radicales A2.8d.1 a A2.8d.31, A2.8d.42 a A2.8d.91 y A2.8d.117 a A2.8d.141, o los radicales A2.8e.1 a A2.8e.191.

50 Tablas 603 a 622: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.9, es decir los radicales A2.9a.1 a A2.9a.31, A2.9a.42 a A2.9a.91 y A2.9a.117 a A2.9a.141, o los radicales A2.9b.1 a A2.9b.31, A2.9b.42 a A2.9b.91 y A2.9b.117 a A2.9b.141, o los radicales A2.9c.1 a A2.9c.31, A2.9c.42 a A2.9c.91 y A2.9c.117 a A2.9c.141, o los radicales A2.9d.1 a A2.9d.31, A2.9d.42 a A2.9d.91 y A2.9d.117 a A2.9d.141, o los radicales A2.9e.1 a A2.9e.191.

55 Tablas 623 a 642: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.10, es decir los radicales A2.10a.1 a A2.10a.31, A2.10a.42 a A2.10a.91 y A2.10a.117 a A2.10a.141, o los radicales A2.10b.1 a A2.10b.31, A2.10b.42 a A2.10b.91 y A2.10b.117 a A2.10b.141, o los radicales A2.10c.1 a A2.10c.31,

A2.10c.42 a A2.10c.91 y A2.10c.117 a A2.10c.141, o los radicales A2.10d.1 a A2.10d.31, A2.10d.42 a A2.10d.91 y A2.10d.117 a A2.10d.141, o los radicales A2.10e.1 a A2.10e.191.

5 Tablas 643 a 662: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 3 a 22, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.11, es decir los radicales A2.11a.1 a A2.11a.31, A2.11a.42 a A2.11a.91 y A2.11a.117 a A2.11a.141, o los radicales A2.11b.1 a A2.11b.31, A2.11b.42 a A2.11b.91 y A2.11b.117 a A2.11b.141, o los radicales A2.11c.1 a A2.11c.31, A2.11c.42 a A2.11c.91 y A2.11c.117 a A2.11c.141, o los radicales A2.11d.1 a A2.11d.31, A2.11d.42 a A2.11d.91 y A2.11d.117 a A2.11d.141, o los radicales A2.11e.1 a A2.11e.191.

10 Tabla 663: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12f.1 a A2.12f.191, como se define en la tabla 2.12.

Tabla 664: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12f.1 a A2.12f.191, como se define en la tabla 2.12.

15 Tabla 665: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12f.1 a A2.12f.191, como se define en la tabla 2.12.

20 Tabla 666: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12f.1 a A2.12f.191, como se define en la tabla 2.12.

Tabla 667: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12g.1 a A2.12g.191, como se define en la tabla 2.12.

25 Tabla 668: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12g.1 a A2.12g.191, como se define en la tabla 2.12.

Tabla 669: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12g.1 a A2.12g.191, como se define en la tabla 2.12.

30 Tabla 670: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12g.1 a A2.12g.191, como se define en la tabla 2.12.

35 Tabla 671: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12h.1 a A2.12h.191, como se define en la tabla 2.12.

Tabla 672: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12h.1 a A2.12h.191, como se define en la tabla 2.12.

40 Tabla 673: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12h.1 a A2.12h.191, como se define en la tabla 2.12.

Tabla 674: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12h.1 a A2.12h.191, como se define en la tabla 2.12.

45 Tabla 675: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12i.1 a A2.12i.191, como se define en la tabla 2.12.

50 Tabla 676: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12i.1 a A2.12i.191, como se define en la tabla 2.12.

Tabla 677: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12i.1 a A2.12i.191, como se define en la tabla 2.12.

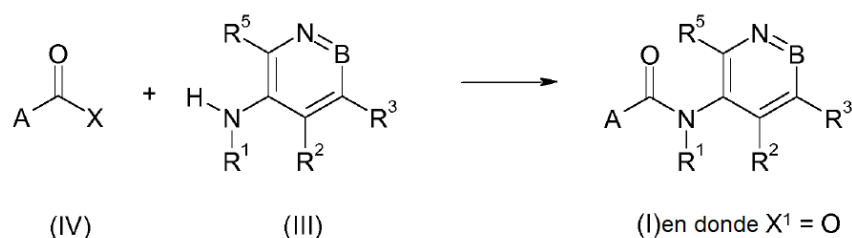
- Tabla 678: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12i.1 a A2.12i.191, como se define en la tabla 2.12.
- 5 Tabla 679: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12k.1 a A2.12k.191, como se define en la tabla 2.12.
- Tabla 680: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12k.1 a A2.12k.191, como se define en la tabla 2.12.
- 10 Tabla 681: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12k.1 a A2.12k.191, como se define en la tabla 2.12.
- 15 Tabla 682: Compuestos de fórmula I.a y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es N, R¹ es CH₃, R², R³ y R⁵ son hidrógeno y en donde A es un radical A2 seleccionado de los radicales A2.12k.1 a A2.12k.191, como se define en la tabla 2.12.
- Tablas 683 a 702: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.13, es decir los radicales radicales A2.13f.1 a A2.13f.191; o los radicales A2.13g.1 a A2.13g.191; o los radicales A2.13h.1 a A2.13h.191; o los radicales A2.13i.1 a A2.13i.191; o los radicales A2.13k.1 a A2.13k.191.
- 20 Tablas 703 a 722: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.14, es decir los radicales radicales A2.14f.1 a A2.14f.191; o los radicales A2.14g.1 a A2.14g.191; o los radicales A2.14h.1 a A2.14h.191; o los radicales A2.14i.1 a A2.14i.191; o los radicales A2.14k.1 a A2.14k.191.
- 25 Tablas 723 a 742: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.15, es decir los radicales radicales A2.15f.1 a A2.15f.191; o los radicales A2.15g.1 a A2.15g.191; o los radicales A2.15h.1 a A2.15h.191; o los radicales A2.15i.1 a A2.15i.191; o los radicales A2.15k.1 a A2.15k.191.
- 30 Tablas 743 a 762: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.16, es decir los radicales radicales A2.16f.1 a A2.16f.191; o los radicales A2.16g.1 a A2.16g.191; o los radicales A2.16h.1 a A2.16h.191; o los radicales A2.16i.1 a A2.16i.191; o los radicales A2.16k.1 a A2.16k.191.
- 35 Tablas 763 a 782: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.17, es decir los radicales radicales A2.17f.1 a A2.17f.191; o los radicales A2.17g.1 a A2.17g.191; o los radicales A2.17h.1 a A2.17h.191; o los radicales A2.17i.1 a A2.17i.191; o los radicales A2.17k.1 a A2.17k.191.
- 40 Tablas 783 a 802: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.18, es decir los radicales radicales A2.18f.1 a A2.18f.191; o los radicales A2.18g.1 a A2.18g.191; o los radicales A2.18h.1 a A2.18h.191; o los radicales A2.18i.1 a A2.18i.191; o los radicales A2.18k.1 a A2.18k.191.
- 45 Tablas 803 a 822: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.19, es decir los radicales radicales A2.19f.1 a A2.19f.191; o los radicales A2.19g.1 a A2.19g.191; o los radicales A2.19h.1 a A2.19h.191; o los radicales A2.19i.1 a A2.19i.191; o los radicales A2.19k.1 a A2.19k.191.
- 50 Tablas 823 a 842: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.20, es decir los radicales radicales A2.20f.1 a A2.20f.191; o los radicales A2.20g.1 a A2.20g.191; o los radicales A2.20h.1 a A2.20h.191; o los radicales A2.20i.1 a A2.20i.191; o los radicales A2.20k.1 a A2.20k.191.
- Tablas 843 a 862: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla 2.21, es decir los radicales radicales A2.21f.1 a A2.21f.191; o los radicales A2.21g.1 a A2.21g.191; o los radicales A2.21h.1 a A2.21h.191; o los radicales A2.21i.1 a A2.21i.191; o los radicales A2.21k.1 a A2.21k.191.
- Tablas 863 a 882: Compuestos de la fórmula I.a que corresponden a los compuestos de acuerdo con las tablas 223 a 242, con la excepción de que el radical A2 se selecciona de los radicales correspondientes como se define en la tabla

2.22, es decir los radicales radicales A2.22f.1 a A2.22f.191; o los radicales A2.22g.1 a A2.22g.191; o los radicales A2.22h.1 a A2.22h.191; o los radicales A2.22i.1 a A2.22i.191; o los radicales A2.22k.1 a A2.22k.191.

