

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 969 738**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01) **A61P 33/14** (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01)
A01N 47/12 (2006.01)
A01N 47/34 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
A61P 33/10 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **26.05.2020 PCT/JP2020/020643**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **03.12.2020 WO20241606**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **26.05.2020 E 20814482 (4)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **29.11.2023 EP 3978077**

54 Título: **Compuesto heterocíclico condensado que tiene un átomo de nitrógeno como cabeza de puente o una sal del mismo, insecticida agrícola u hortícola que comprende el compuesto y método para usar el insecticida**

30 Prioridad:

27.05.2019 JP 2019098298

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
22.05.2024

73 Titular/es:

**NIHON NOHYAKU CO., LTD. (100.0%)
19-8, Kyobashi 1-chome Chuo-ku
Tokyo 104-8386, JP**

72 Inventor/es:

**SANO, YUSUKE y
YONEMURA, IKKI**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 969 738 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

Compuesto heterocíclico condensado que tiene un átomo de nitrógeno como cabeza de puente o una sal del mismo, insecticida agrícola u hortícola que comprende el compuesto y método para usar el insecticida

5

Campo técnico

La presente invención se refiere a un insecticida agrícola u hortícola que comprende un compuesto heterocíclico condensado que tiene un átomo de nitrógeno como cabeza de puente o una sal del mismo como principio activo, y a un método para usar el insecticida.

10

Antecedentes de la técnica

Se han examinado diversos compuestos por su potencial como insecticidas agrícolas u hortícolas y, entre ellos, se ha informado que ciertas clases de compuestos heterocíclicos condensados son útiles como insecticidas (por ejemplo, véase la bibliografía de patentes 1 a 11). La bibliografía, sin embargo, no divulga específicamente ningún compuesto en el que un anillo de piridina que contiene un grupo oxima esté unido a un anillo heterocíclico condensado que tenga un átomo de nitrógeno como cabeza de puente.

15

Lista de referencias bibliográficas**Bibliografía de patentes**

Bibliografía de patentes 1: documento JP-A 2009-280574

Bibliografía de patentes 2: documento JP-A 2010-275301

Bibliografía de patentes 3: documento JP-A 2011-79774

Bibliografía de patentes 4: documento JP-A 2012-131780

Bibliografía de patentes 5: documento WO 2012/086848

Bibliografía de patentes 6: documento WO 2014/142135

Bibliografía de patente 7: documento WO 2015/121136

Bibliografía de patente 8: documento WO 2017/065183

Bibliografía de patente 9: documento WO 2018/124129

Bibliografía de patentes 10: documento WO 2018/199209

Bibliografía de patente 11: documento WO 2019/038195

25

30

35

Sumario de la invención**Problema técnico**

En la producción de cultivos en los campos de la agricultura, la horticultura y similares, el daño provocado por las plagas de insectos, etc., aún es inmenso y han aparecido plagas de insectos resistentes a los insecticidas existentes. La presente invención se ha realizado en vista de tales circunstancias, y un objeto de la presente invención es desarrollar y proporcionar un nuevo insecticida agrícola u hortícola. Otro objeto de la presente invención es proporcionar un agente capaz de eliminar ectoparásitos o endoparásitos de animales.

40

45

Solución al problema

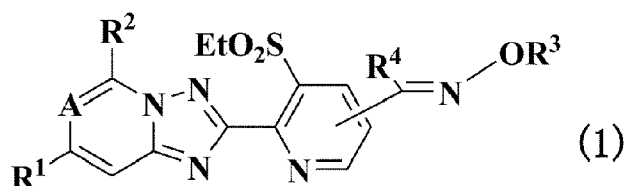
Los presentes inventores llevaron a cabo una investigación intensiva para lograr el objeto mencionado anteriormente. Como resultado, los presentes inventores encontraron que el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) o una sal del mismo no sólo es altamente eficaz en el control de plagas agrícolas u hortícolas, sino que también tiene la capacidad de eliminar ectoparásitos o endoparásitos de animales mientras tiene poco impacto en organismos no diana y moderada degradabilidad en el medio ambiente. Basándose en este hallazgo, los presentes inventores completaron la presente invención.