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

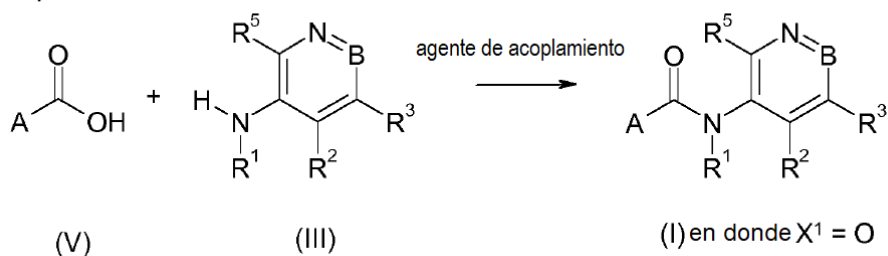
- 5 Los compuestos de la fórmula I, en donde X¹ es O, se pueden preparar, por ejemplo de acuerdo con el método representado en el esquema 1 haciendo reaccionar el derivado de ácido pirazol carboxílico activado IV con una 3-aminopiridina o 3-aminopiridazina compuesto III (véase por ejemplo Houben-Weil: "Métodoen der organ. Chemie"[Métodos of Organic Chemistry], Georg- Thieme-Verlag, Stuttgart, Nueva York 1985, volumen E5, pp. 941-1045). Derivados de ácido pirazol carboxílico activados IV son, por ejemplo, haluros, ésteres activados, anhídridos, azidas, por ejemplo cloruros, fluoruros, bromuros, ésteres de para-nitrofenilo, ésteres de pentafluorofenilo, ésteres de N-hidroxisuccinimidas, ésteres de hidroxibenzotriazol-1-ilo. En el esquema 1, los radicales A, B, R¹, R², R³ y R⁵ tienen los significados mencionados anteriormente y en particular los significados mencionados como preferidos, X es un grupo saliente adecuado tal como halógeno, N₃, para-nitrofenoxi o pentafluorofenoxi, etc.

Esquema 1.



- 15 Los compuestos activos de la fórmula I, en donde X¹ es O, también se pueden preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar el ácido pirazol carboxílico V con un compuesto de 3-aminopiridina o de 3-aminopiridazina III en presencia de un agente de acoplamiento de acuerdo con el esquema 2. En el esquema 2, los radicales A, B, R¹, R², R³ y R⁵ tienen los significados dados anteriormente y, en particular, los significados dados como preferidos.

Esquema 2.



- 20 Agentes de acoplamiento adecuados son, por ejemplo:

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

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

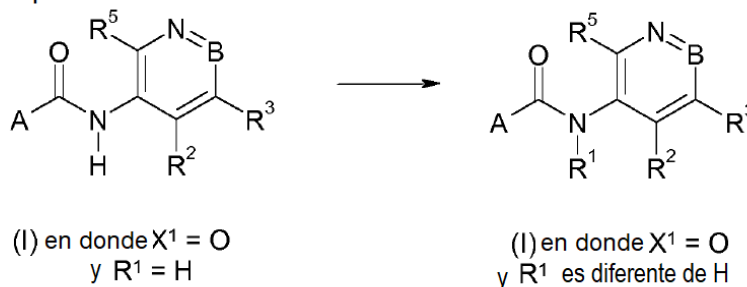
- Agentes de acoplamiento a base de sales de fosfonio., por ejemplo hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio [B. Castro, J.R. Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219], hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)tripirrolidinofosfonio [J. Coste et al., Tetrahedron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

- 30 • 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];

• Agentes de acoplamiento que forman cloruros de ácido, por ejemplo cloruro de bis-(2-oxo-oxazolidinil)fosfónico [J. Diago-Mesequer, Synthesis 1980, 547].

5 Compuestos de fórmula I en donde X^1 es O y R^1 es diferente del hidrógeno también se puede preparar mediante la alquilación de las amidas I (en las que R^1 es hidrógeno y que puede obtenerse de acuerdo con los esquemas 1 o 2) usando agentes alquilantes adecuados en presencia de bases.

Esquema 3.



Los ácidos pirazolcarboxílicos V y sus derivados activados IV, así como los compuestos 3-aminopiridina o 3-aminopiridazina III son conocidos en la técnica o están disponibles comercialmente o pueden prepararse por métodos conocidos en la literatura.

10 Compuestos de fórmula I, en donde X^1 es diferente del oxígeno, se pueden preparar a partir de los compuestos de fórmula I, en donde X^1 es oxígeno (compuestos de fórmula I.a), por métodos estándar:

Compuestos de fórmula I, en donde X^1 es S, se pueden preparar por ejemplo haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I.a con 2,4-bis (4-metoxifenil) -1,3,2,4-ditiadifosfetano-2,4-disulfuro o pentasulfuro de fósforo de acuerdo con el método descrito por M. Jes-berger et al. en Synthesis 2003, 1929.

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

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

25 can be prepared by alkylation of the corresponding tioamida (compound I, en donde X^1 es S) by reaction with an alkylating agent according a the method described by V. Glushkov et al. in Pharmaceutical Chemistry Journal 2005, 39(10), 533-536. In a similar manner, compounds of formula II, en donde X^2 es OR^{2a} o $NR^{2b}R^{2c}$ can be obtained. Compuestos de fórmula II, en donde $X^2 = SOR^{2d}$ o SO_2R^{2d} se puede obtener por oxidación de los compuestos II con $X^2 = SR^{2d}$.

30 Los N-óxidos de los compuestos de las fórmulas I y II se pueden preparar por oxidación de los compuestos I o II, respectivamente, de acuerdo con los métodos estándar de preparación de los N-óxidos de piridina, por ejemplo, mediante el método descrito por C. Botteghi et al. en Journal of Organometallic Chemistry 1989, 370, 17-31.

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

40 Las mezclas de reacción se elaboran de la manera habitual, por ejemplo, mezclando con agua, separando las fases y, si es apropiado, purificando los productos crudos mediante cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sobre sílica gel. Algunos de los productos intermedios y productos finales se pueden obtener en forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido que se liberan o purifican a partir de componentes volátiles bajo presión reducida y a una temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermedios y los productos finales se obtienen como sólidos, se pueden purificar por recristalización o trituración.

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

Por consiguiente, la presente invención también proporciona un método no terapéutico para controlar plagas de invertebrados, cuyo método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o sus terrenos de crianza o una planta cultivada, materiales de propagación de plantas (tal como semillas), suelo, área, material o entorno en el que crecen o pueden crecer las plagas, o los materiales, plantas cultivadas, materiales de propagación de plantas (tal como semillas), suelos, superficies o espacios que deben protegerse contra ataques de plagas o infestaciones con una cantidad efectiva como pesticida de compuesto de fórmulas I o II o una sal o N-óxido de los mismos o una composición agrícola tal como se definió anteriormente.

Preferiblemente, el método de la invención sirve para proteger el material de propagación de la planta (como la semilla) y la planta que crece a partir del ataque de plagas de invertebrados o infestación y comprende tratar el material de propagación de la planta (tal como la semilla) con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de fórmulas I o II o una sal o N-óxido agrícolamente aceptable de los mismos como se define anteriormente o con una cantidad efectiva como pesticida de una composición agrícola como se define arriba y abajo. El método de la invención no se limita a la protección del "sustrato" (planta, materiales de propagación de plantas, material del suelo, etc.) que se ha tratado de acuerdo con la invención, sino que también tiene un efecto preventivo, por lo tanto, por ejemplo, de acuerdo con protección a una planta que crece a partir de materiales de propagación de plantas tratadas (tal como semillas), la planta en sí no ha sido tratada.

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

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

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

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

insectos del orden de las lepidopterans (*Lepidoptera*), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyrestya conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Chei-matobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grand iosella*, *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*, *Philocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xilostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadensis*;

escarabajos (*Coleoptera*), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anis y rus dispar*, *Anthonomus grand es*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomya trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12 punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus 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*;

dípteros (*Diptera*), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia*

- 5 *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 hysocymi, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Tabanus bovinus, Tipula oleracea y Tipula paludosa;*
- trips (*Thysanoptera*), por ejemplo *Dichromothrips corbetti, Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi y Thrips tabaci;*
- 10 himenópteros (*Hymenoptera*), por ejemplo *Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata y Solenopsis in victa;*
- heterópteros (*Heteroptera*), por ejemplo *Acrosternum hilare, Blissus leucopterus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster integriceps, Euschistus impictiventris, Leptoglossus phillopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis y Thyanta perditor,*
- 15 homópteros (*Homoptera*), por ejemplo *Acyrtosiphon onobrychis, Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis pomi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis schneideri, Aphis spiraecola, Aphis sambuci, Acyrthosiphon 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 pseudo-solani, Dysaphis plantaginea, Dysaphis pyri, Empoasca fabae, Hyalopterus pruni, Hyperomyzus lactucae, Macrosiphum a venae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, Melanaphis pyrius, Metopolophium dirhodum, Myzodes persicae, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus persicae, Myzus varians, Nasonovia ribis-nigri, Nilaparvata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum insertum, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Sitobion a venae, Sogatella furcifera, Trialeurodes vaporariorum, Toxoptera aurantii, y Viteus vitifolii,*
- 20 25
- termitas (*Isoptera*), por ejemplo *Calotermes flavicollis, Leucotermes flavipes, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes lucifugus und Termes natalensis;*
- ortópteros (*Orthoptera*), por ejemplo *Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Forficula auricularia, Grillotalpa grillotalpa, 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;*
- 30
- arachnoidea, tales como arácnidos (Acarina), por ejemplo de las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tal 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. tal como Aculus schlechtendali, Phyllocoptera oleivora y Eriophyes sheldoni; Tarsonemidae spp. tal como Phytionemus pallidus y Polyphagotarsonemus latus; Tenuipalpidae spp. tal como Brevipalpus phoenicis; Tetranychidae spp. tal como Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius y Tetranychus urticae, Panonychus ulmi, Panonychus citri, y oligonychus pratensis;*
- 35 40
- siphonaptera*, por ejemplo *Xenopsylla cheopsis, Ceratophyllus spp.*
- Las composiciones y compuestos de fórmulas I o II son útiles para el control de nematodos, especialmente nematodos parásitos de plantas tales como nematodos de nudo de raíz, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica y otras especies de Meloidogyne;
- 45
- nematodos formadores de quistes, Globodera rostochiensis y otras especies Globodera; Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Heterodera trifolii y otras especies de Heterodera; Nematodos de las agallas de la semilla, especies de Anguina; Nematodos del tallo y foliares, especies de Aphelenchoides; Nematodos de agijón, Belonolaimus longicaudatus y otras especies Belonolaimus; Nematodos de pino, Bursaphelenchus xylophilus y otras especies de Bursaphelenchus; Nematodos de anillo, especies de Criconema, especies de Criconemella, especies de Criconemoides, especies de Mesocriconema; Nematodos de tallo y bulbo, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci y otras especies Ditylenchus; Nematodos del punzón, especies Dolichodorus; Nematodos espirales, Helicotylenchus multicinctus y otras especies de Helicotylenchus; Nematodos de vaina y sietoides, especies de Hemicycliophora y especies de Hemicriconemoides; especie hirshmanniella; nematodos de lanza, especies de Hoploaimus; nematodos del nudo de la raíz falsa, especies de Nacobbus; Nematodos de aguja, Longidorus elongatus y otras especies de Longidorus; nematodos del pasador, especies 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 la raíz rechoncha, Trichodorus primitivus y otras especies de Trichodorus, especies de Paratrichodorus; Nematodos del truco,
- 50 55

Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius y otras especies de Tylenchorhynchus; Nematodos de los cítricos, especies de tylenchulus; Nematodos Daga, especies Xiphinema; y otras especies de nematodos parásitos de plantas.

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

10 Los compuestos de fórmula Fórmula I o II o las composiciones pesticidas que los contienen pueden usarse para proteger las plantas y cultivos en crecimiento del ataque o la infestación por plagas de invertebrados, especialmente insectos, ácaros o arácnidos al poner en contacto la planta/cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de fórmulas I o II. El término "cultivo" se refiere tanto a cultivos en crecimiento como a cosechados.

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

15 Las formulaciones se preparan de una manera conocida (véase, por ejemplo, la revisión US 3.060.084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8-57 y et seq. WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo
20 extendiendo el compuesto activo con agentes auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, como solventes y/o vehículos, si se desean emulsionantes, surfactantes y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, para la formulación de tratamiento de semillas, también opcionalmente colorantes y/o aglutinantes y/o agentes gelificantes.

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.

30 Los emulsionantes adecuados son emulsionantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo, éteres de alcohol graso de polioxitileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Ejemplos de dispersantes son los licores de desecho de sulfito de lignina y la metilcelulosa.

35 Los surfactantes adecuados utilizados son sales de metales alcalinos, alcalinotérreos y amonio del ácido lignosulfónico, ácido naftalensulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalensulfónico, alquilarilsulfonatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y éteres glicólicos de alcohol graso sulfatado, además condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalensulfónico con fenol y formaldehído, polioxitileno octilfenol éter, isoctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenol poliglicol éteres, tributilfenil poliglicol éter, triestearilfenil poliglicol éter, alquilarilo poliéter
40 alcoholes, alcohol y alcohol graso condensados de óxido de etileno, Aceite de ricino etoxilado, polioxitileno alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, lauril alcohol poliglicol éter acetal, ésteres de sorbitol, licores de desecho de lignosulfito y metilcelulosa.

Las sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones de aceite directamente asperjables son las fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tal como el queroseno o el aceite diesel, adicionalmente los aceites de alquitrán de hulla y los 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, solventes altamente polares, por ejemplo, dimetil sulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.

50 También agentes anticongelantes tales como glicerina, etilenglicol, propilenglicol y bactericidas, tales como los que se pueden agregar a la formulación.

Los agentes antiespumantes adecuados son, por ejemplo, agentes antiespumantes a base de silicio o estearato de magnesio.

Un conservante adecuado es por ejemplo diclorofeno

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

5 Se pueden agregar aglutinantes para mejorar la adhesión de los materiales activos en las semillas después del tratamiento. Los aglutinantes adecuados son los surfactantes copolímeros de bloque EO/PO, pero también polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, polisobutilenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas (Lupasol®, Polymin®), polieteres, poliuretanos, polivinil acetato, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.

10 Opcionalmente, también se pueden incluir colorantes en la formulación. Los colorantes o tintes adecuados para las formulaciones de tratamiento de semillas son Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112, C.I. Solvent Red 1, pigment blue 15:4, pigment blue 15:3, pigment blue 15:2, pigment blue 15:1, pigment blue 80, pigment yellow 1, pigment yellow 13, pigment red 112, pigment red 48:2, pigment red 48:1, pigment red 57:1, pigment red 53:1, pigment orange 43, pigment orange 34, pigment orange 5, pigment green 36, pigment green 7, pigment white 6, pigment brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red 108.

Un ejemplo de un agente gelificante es el carragenano (Satiagel®).

15 Los polvos, materiales para esparcir y productos pulverizables pueden prepararse mezclando o moliendo concomitantemente las sustancias activas con un vehículo sólido.

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

20 Ejemplos de vehículos sólidos son tierras minerales tales como sílca gel sílice, silicatos, talco, caolín, atapulgita, piedra caliza, cal, tiza, bole, 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, harina de madera y cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.

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

Para fines de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas se pueden diluir de 2 a 10 veces, lo que lleva a concentraciones en las preparaciones listas para usar de 0,01 a 60% en peso de compuesto activo en peso, preferiblemente de 0,1 a 40% en peso.

30 Los compuestos de fórmulas I o II pueden usarse como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de ellos, por ejemplo en forma de soluciones directamente asperjables, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones de aceite, productos pulverizables, materiales para esparcir, o gránulos, mediante pulverización, atomización, espolvoreo, esparcimiento o vertido. Las formas de uso dependen totalmente de los fines previstos; su objetivo es garantizar en cada caso la mejor distribución posible de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

35 Las formas de uso acuoso se pueden preparar a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos humectables (polvos asperjables, dispersiones de aceite) agregando 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 humectante, agente de pegajosidad, dispersante o emulsionante. Sin embargo, también es posible preparar concentrados compuestos de sustancia activa, humectante, agente de pegajosidad, dispersante o emulsionante y, si corresponde, solvente o aceite, y tales concentrados son adecuados para la dilución con agua.

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

45 Los compuestos activos también se pueden usar con éxito en el proceso de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más del 95% en peso de compuesto activo, o incluso aplicar el compuesto activo sin aditivos.

Los siguientes son ejemplos de formulaciones:

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

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

10 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 90 partes en peso de agua o un disolvente soluble en agua. Como alternativa, se agregan humectantes u otros agentes auxiliares. Los compuestos activos se disuelven tras dilución con agua, por lo que se obtiene una formulación con 10% (p/p) de compuestos activos.

B) Concentrados dispersables (DC)

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

5 C) Concentrados emulsionables (CE).

Se disuelven 15 partes en peso de los compuestos activos en 7 partes en peso de xileno con la 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, por lo que se obtiene una formulación con 15% (p/p) de compuestos activos.

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

10 Se disuelven 25 partes en peso de los compuestos activos en 35 partes en peso de xileno con la 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 emulsionante (por ejemplo, Ultraturax) y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, por lo que se obtiene una formulación con 25% (p/p) de compuestos activos.

15 E) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas con agitación, 20 partes en peso de los compuestos activos se trituran con la adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para obtener una suspensión de compuesto activo fino. La dilución con agua da una suspensión estable de los compuestos activos, por lo que se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuestos activos.

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

50 partes en peso de los compuestos activos se muelen finamente con la adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se fabrican como gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de aparatos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de aspersión, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución estable de los compuestos activos, por lo que se obtiene una formulación con 50% (p/p) de compuestos activos.

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

75 partes en peso de los compuestos activos se muelen en un molino rotor-estator con la adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y sílica gel. La dilución con agua da una dispersión o solución estable de los compuestos activos, por lo que se obtiene una formulación con 75% (p/p) de compuestos activos.

H) Formulación en gel (GF)

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

35 2. Productos a aplicar sin diluir para aplicaciones foliares. Para fines de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a las semillas diluidas o no diluidas.

I) Polvos pulverizables (DP, DS)

5 partes en peso de los compuestos activos se trituran finamente y se mezclan íntimamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto pulverizable que tiene 5% (p/p) de compuestos activos

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

40 0,5 partes en peso del compuesto activo se muele finamente y se asocia con 95,5 partes en peso de vehículos, por lo que se obtiene una formulación con 0,5% (p/p) de compuestos activos. Los métodos actuales son la extrusión, el secado por aspersión o el lecho fluidizado. Esto proporciona gránulos para aplicar sin diluir para uso foliar.

K) Soluciones ULV (UL)

45 10 partes en peso de los compuestos activos se disuelven en 90 partes en peso de un solvente orgánico, por ejemplo, xileno. Esto da un producto que tiene 10% (p/p) de compuestos activos, que se aplica sin diluir para uso foliar.

Los compuestos de fórmulas I o II también son adecuados para el tratamiento de materiales de propagación de plantas (tl como semillas). Las formulaciones convencionales para el tratamiento de semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para el tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para el tratamiento con lodos WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación en gel GF. Estas

ES 2 710 701 T3

formulaciones pueden aplicarse a la semilla diluida o no diluida. La aplicación a las semillas se realiza antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado estas últimas.

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

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

15 Diversos ingredientes, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas o bactericidas pueden agregarse a los ingredientes activos, si corresponde, justo antes de su uso (mezcla en tanque). Estos agentes generalmente se mezclan con los agentes de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:10 a 10: 1.