50

55

Esto es, la presente invención se refiere a lo siguiente.

[1] Un compuesto heterocíclico condensado representado por la siguiente fórmula:



60

{en donde

R¹ representa

- 5 (a1) un átomo de hidrógeno;
 (a2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (a3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
 (a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

10 R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno;
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (b3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 15 (b4) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
 (b5) un grupo halocicloalquilo (C₃-C₆),

R³ representa

- 20 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (c4) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (c5) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 25 (c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c7) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
 (c8) un grupo alquilsulfonil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

- 30 (d1) un átomo de hidrógeno;
 (d2) un átomo de halógeno;
 (d3) un grupo ciano;
 (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 35 (d5) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (d7) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alqueno (C₂-C₆);
 (d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
 (d9) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
 40 (d10) un grupo R⁶(R)⁷N en donde R⁶ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alcocarbonilo (C₁-C₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆) o un grupo cicloalquilcarbonilo (C₃-C₆);
 (d11) un grupo NR⁶CON(R)⁶R⁷ grupo en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
 (d12) un grupo arilo;
 45 (d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 50 (d14) un grupo heterocíclico; o
 (d15) un grupo heterocíclico que tiene, en el anillo, de 1 a 3 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

A representa un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno, (e2) un grupo alquilo (C₁-C₆) o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), o una sal del mismo.

60 [2] El compuesto heterocíclico condensado unido o una sal del mismo de acuerdo con el punto [1] anterior, en donde

R¹ representa

- 65 (a1) un átomo de hidrógeno; o
 (a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno; o
(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

5

R³ representa

- (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
(c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
(c7) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
(c8) un grupo alquilsulfonil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

10

R⁴ representa

- (d1) un átomo de hidrógeno;
(d2) un átomo de halógeno;
(d3) un grupo ciano;
(d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(d5) un grupo alqueno (C₂-C₆);
(d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
(d7) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alqueno (C₂-C₆);
(d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
(d9) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
(d10) un grupo R⁶(R⁷)N en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
(d11) un grupo NR⁶CON(R⁶)R⁷ grupo en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
(d12) un grupo arilo;
(d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
(d14) un grupo heterocíclico; o
(d15) un grupo heterocíclico que tiene, en el anillo, de 1 a 3 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

15

20

25

30

35

40

A representa un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno, (e2) un grupo alquilo (C₁-C₆) o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

[3] El compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con el punto [1] anterior, en donde

R¹ representa

- (a1) un átomo de hidrógeno; o
(a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

45

R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno; o
(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

50

R³ representa

- (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
(c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
(c8) un grupo alquilsulfonil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

55

60

R⁴ representa

- (d1) un átomo de hidrógeno;
(d2) un átomo de halógeno;
(d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
(d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);

65

(d12) un grupo arilo; o

(d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfínico (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfínico (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

A representa un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

[4] Un insecticida agrícola u hortícola que comprende, como principio activo, el compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con uno cualquiera de los puntos [1] a [3] anteriores.

[5] Un método para usar un insecticida agrícola u hortícola, que comprende tratar las plantas o el suelo con una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con uno cualquiera de los puntos [1] a [3] anteriores.

[6] Un agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales que comprende, como principio activo, una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con uno cualquiera de los puntos [1] a [3] anteriores.

[7] El agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales de acuerdo con el punto [6] anterior para su uso en el tratamiento o prevención de infecciones parasitarias en un animal.

[8] El agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales para su uso de acuerdo con el punto [7] anterior, en donde el animal es un mamífero doméstico o un ave.

[9] El agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales para su uso de acuerdo con los puntos [7] u [8] anteriores, en donde el agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales se administra por vía transdérmica u oral al animal.

Efectos ventajosos de la invención

El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo no sólo es un insecticida agrícola u hortícola altamente eficaz sino que también es eficaz contra plagas que viven en animales de compañía tales como perros y gatos y animales domésticos tales como ganado vacuno y ovino y otras plagas dañinas tales como termitas.