Los compuestos de fórmulas I o II son efectivos a través del contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, partes de plantas o partes de animales) e ingestión (cebo o parte de plantas).

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

20 El cebo puede ser un líquido, una preparación sólida o semisólida (por ejemplo, un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en diversas formas y formas adecuadas para la aplicación respectiva, por ejemplo gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos se pueden rellenar en diversos dispositivos para asegurar una aplicación adecuada, por ejemplo, contenedores abiertos, dispositivos de aspersión, fuentes de gotitas o fuentes de evaporación. Los geles pueden basarse en matrices acuosas o aceitosas y pueden formularse para necesidades particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

30 El cebo empleado en la composición es un producto que es lo suficientemente atractivo para incitar a los insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc. o cucarachas para que lo coman. El atractivo se puede manipular mediante el uso de estimulantes de alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes alimenticios se eligen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Las partes frescas o en descomposición de las frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos también pueden servir como un estimulante de la alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas para los insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas por los expertos en la técnica.

40 Las formulaciones de compuestos de fórmulas I o II como aerosoles (por ejemplo, en botes de aspersión), aerosoles de aceite o aerosoles de bomba son muy adecuadas para el usuario no profesional para controlar plagas tal como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosol están compuestas preferiblemente por el compuesto activo, disolventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo, acetona, metilo etil cetona), hidrocarburos de parafina (por ejemplo, querosenos) con rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250 °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, adicionalmente agentes auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene de 3 a 7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume, tal como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, si es apropiado, estabilizadores tales como benzoato de sodio, surfactantes anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si es necesario, propelentes tal como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

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

50 Los compuestos de fórmulas I o II y sus respectivas composiciones también se pueden usar en mosquiteros y bobinas de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles de polillas, almohadillas de polillas u otros sistemas de vaporizadores independientes del calor.

55 Los métodos para controlar las enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, Malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de fórmulas I o II y sus respectivas composiciones también incluyen el tratamiento de superficies de cabañas y casas, aspersión de aire e impregnación de cortinas, tiendas de campaña, prendas de vestir, mosquiteras, trampas para moscas tsetse o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, telas, tejidos, telas no tejidas, material de red o láminas y lonas impermeables comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un

aglutinante. Los repelentes adecuados para el ejemplo son N,N-dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, lactona de ácido (2- hidroximetilciclohexil)acético, 2-etil-1,3-hexandiol, indalona, metil-neodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tal como el {(+/-)-3-alil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin), un repelente derivado o idéntico con extractos de plantas como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos de plantas crudas de plantas como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogon martinii, Cymbopogon citratus (hierba de limón), Cymopogon nardus (citronella). Los aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílicos y metacrílicos de alcoholes, tales como acrilato de butilo, acrilato de 2-etilhexilo y acrilato de metilo, hidrocarburos mono y dietilénicamente insaturados, tales como estireno, y dienos alifáticos, tal como butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteros se realiza en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones de los compuestos activos de fórmulas I y II o asperjándolos sobre las redes.

Los métodos que se pueden emplear para tratar el material de propagación de la planta, en particular la semilla, son, en principio, todos los tratamientos de semilla adecuados y especialmente las técnicas de cubrimiento de semillas conocidas en la técnica, tales como el recubrimiento de semillas (por ejemplo, la granulación de semillas), el espolvoreo de semillas y la inhibición de semillas (por ejemplo, remojo de semillas). Aquí, "tratamiento de semillas" se refiere a todos los métodos que hacen que el material de propagación de la planta, en particular las semillas, y los compuestos de fórmulas I o II, o una de sus sales o uno de sus N-óxidos, entren en contacto entre sí, y el "cubrimiento de semillas". a métodos de tratamiento de semillas que proporcionan a las semillas una cantidad de los compuestos de fórmulas I o II, o una sal de los mismos o un N-óxido de los mismos, es decir, que generan un material de propagación de plantas, en particular la semilla que comprende el compuesto de fórmulas I o II, o una sal del mismo o un N-óxido del mismo. En principio, el tratamiento se puede aplicar al material de propagación de la planta, en particular a la semilla en cualquier momento a partir de la cosecha del material de propagación de la planta, en particular de la semilla a la siembra del material de propagación de la planta, en particular de la semilla. El material de propagación de la planta, en particular la semilla puede tratarse inmediatamente antes o durante la siembra del material de propagación de la planta, en particular de la semilla, por ejemplo, utilizando el método de la "caja de jardinería". Sin embargo, el tratamiento también puede llevarse a cabo varias semanas o meses, por ejemplo hasta 12 meses, antes de plantar la semilla, por ejemplo en forma de un tratamiento de cubrimiento de semillas, sin que se observe una eficacia sustancialmente reducida.

De manera conveniente, el tratamiento se aplica al material de propagación de plantas no cultivadas, en particular a las semillas no cultivadas. Tal como se usa en el presente documento, el término "semilla no cultivada" pretende incluir la semilla en cualquier período desde la cosecha de la semilla hasta la siembra de la semilla en el suelo con el propósito de la germinación y el crecimiento de la planta.

Específicamente, se sigue un procedimiento en el tratamiento en el que se mezcla el material de propagación de la planta, en particular la semilla, en un dispositivo adecuado, por ejemplo, un dispositivo de mezcla para parejas de mezcla sólido o sólido/líquido, con la cantidad deseada de formulaciones para el tratamiento de semillas. , ya sea como tal o después de la dilución previa con agua, hasta que la composición se distribuya uniformemente sobre la semilla. Si es apropiado, esto es seguido por un paso de secado.

Las composiciones para usar de acuerdo con esta invención también pueden contener otros ingredientes activos, por ejemplo, otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas o bactericidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de las plantas, protectores y nematocidas. Estos ingredientes adicionales se pueden usar secuencialmente o en combinación con las composiciones descritas anteriormente, si es apropiado, también se agregarán solo inmediatamente antes de su uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, las plantas pueden asperjarse con una composición de esta invención antes o después de ser tratada con otros ingredientes activos.

Estos agentes se pueden mezclar con los agentes utilizados de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:10 a 10: 1. La mezcla de los compuestos I o II o las composiciones que los comprenden en la forma de uso como pesticidas con otros pesticidas con frecuencia da como resultado un espectro de acción pesticida más amplio.

La siguiente lista M de plaguicidas junto con los compuestos I o II de la invención y los posibles efectos sinérgicos que podrían producirse, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no imponer ninguna limitación:

M.1. Organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotion, fention, flupirazofos, fostiazato, heptenofos, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclorfos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupi-rimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclofon, vami-dotion;

- M.2. Carbamatos: aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, for-metanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb y triazamato;
- 5 M.3. Piretroides: acrinatrina, aletrina, aletrina d-cis-trans, aletrina d-trans, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopentenilo, bioresmetrina, ciclotrina, ciflutrin, beta-ciflutrin, cihalotrina, lambda-cialotrin, gamma-cihalotrina, cipermetrin, alpha-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empenetrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flu-citrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina, pralletrina, proflutrina, pyrethrin (pyrethrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametrina, tralometrina y transflutrina
- 10 M.4. Los imitadores de la hormona juvenil: hidropreno, cinopreno, metopreno, fenoxicarb y piriproxifeno;
- M.5. Compuestos de agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: acetamiprid, bensultap, clorhidrato de cartap, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, tiametoxam, niten-piram, nicotina, espinosad (agonista alostérico), espinotoram (agonista alostérico), tiaclo-prid, tiociclam, tiosultap-sodio y AKD1022.
- 15 M.6. Compuestos antagonistas de los canales de cloruro regulados de GABA: clordano, endosulfán, gamma-HCH (lindano); etiprol, fipronil, pirafuprol y piriprol
- M.7. Activadores del canal de cloruro: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina y lepimectina;
- M.8. Compuestos METI I: fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, y rotenona;
- M.9. Compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim e hidrametilnon;
- 20 M.10. Desacopladores de la fosforilación oxidativa: clorfenapir y DNOC;
- M.11. Inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotina, cihexatina, diafentiurón, óxido de fenbutatina, propargita y tetradifón;
- M.12. Interruptores de la muda: ciromazina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida;
- M.13. Sinergistas: butóxido de piperonilo, tribufos;
- 25 M.14. Compuestos bloqueadores de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;
- M.15. Fumigantes: bromuro de metilo, fluoruro de cloropicrina sulfurilo;
- M.16. Bloqueadores de alimentación selectiva: crilotie, pimetrozina, y flonicamid;
- M.17. Inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, hexitiazox y etoxazol;
- 30 M.18. Inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezin, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, y triflumuron;
- M.19. Inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato;
- M.20. Agonistas octapaminérgicos: amitraz;
- M.21. Moduladores del receptor de Ryanodina: flubendiamida y (R)- y (S)-3-cloro-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenilo}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida (M21.1);
- 35 M.22. Diversos: fosfuro de aluminio, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bórax, bromopropilato, cianuro, cienopirafen, ciflumetofen, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridalilo, pirifluquinazona, azufre, compuestos orgánicos de azufre, emético tártaro, 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),
- 40 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-piridin-2-ilmetil-benzamida (M22.3), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(2,2,2-trifluoro-etil)-benzamida (M22.4), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-tiazol-2-ilmetil-benzamida (M22.5), 4-[5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(tetrahidrofuran-2-ilmetil)-benzamida (M22.6), 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.7), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.8), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazolo-5-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.9), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.10), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.11), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.12), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.13), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.14), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.15), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (M22.16), ácido ciclopropanoacético, 1,1'-
- 50 [(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[[(2-ciclopropiloacetil)oxi]metil]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-12-

hidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto[2,1-b]pirano[3,4-e]piran-3,6-diil)éster (M22.17), 8-(2-ciclopropilometoxi-4-metil-fenoxi)-3-(6-metil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (M22.18);

M.23. N-R'-2,2-dihalo-1-R" ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- tri-fluoro-p-toluil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- trifluoro-p-toluil)-hidrazona, en donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo;

M.24. Antranilamidas: clorantraniliprol, ciantraniliprol,

[4-ciano-2-(1-ciclopropilo-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.1),

[2-cloro-4-ciano-6-(1-ciclopropilo-etilcarbamoil)-fenil]-amida de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.2),

[2-bromo-4-ciano-6-(1-ciclopropilo-etilcarbamoil)-fenil]-amida de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.3),

[2-bromo-4-cloro-6-(1-ciclopropilo-etilcarbamoil)-fenil]-amida de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.4),

[2,4-dicloro-6-(1-ciclopropilo-etilcarbamoil)-fenil]-amida de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.5),

[4-cloro-2-(1-ciclopropilo-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida de ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M24.6);

M.25. Compuestos de malononitrilo: CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₃, (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)malononitrilo), CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₂CF₃ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)-malonodinitrilo);

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

Los compuestos disponibles comercialmente del grupo M se pueden encontrar en The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council (2003) entre otras publicaciones.

Las tioamidas de fórmula M6.1 y su preparación se han descrito en el documento WO 98/28279. La lepimectina se conoce de Agro Project, PJB Publications Ltd, noviembre de 2004. Benclotiaz y su preparación se han descrito en el documento EP-A2 454621. El metidatión y el paraoxón y su preparación se han descrito en Farm Chemicals Handbook, volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. El acetoprol y su preparación se han descrito en el documento WO 98/28277. La metaflumizona y su preparación se han descrito en el documento EP-A2 462 456. El flupirazofos se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988, p.237-243 y en el documento US 4822779. El pirafluprol y su preparación se han descrito en el documento JP 2002193709 y en el documento WO 01/00614. El piriprol y su preparación se han descrito en WO 98/45274 y en US 6335357. Amidoflumet y su preparación se han descrito en US 6221890 y en JP 21010907. Flufenerim y su preparación se han descrito en WO 03/007717 y en WO 03/007718. AKD 1022 y su preparación se han descrito en el documento US 6300348. El clorantraniliprol se ha descrito en los documentos WO 01/70671, WO 03/015519 y WO 05/118552. Ciantraniliprol se ha descrito en los documentos WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. Las antranilamidas M 24.1 a M 24.6 se han descrito en los documentos WO 2008/72743 y WO 200872783. La ftalamida M 21.1 se conoce a partir del documento WO 2007/101540. Ciflumetofen y su preparación se han descrito en el documento WO 04/080180. El compuesto de aminoquinazolinona pirifluquinazona se ha descrito en el documento EP A 109 7932. Sulfoximina sulfoxaflor se ha descrito en los documentos WO 2006/060029 y WO 2007/149134. El compuesto alquililéter M22.1 se describe, por ejemplo en el documento JP 2006131529. Los compuestos orgánicos de azufre se han descrito en el documento WO 2007060839. El compuesto de carboxamida M 22.2 se conoce del documento WO 2007/83394. Los compuestos de oxazolina M 22.3 a M 22.6 se han descrito en el documento WO 2007/074789. Los compuestos de furano M 22.7 a M 22.16 se han descrito, por ejemplo, en el documento WO 2007/115644. El derivado de piriropeno M 22.17 se ha descrito en los documentos WO 2008/66153 y WO 2008/108491. El compuesto de piridazina M 22.18 se ha descrito en JP 2008/115155. Los compuestos de malononitrilo se han descrito en los documentos WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694.

Asociados mezcladores fungicidas son aquellos seleccionados del grupo que consiste en acilalaninas tales como benalaxil, metalaxil, ofurace, oxadixil, derivados de aminas tales como aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidin, guazatina, iminoctadina, espiroxamin, tridemorf, anilino pirimidinas tales como pirimetanil, mepanipirim o cirodinilo, antibióticos tales como cicloheximid, griseofulvin, kasugamicina, natamicina, polioxin o streptomycin, azoles tales como bitertanol, bromoconazol, ciproconazol, difenoconazol, dini-cona-zol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalil, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol, dicarboximides tales como iprodion,

miclozolin, procimidon, vinclozolin, ditiocarbamates tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, policarbamato, tiram, ziram, zineb, compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomilo, bos-calid, carbendazim, carboxin, oxicarboxin, ciazofamid, dazomet, ditanon, famox-adon, fenamidon, fenarimol, fuberidazol, flutolanil, furametpir, isoprotilano, mepronil, nuarimol, probenazol, proquinazid, pirifenox, piroquilon, quinoxifen, siltiofam, tiabendazol, tifluzamid, tiofanato-metilo, tiadinil, triciclazol, triforina, fungicidas de cobre tales como mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico, derivados de nitrofenilo tales como binapacril, dinocap, dinobuton, nitroftalhisopropilo, fenilpirroles tales como fenpiclonil o fludioxonil, azúfre, otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamid, clorotalonil, ciflufenamid, cimoxanil, diclomezin, diclocimet, diethofencarb, edifen-fos, etaboxam, fenhexamid, fentin-acetate, fenoxanil, ferimzona, fluazinam, fosetilo, fosetil-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenon, pencicuron, propamocarb, ftalida, toloclofos-metilo, quintozeno, zoxamid, estrobilurinas tales como azoxiestrobin, dimoxiestrobin, fluoxaestrobin, kresoxim-metilo, me-tominostrobin, orisastrobin, picoxiestrobin o trifloxiestrobin, derivados del ácido sulfénico tales como captafol, captan, diclofluanid, folpet, toluilfluanid, cinnemamidas y análogos tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

La plaga de invertebrados, es decir, artrópodos y nematodos, la planta, el suelo o el agua en la que crece la planta puede ponerse en contacto con los presentes compuestos I o II o las composiciones que los contengan mediante cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, el "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga o la planta de invertebrados-típicamente al follaje, el tallo o las raíces de la planta) como el contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones al locus de las plagas de invertebrados o plantas).

Además, las plagas de invertebrados se pueden controlar al poner en contacto la plaga objetivo, su suministro de alimentos, su hábitat, su terreno de crianza o su locus con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de fórmula I o II. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección del locus, los cultivos en crecimiento o los cultivos cosechados por la plaga.

"Locus" significa un hábitat, terreno de crianza, plantas cultivadas, material de propagación de plantas (tal como semillas), suelo, área, material o entorno en el que una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

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

El compuesto de fórmulas I o II, una sal o un N-óxido del mismo y sus composiciones se pueden usar para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas de tablas, traviesas, etc. y edificios tal como casas, dependencias, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, pieles, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc., de las hormigas y/o termitas, y para controlar que las hormigas y termitas dañen los cultivos o el ser humano (por ejemplo, cuando las plagas invaden las casas y las instalaciones públicas). Los compuestos se aplican no solo a la superficie del suelo circundante o al suelo debajo del piso para proteger los materiales de madera, sino que también se pueden aplicar a artículos con entramado tales como superficies de concreto debajo del piso, postes de alcoba, vigas, madera contrachapada, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, medias tablas, etc. y artículos de vinilo tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante térmico tal como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que dañen los cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de hormigas o similares.

Los compuestos de fórmulas I y II, sus sales o N-óxido de los mismos también pueden aplicarse de manera preventiva a lugares en los que se espera la aparición de plagas.

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

En el caso del tratamiento del suelo o de la aplicación en el lugar de residencia o nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

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

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

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

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

10 Para su uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0,1 a 4000 g por hectárea, deseablemente de 25 a 600 g por hectárea, más deseablemente de 50 a 500 g por hectárea.

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

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

Los compuestos de los ejemplos 5, 6 y 12 están disponibles de fuentes comerciales.

15 I. Ejemplos de preparación

El procedimiento descrito en los siguientes ejemplos de preparación se usó para preparar compuestos adicionales de las fórmulas I y II mediante la modificación apropiada del material de partida. Los compuestos resultantes, junto con los datos físicoquímicos, se listan en las tablas a continuación.

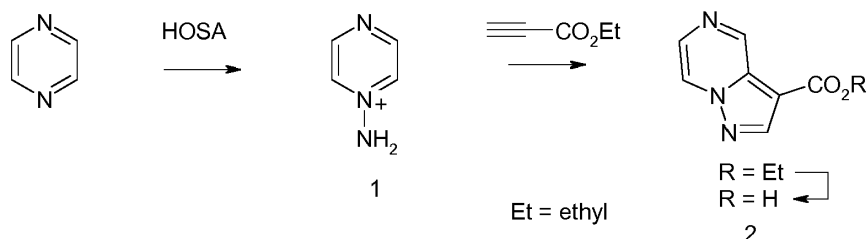
20 Los productos se caracterizaron por HPLC (espectrometría de masas de cromatografía líquida de alto rendimiento). La HPLC se llevó a cabo utilizando una columna analítica RP-18 (ROD Speed Chromo-lith de Merck KgaA, Alemania) que se realizó a 40 °C. El acetonitrilo con 0,1% en volumen de una mezcla de ácido trifluoroacético/agua y 0,1% en volumen de ácido trifluoroacético sirvió como fase móvil; tasa de flujo: 1,8 ml/min y volumen de inyección: 2 µl.