Descripción de las realizaciones

En las definiciones de la fórmula general (1) que representa el compuesto heterocíclico condensado que tiene un átomo de nitrógeno como cabeza de puente de la presente invención o una sal del mismo, "halo" se refiere a un "átomo de halógeno" y representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un átomo de flúor.

El "grupo alquilo (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo *terc*-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo *terc*-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2,3-dimetilpropilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo 1-metilbutilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo n-hexilo, un grupo isohexilo, un grupo 2-hexilo, un grupo 3-hexilo, un grupo 2-metilpentilo, un grupo 3-metilpentilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilo, un grupo 3,3-dimetilbutilo o similar.

El "grupo cicloalquilo (C₃-C₆)" se refiere a un grupo alquilo cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo o similar. El "grupo alcoxi (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alcoxi de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo *terc*-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo *terc*-pentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo 2,3-dimetilpropiloxi, un grupo 1-etilpropiloxi, un grupo 1-metilbutiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo isohexiloxi, un grupo 1,1,2-trimetilpropiloxi o similar. El "grupo alquenoiloxi (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alquenoiloxi de cadena lineal o cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propeniloxi, un grupo buteniloxi, un grupo penteniloxi, un grupo hexeniloxi o similar. El "grupo alquinoiloxi (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alquinoiloxi de cadena lineal o cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propiniloxi, un grupo butiniloxi, un grupo pentiniloxi, un grupo hexiniloxi o similar.

El "grupo alquiltio (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquiltio de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo n-butiltio, un grupo sec-butiltio, un grupo *terc*-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo isopentiltio, un grupo *terc*-pentiltio, un grupo neopentiltio, un grupo 2,3-dimetilpropiltio, un grupo 1-etilpropiltio, un grupo 1-metilbutiltio, un grupo n-hexiltio, un grupo isohexiltio, un grupo 1,1,2-trimetilpropiltio o similar. El "grupo alquilsulfínico (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfínico de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfínico, un grupo etilsulfínico, un grupo n-propilsulfínico, un grupo isopropilsulfínico, un grupo n-butilsulfínico, un grupo sec-butilsulfínico, un grupo *terc*-butilsulfínico, un grupo n-pentilsulfínico, un grupo isopentilsulfínico, un grupo *terc*-pentilsulfínico, un grupo neopentilsulfínico, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfínico, un grupo 1-etilpropilsulfínico, un grupo 1-metilbutilsulfínico, un

R¹ es preferentemente

- 5 (a1) un átomo de hidrógeno; o
(a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² es preferentemente

- 10 (b1) un átomo de hidrógeno; o
(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ es preferentemente

- 15 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
(c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
(c7) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
(c8) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

20 R⁴ es preferentemente

- (d1) un átomo de hidrógeno;
(d2) un átomo de halógeno;
(d3) un grupo ciano;
25 (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(d5) un grupo alqueno (C₂-C₆);
(d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
(d7) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₂-C₆);
(d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
30 (d9) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
(d10) un grupo R⁶(R⁷)N en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
(d11) un grupo NR⁶CON(R⁶)R⁷ grupo en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
(d12) un grupo arilo;
(d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsufinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsufinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonyl (C₁-C₆);
40 (d14) un grupo heterocíclico; o
(d15) un grupo heterocíclico que tiene, en el anillo, de 1 a 3 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsufinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsufinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonyl (C₁-C₆), y

45 A es preferentemente un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno, (e2) un grupo alquilo (C₁-C₆) o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

Adicionalmente,

50 R¹ es más preferentemente

- (a1) un átomo de hidrógeno; o
55 (a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² es más preferentemente

- (b1) un átomo de hidrógeno; o
60 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ es más preferentemente

- (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
65 (c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
(c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
(c8) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