A) Materiales de partida:

1) ácidos 5,6-dihidro-4H-pirrolo[1,2b]pirazol-2/3-carboxílicos

25 La síntesis de mezclas regioisoméricas de ácidos 5,6-dihidro-4H-pirrolo[1,2b]pirazol-2/3-carboxílico se realizó siguiendo los procedimientos descritos previamente [A. A. Nikitenko et al., Organic Process Research Development 2006, 10, 712-16]. Los isómeros se separaron por cromatografía de columna instantánea en la etapa de 5,6-dihidro-4H-pirrolo[1,2b]pirazol-carboxilatos de etilo. El ácido carboxílico utilizado en la preparación de los compuestos 3, 4, 9, 17, 18, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34 se preparó por analogía a este protocolo.

30 2) ácido pirazolo[1,5-a]pirazin-3-carboxílico



35 A una solución de pirazina (12,77 g, 0,16 mol) en agua (60 ml), una solución acuosa de H₂NOSO₃K [preparada por neutralización de una solución de H₂NOSO₃H (18,05 g, 0,16 mol) en 80 ml de agua con una solución de KOH (8,95 g, 0,16 mol) en agua (50 ml) a 0 °C] se añadió gota a gota a 60 °C durante un período de 10 min. La mezcla de reacción se calentó hasta 70°C durante 4 horas. La solución se alcalinizó (pH = 8~9) con K₂CO₃, el K₂SO₄ precipitado se retiró por filtración y el filtrado se extrajo con acetato de etilo. La solución acuosa se acidificó (pH = 3) con 38% de HI acuoso y se concentró bajo presión reducida a temperaturas por debajo de 50 °C. El residuo se lavó con etanol y la materia insoluble se separó por filtración. La solución se evaporó bajo presión reducida para dar la sal 1 de N-aminopirazina cruda (10,7 g) que se usó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

40 Una solución de sal 1 de N-aminopirazina (20 g, 20.83 mmol), propiotalato de etilo (30.6 g, 312.5 mmol) y K₂CO₃ (7.2 g, 52.1 mmol) en dimetilformamida (200 ml) se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El disolvente se evaporó bajo presión reducida. El residuo se sometió a partición entre agua y acetato de etilo y la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía de columna (éter de petróleo → éter de petróleo: acetato de etilo = 20) para dar una mezcla de isómeros de los ésteres bicíclicos (3 g, rendimiento del 7,5%) como un sólido de color rojo. La saponificación se llevó a cabo utilizando métodos

45

estándar para dar ácido pirazolo[1,5-a]pirazin-3-carboxílico. Los ácidos carboxílicos utilizados en la preparación de los compuestos 1, 2, 7, 8, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27 se prepararon por analogía a este protocolo.

Preparación de los compuestos de la fórmula I:

- 5 2) Método general para preparar compuestos I haciendo reaccionar ácido carboxílico de fórmula 2 con 3-aminopiridina de fórmula III

Una mezcla del ácido carboxílico respectivo de fórmula 2 (20 mmol) en dicloruro de azufre (30 ml) se calentó hasta reflujo durante 4. El dicloruro de azufre se evaporó bajo presión reducida para dar el cloruro de ácido crudo. El material
10 crudo se disolvió en diclorometano (20 ml) y la solución se añadió gota a gota a una solución de piridin-3-amina (2,33 g, 24,81 mmol) y trietilamina (0,4 ml, 4,134 mmol) en diclorometano (20 ml). La mezcla se agitó durante la noche. El producto crudo se purificó mediante HPLC preparativa para dar el compuesto de fórmula I.

3) Preparación del compuesto del ejemplo 7:

Una suspensión de ácido pirazolo[1,5-a]pirazin-3-carboxílico (3,37 g, 20,67 mmol) en dicloruro de azufre (30 ml) se calentó bajo reflujo durante 4 horas. El dicloruro de azufre se evaporó bajo presión reducida para dar el cloruro de
15 ácido crudo. El material crudo se disolvió en diclorometano (20 ml) y la solución se añadió gota a gota a una solución de piridin-3-amina (2,33 g, 24,81 mmol) y trietilamina (0,4 ml, 4,134 mmol) en diclorometano (20 ml). La mezcla se agitó durante la noche. El producto crudo se purificó por HPLC preparativa para dar el compuesto del ejemplo 7 en forma de un sólido de color amarillo (4 g, rendimiento 81%).

¹H RMN (400 MHz, DMSO): δ 7.47-7.50 (m, 1 H), 8.22-8.23 (m, 1 H), 8.25-8.28 (m, 1 H), 8.38-8.40 (m, 1 H), 8.96 (s, 1 H), 9.00-9.02 (m, 1 H), 9.03-9.04 (m, 1 H), 9.70 (s, 1 H), 10.05 (s, 1 H).

4) Preparación de N-(piridin-3-il)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo-[1,5-a]pirazin-3-carboxamida (ejemplo 34):

Una solución del compuesto de carboxamida del ejemplo 7 (3,5 g, 14,64 mmol) y NaBH₄ (1.58 g, 43.9 mmol) en una mezcla de metanol (50 ml) y agua (10 ml) se agitó durante 14 horas a 30°C. La solución se purificó por HPLC
25 preparativa para dar directamente N-(piridin-3-il)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo-[1,5-a]pirazin-3-carboxamida como un sólido blanco. (2.0 g, rendimiento 56%).

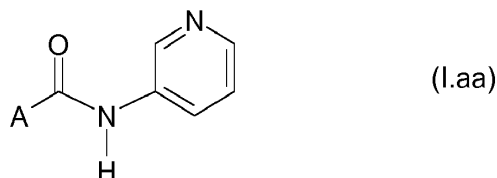
¹H RMN (400 MHz, DMSO): δ 2.48-2.50 (m, 1 H), 3.09-3.10 (m, 2 H), 3.98-4.01 (m, 2 H), 4.10-4.12 (m, 2 H), 7.37-7.40 (m, 1 H), 8.07-8.10 (m, 1 H), 8.16 (s, 1 H), 8.24-8.25 (m, 1 H), 8.83-8.4 (m, 1 H), 9.91 (s, 1 H).

5) Preparación de N-(piridin-3-il)-5-metil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo-[1,5-a]pirazin-3-carboxamida (ejemplo 13):

Una solución de N-(piridin-3-il)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo-[1,5-a]pirazin-3-carboxamida (1 g, 4,11 mmol) y dimetilo sulfato (0,207 g, 1,64 mmol) en acetonitrilo (20 ml) se agitó a temperatura ambiente durante 14 h. La solución se purificó por HPLC preparativa directamente para dar el ejemplo de compuesto 13 en forma de un sólido blanco (320
30 mg, rendimiento 28,4%).

¹H RMN (400 MHz, DMSO): δ 2.40 (s, 3 H), 2.82-2.85 (m, 2 H), 3.82 (s, 2 H), 4.10-4.13 (m, 2 H), 7.30-7.33 (m, 1 H), 8.14-8.16 (m, 1 H), 8.23-8.24 (m, 1 H), 8.32 (s, 1 H), 8.92 (s, 1 H), 10.16 (s, 1 H).

35 Los compuestos de la fórmula I y las sales o N-óxidos de los mismos, en donde B es CH, R¹, R², R³ y R⁵ son H y X¹ es O, en lo sucesivo se denominan compuestos I.aa.



Los compuestos de fórmula I.aa preparados de acuerdo con el método mencionado anteriormente junto con sus datos físicoquímicos se compilan en la tabla B a continuación. A en cada caso tiene el significado dado en la línea
40 correspondiente de la tabla B.

Tabla B. Compuestos de fórmula I.aa preparados de acuerdo con el método mencionado anteriormente.

Ejemplo	A	datos físicoquímicos r.t.[min]
1	pirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	1.558

ES 2 710 701 T3

Ejemplo	A	datos r.t.[min]	fisicoquímicos
2	pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-ilo	1.320	
3	4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	1.508	
4	5,6-dihidro-4H-pirrolo[1,2-b]pirazol-3-ilo	1.304	
5	7-trifluorometil-5-(3,4-dimetoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidin-3-ilo	2.400	
6	7-trifluorometil-5-(2-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidin-3-ilo	2.629	
7	pirazolo[1,5-a]pirazin-3-ilo	1.299	
8	pirazolo[1,5-b]piridazina-3-ilo	1.341	
9	6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-3-ilo	1.272	
10	4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-b]piridazina-3-ilo	1.160	
11	7-metil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo-[1,5-b]piridazina-3-ilo	1.168	
12	7-trifluorometil-5-(3-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidin-3-ilo	2.526	
13	5-metil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo-[1,5-a]pirazin-3-ilo	0.533	
14	6,7,8,9-tetrahidropirazolo-[1,5-a]quinolina -3-ilo	2.243	
15	5-metoxipirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	1.716	
16	5-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	2.335	
17	4,4a,5,5a-tetrahidrociclopropa[4,5]pirrolo-[1,2-b]pirazol-3-ilo	1.293	
18	4a,5,6,7,8,8a-hexahidro-4H-pirazolo-[1,5-a]indole-3-ilo	1.844	
19	6-fenilpirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	2.399	
20	7-metilpirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	1.755	
21	6-metoxipirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	1.759	
22	5-trifluorometilpirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	2.080	
23	4-metoxipirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	1.860	
24	6-trifluorometilpirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	2.107	
25	pirazolo[1,5-b]piridazina-3-ilo	1.244 (aislado como el clorhidrato)	

ES 2 710 701 T3

Ejemplo	A	datos r.t.[min]	fisicoquímicos
26	4-trifluorometilpirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	1.634	
27	7-trifluorometilpirazolo[1,5-a]piridin-3-ilo	2.027	
28	4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]piridin-2-ilo	1.660	
29	5,6-dihidro-4H-pirrol[1,2-b]pirazol-2-ilo	1.446	
30	6,7-dihidro-4H-pirazolo[5,1-c][1,4]oxazin-2-ilo	1.294	
31	4-metil-5,6-dihidro-4H-pirrol[1,2-b]pirazol-2-ilo	1.655	
32	4,4a,5,5a-tetrahidrociclopropa[4,5]pirrolo-[1,2-b]pirazol-2-ilo	1.532	
33	4a,5,6,7,8,8a-hexahidro-4H-pirazolo-[1,5-a]indol-2-ilo	2.149	
r.t. = tiempo de retención			

II. Evaluación de la actividad plaguicida:

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

Método a)

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

Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón (una planta por maceta) se infestaron colocando una hoja muy infestada de la colonia principal encima de cada cotiledón. Se dejó que los áfidos se transfirieran a la planta huésped durante la noche, y se retiró la hoja utilizada para transferir los áfidos. Los cotiledones se sumergieron en la solución de prueba y se dejaron secar. Después de 5 días, se realizaron recuentos de mortalidad.

- 10 En esta prueba, los compuestos 2, 3, 4, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 17, 18, 19, 20, 28, 29, 30, 31, 32 y 33, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

Método b)

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

- 20 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón se infestaron con áfidos antes del tratamiento al colocar una hoja muy infestada de la colonia principal de áfidos en la parte superior de cada cotiledón. Se dejó que los áfidos se transfirieran durante la noche para lograr una infestación de 80-100 áfidos por planta y se eliminó la hoja del huésped. Las plantas infestadas se asperjaron luego con un rociador automático de plantas electrostáticas equipado con una boquilla de rociado atomizador. Las plantas se secaron en la cabina de extracción del aspersor, se retiraron del aspersor y luego se mantuvieron en una sala de cultivo bajo iluminación fluorescente en un fotoperíodo de 24 horas a 25 °C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de áfidos en las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas de control no tratadas, se determinó después de 5 días.

- 25 En esta prueba, los compuestos 3, 4, 17, 18, 25, 28 y 29, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

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

Método a)

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

ES 2 710 701 T3

5 Las plantas de pimiento en la segunda etapa de par de hojas (variedad 'California Wonder') se infestaron con aproximadamente 40 áfidos criados en el laboratorio al colocar secciones de hojas infestadas sobre las plantas de prueba. Las secciones de la hoja se retiraron después de 24 h. Las hojas de las plantas intactas se sumergieron en soluciones de gradiente del compuesto de prueba y se dejaron secar. Las plantas de prueba se mantuvieron bajo luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) a aproximadamente 25 °C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de áfidos en las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad en las plantas de control, se determinó después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos 1, 2, 3, 4, 7, 8, 9, 11, 13, 14, 17, 18, 19, 20, 25, 28, 29, 30, 31, 32 y 33, respectivamente, en 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

Método b)

10 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10.0000 ppm suministrada en tubos de 1,3 ml ABgene®. Estos tubos se insertaron en un aspersor electrostático automático equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones más bajas en acetona al 50%: agua al 50% (v/v). Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

15 Las plantas de pimentón en la primera etapa de hoja verdadera se infestaron antes del tratamiento colocando hojas muy infestadas de la colonia principal encima de las plantas de tratamiento. Se dejó que los áfidos se transfirieran durante la noche para lograr una infestación de 30-50 áfidos por planta y se eliminaron las hojas del huésped. Las plantas infestadas se asperjaron luego con un aspersor automático de plantas electrostáticas equipado con una boquilla de rociado atomizador. Las plantas se secaron en la cámara extractora, se retiraron y luego se mantuvieron en una sala de cultivo con luz fluorescente en un fotoperíodo de 24 horas a 25 °C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de áfidos en las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad en las plantas de control no tratadas, se determinó después de 5 días.

20 En esta prueba, los compuestos 3, 4, 17, 18, 25, 28 y 29, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

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

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

Las plantas de caupí en maceta colonizadas con 100-150 áfidos de diversas etapas se asperjaron después de que se registró la población de la plaga. La reducción de la población se evaluó después de 24, 72 y 120 horas.

30 En esta prueba, los compuestos 1, 3, 4, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 17, 18, 20, 21, 22, 24, 25, 28, 29, 30, 31, 32 y 33, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

II.4 Áfido del frijol (*Aphis fabae*)

Método a)

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

35 Las plantas de capuchina cultivadas en la mezcla Metro en la etapa del primer par de hojas (variedad "Mixed Jewel") se infestaron con aproximadamente 2 a 30 áfidos criados en el laboratorio al colocar las plantas cortadas infestadas sobre las plantas de prueba. Las plantas cortadas se retiraron después de 24 h. Cada planta se sumergió en la solución de prueba para proporcionar una cobertura completa del follaje, el tallo, la superficie sobresaliente de la semilla y la superficie circundante del cubo y se dejó secar en la cámara extractora. Las plantas tratadas se mantuvieron a aproximadamente 25°C con luz fluorescente continua. La mortalidad de áfidos se determina después de 3 días.

40 En esta prueba, los compuestos 3, 8 y 9, respectivamente, a 10 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 90% en comparación con los controles no tratados.

Método b)

45 Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,0000 ppm suministrada en tubos de 1,3 ml ABgene®. Estos tubos se insertaron en un aspersor electrostático automático equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las cuales se hicieron diluciones más bajas en acetona al 50%: agua al 50% (v/v). Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

50 Las plantas de capuchina (variedad "Mixed Jewel") se cultivaron hasta la etapa de 1ª hoja y luego se infestaron con aproximadamente 20-30 áfidos/planta de frijoles colocando plantas cortadas infestadas sobre las plantas de prueba. Las plantas hospedadoras se retiraron después de 24 horas. Las plantas de prueba infestadas se asperjaron con un rociador automático de plantas electrostáticas equipado con una boquilla atomizadora. Las plantas se secaron en la cámara extractora y se colocaron en bandejas. Las plantas de prueba se mantuvieron en una sala de crecimiento a

25 °C y con 20-40% de humedad relativa. La mortalidad se evaluó 3 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control sin tratar.

En esta prueba, los compuestos 17 y 18, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

5 II.5 Mosca blanca de hoja plateada (*bemisia argentifolii*, adulto)

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

10 Las plantas de algodón seleccionadas se cultivaron al estado de cotiledón (una planta por maceta). Los cotiledones se sumergieron en la solución de prueba para proporcionar una cobertura completa del follaje y se colocaron en un área bien ventilada para que se secaran. Cada maceta con plántula tratada se colocó en un taza de plástico y se introdujeron de 10 a 12 adultos de mosca blanca (aproximadamente 3-5 días). Los insectos se recolectaron usando un aspirador y un tubo Tygon® no tóxico de 0,6 cm (R-3603) conectado a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recolectados, luego se insertó suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, lo que permitió que los insectos salieran de la punta para alcanzar el follaje y alimentarse. Las tazas se cubrieron con una tapa apantallada reutilizable (pantalla de poliéster de malla de 150 micras PeCap de Tetko Inc). Las plantas de prueba se mantuvieron en la sala de almacenamiento a aproximadamente 25 °C y 20-40% de humedad relativa durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) para evitar la captura de calor dentro de la taza. La mortalidad se evaluó 3 días después del tratamiento de las plantas.

En esta prueba, los compuestos 11 y 19, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos el 75% en comparación con los controles no tratados.

20 II.6 Áfido del algarrobo (*Megoura viciae*)

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

25 Los discos de hojas de frijol se colocaron en placas de microtitulación llenas con agar-agar al 0,8% y 2,5 ppm de OPUS™. Los discos de hojas se asperjaron con 2,5 µl de la solución de prueba y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en las placas de microtitulación que luego se cerraron y se mantuvieron a 23 ± 1 °C y $50 \pm 5\%$ de humedad relativa bajo luz fluorescente durante 6 días. La mortalidad se evaluó sobre la base de áfidos vitales reproducidos. Luego se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de áfidos.

En esta prueba, los compuestos 1, 2, 3, 4, 7, 8, 10, 11, 13, 14, 17, 18, 22, 25, 26 y 27, respectivamente, a una concentración de la solución de prueba de 2500 mg/L mostró una mortalidad de al menos el 90%.

30 II.7 Gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*)

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

35 Para evaluar el control del gorgojo de baya (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pocillos que contenían una dieta para insectos y 20-30 huevos de *A. grandis*. Se asperjaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 20 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a 23 ± 1 °C y $50 \pm 5\%$ de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

En esta prueba, los compuestos 4, 10, 11, 12, 15, 16, 17, 18 y 24, respectivamente, a una concentración de la solución de prueba de 2500 mg/L mostraron una mortalidad de al menos el 50%.

40 11.10 Actividad contra la mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*)

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

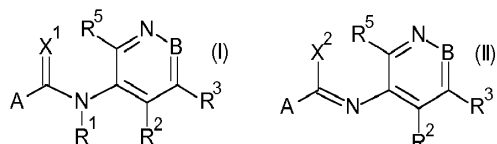
Para evaluar el control de la mosca del mediterráneo, la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contenían una dieta para insectos y huevos de 50 a 80 *C. capitata*.

45 Se asperjaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a 28 ± 1 °C y $80 \pm 5\%$ de humedad relativa durante 5 días. Luego se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas.

En esta prueba, los huevos que se han tratado con 2500 ppm de compuesto 2 o 22, respectivamente, mostraron una mortalidad de al menos 50%.

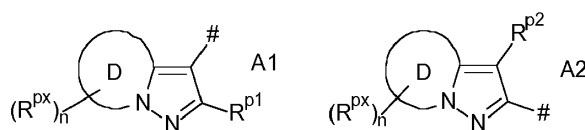
REIVINDICACIONES

1. Un método no terapéutico para controlar las plagas de invertebrados, que comprende el tratamiento de las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o sus terrenos de crianza o una planta, semilla, suelo, material o entorno en el que crecen o pueden crecer las plagas, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que deben protegerse contra ataques de plagas o infestaciones con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de pirazol de fórmulas I o II o una sal o un N-óxido del mismo:



en donde

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



denota el sitio de enlace al resto de fórmulas I o II, y en donde

D es un radical heterocíclico de 5 o 6 miembros fusionado con la unidad estructural pirazol, en donde los miembros del anillo se seleccionan de C, N, O y S, y en donde el radical cíclico puede ser saturado, parcialmente insaturado o aromático., y en donde

- 15 R^{p1} es hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-ciclo-alquilo, o C₃-C₆-halocicloalquilo;

R^{p2} es hidrógeno, halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-ciclo-alquilo, o C₃-C₆-halocicloalquilo;

n es 0, 1, 2, 3 o 4, y en donde

- 20 R^{px} se selecciona de hidrógeno, halógeno, CN, NO₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alqueno y C₂-C₁₀-alquino, en donde los 3 últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes. R^x, o en donde R^{px} se selecciona además de OR^a, SR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c,

S(O)₂R^d, NR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, heterocíclico, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₅-C₁₀-cicloalqueno y fenilo, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de R^x y R^y, y en donde

- 25 dos radicales R^{px} unidos al mismo miembro del anillo del radical heterocíclico D juntos pueden formar un sustituyente oxo, y en donde

dos radicales R^{px} unidos a los miembros del anillo adyacentes del radical heterocíclico D junto con esos miembros del anillo pueden formar un radical carbocíclico o heterocíclico de 3 a 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático fusionado al radical heterocíclico D, en donde los miembros del anillo se seleccionan de C, N, O y S, y en donde el radical cíclico puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo;

B es N o CH;

- 35 X¹ es S, O o NR^{1a}, en donde R^{1a} se selecciona de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilmetilo, C₃-C₁₀-halocicloalquilo, C₂-C₁₀-alqueno, C₂-C₁₀-haloalqueno, C₂-C₁₀-alquino, C₁-C₁₀-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, OR^a, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

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

- 40 R^{2a} se selecciona de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede

estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde

- 5 R^{2b}, R^{2c} son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilcarbonilo, hetarilsulfonilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los ocho últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi o
- 10 R^{2b} y R^{2c} junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, que puede llevar un heteroátomo adicional que es seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, y en donde
- 15 R^{2d} se selecciona de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 20 R¹ es hidrógeno, o C₁-C₃-alquilo;
R² es hidrógeno;
R³ es hidrógeno;
R⁵ es hidrógeno;
Y es O o S;
- 25 R^a, R^b, R^c son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 30 R^d se selecciona de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 35 R^e, R^f son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, hetarilo, hetarilcarbonilo, hetarilsulfonilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los ocho últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi, o
- 40 R^e y R^f junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, que puede llevar un heteroátomo adicional que es seleccionado de O, S y N como un átomo miembro de anillo y en donde el heterociclo puede estar no sustituido o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 45 R^g, R^h son independientemente uno de otro seleccionados de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, hetarilo, fenil-C₁-C₄-alquilo y hetaril-C₁-C₄-alquilo, en donde el anillo aromático en los cuatro últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;
- 50 Rⁱ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilmetilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo y fenil-C₁-C₄-

alquilo en donde el anillo de fenilo en los dos últimos radicales mencionados puede estar sin sustituir o puede llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes que, independientemente uno de otro, se seleccionan de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

5 R^x son independientemente unos de otro seleccionados de ciano, nitro, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₁₀-alquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, heterocícilo de 5 a 7 miembros, fenilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, heterocíciloxi de 5 a 7 miembros y fenoxi, en donde los últimos 6 radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales. R^y;

10 R^y se selecciona de halógeno, ciano, nitro, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinilo, C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, C₁-C₄-alquilsulfonilo, C₁-C₄-haloalquilsulfonilo, C₁-C₄-alquilcarbonilo, C₁-C₄-haloalquilcarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-halocicloalquilo, C₂-C₄-alqueno, C₂-C₄-haloalqueno, C₂-C₄-alquino y C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo.

2. El método como se reivindica en la reivindicación 1, en donde el compuesto de pirazol es un compuesto de fórmula I, en donde X¹ en la fórmula I es oxígeno.

15 3. El método como se reivindica en la reivindicación 1 o 2, en donde B es CH.

4. El método como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde B es N.

5. El método como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R^{px} se selecciona de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo y C₂-C₁₀-alqueno, en donde los 2 últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir, pueden estar parcial o totalmente halogenados o pueden llevar 1, 2 o 3 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo, fenilo y fenoxi, en donde los últimos tres radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfinilo y C₁-C₄-haloalquilsulfinilo, o en donde R^{px} se selecciona además de C₃-C₆-cicloalquilo, hetarilo y fenilo, en los que los tres últimos radicales mencionados pueden estar sin sustituir o pueden llevar 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₁-C₄-alquilsulfinilo y C₁-C₄-haloalquilsulfinilo.

25 6. El método como se reivindica en la reivindicación 5, en donde R^{px} se selecciona de halógeno, CN, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₃-C₆-cicloalquilo y

C₃-C₆-halocicloalquilo.

30 7. El método como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde n es 0, 1 o 2.

8. El método como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde el radical cíclico D junto con el pirazol forma un radical derivado de pirazolo[1,5-a]pirazina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-a]pirazina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-a]pirazina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirazina, pirazolo[1,5-c]pirimidina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-c]pirimidina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-c]pirimidina, 4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-c]pirimidina, pirazolo[1,5-b]piridazina, 4,5-dihidropirazolo[1,5-b]piridazina, 6,7-dihidropirazolo[1,5-b]piridazina y pirazolo[1,5-b]tetrahidropiridazina.

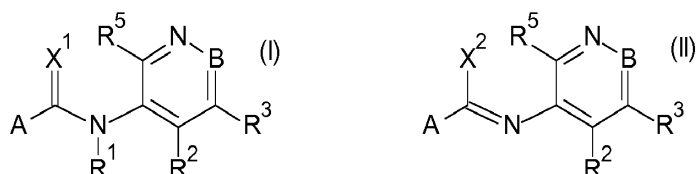
9. El método como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde A es un radical A1.

10. El método como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en donde A es un radical A2.

40 11. Un método para proteger el material de propagación de la planta y/o las plantas que crecen a partir del mismo, cuyo método comprende tratar el material de propagación de la planta con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de las fórmulas I o II o una sal agrícola aceptable o un N-óxido como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10.

12. Material de propagación de plantas, que comprende al menos un compuesto de fórmulas I o II como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 y/o una sal agrícola aceptable o un N-óxido del mismo.

45 13. Compuestos de pirazol de fórmula I o II o una sal o un N-óxido de los mismos:



en donde

A, B, R¹, R², R³, R⁵, X¹ y X² son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, las siguientes moléculas se excluyen del alcance de la reivindicación 13:

- a) N-piridin-3-il pirazolo[1,5-a]piridin-3-carboxamida,
- 5 b) N-piridin-3-il pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida,
- c) N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(3,4-dimetoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida,
- d) N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(2-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida,
- e) N-piridin-3-il 7-trifluorometil-5-(3-metoxifenil)-4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida,
- f) N-piridin-3-il 5-ciclohexil-7,7-dimetil-4,5,6,7-tetrahidropirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida,
- 10 g) N-piridin-3-il 5-(4-bromofenil)-7-trifluorometil-pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-carboxamida,
- h) N-piridin-3-il 6-(2-clorofenil)-7-(4-clorofenil) pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida,
- i) 4-metoxi-6-(1-metilpirazol-4-il)-N-(3-piridil)pirazolo[1,5-a]piridin-3-carboxamida; y
- j) 6-[[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]metil]-N-(3-piridil)pirazolo[1,5-a]pirimidin-3-carboxamida,
- k) 3-cloro-5-(4-fluorofenil)-N-(3-piridil)-7-(trifluorometil)pirazolo[1,5-a]pirimidin-2-carboxamida.
- 15 14. Una composición agrícola que contiene al menos un compuesto de fórmulas I o II como se define en la reivindicación 13 y/o una sal o N-óxido agrícolamente aceptable de los mismos y al menos un vehículo líquido o sólido.