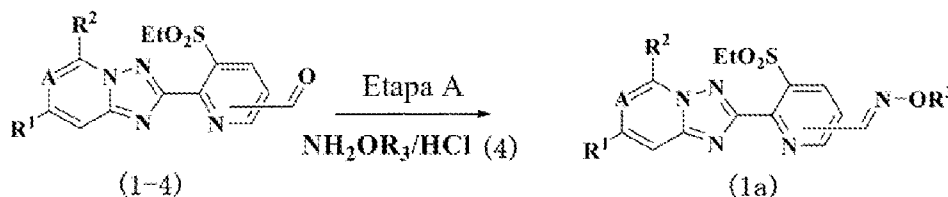
R⁴ es más preferentemente

- 5 (d1) un átomo de hidrógeno;
 (d2) un átomo de halógeno;
 (d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
 (d12) un grupo arilo; o
 10 (d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsufinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsufinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y
- 15 A es más preferentemente un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) o una sal del mismo se puede producir, por ejemplo, mediante el método descrito en los documentos WO 2017/065183 o WO 2018/124129, o mediante los métodos de producción que se describen a continuación, pero la presente invención no se limita a estos métodos. Los compuestos intermedios usados en los métodos de producción de la presente invención pueden ser productos disponibles comercialmente tal como están, o pueden derivarse de productos disponibles comercialmente mediante métodos conocidos.

25 Método de producción 1

[Fórmula química 2]



(En la fórmula, R¹, R², R³ y A son los mismos que los anteriores).

30

Método de producción en la etapa [A]

El compuesto representado por la fórmula general (1a) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1-4) producido mediante el método descrito en el Método de producción 3 a continuación con el compuesto (NH₂OR³) representado por la fórmula general (4) en presencia de una base y un disolvente inerte.

35

Los ejemplos de la base que se puede usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio y hidrogenocarbonato de potasio; acetatos tales como acetato de potasio; aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropilamina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y 4-dimetilaminopiridina. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (4).

40

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen disolventes no polares o polares tales como hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres en cadena o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano y tetrahydrofurano; ésteres, tales como acetato de etilo; alcoholes, tales como metanol y etanol; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; y otros tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y otros disolventes inertes tales como agua. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

50

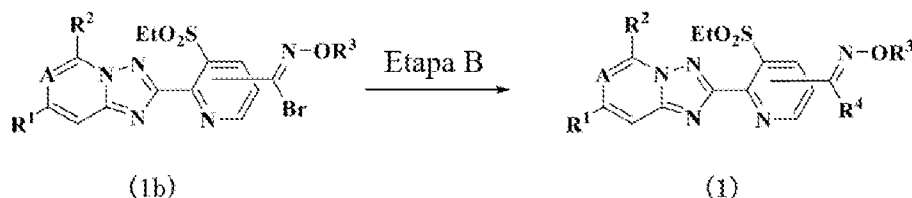
Dado que esta reacción es una reacción equimolar de los compuestos, estos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero básicamente está en el intervalo de unos minutos

55

a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

5 Método de producción 2

[Fórmula química 3]



(En la fórmula, R¹, R², R³, R⁴ y A son los mismos que los anteriores).

10

Método de producción en la etapa [B]

15

El compuesto representado por la fórmula general (1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1b) producido mediante el método descrito en el Método de producción 4 a continuación con un nucleófilo tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio, un grupo dimetilamino, o 1,2,4-triazol.

20

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen disolventes no polares o polares tales como hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres en cadena o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres, tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y otros tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

25

30

Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, el compuesto representado por la fórmula general (1b) y el nucleófilo se utilizan básicamente en cantidades equimolares, pero el nucleófilo puede usarse en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de -10 °C al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero básicamente está en el intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

35

De forma alternativa, el compuesto representado por la fórmula general (1) se puede producir mediante acoplamiento cruzado del compuesto representado por la fórmula general (1b) con un ácido borónico (R⁴B(OH)₂) correspondiente en presencia de un catalizador metálico y una base en un disolvente inerte.

40

Los ejemplos del catalizador metálico que se pueden usar en esta reacción incluyen un catalizador de paladio, un catalizador de níquel, un catalizador de hierro, un catalizador de rutenio, un catalizador de platino, un catalizador de rodio y un catalizador de iridio. Tal catalizador metálico se puede usar en forma de un metal; un metal soportado; una sal metálica tal como cloruro de metal, un bromuro de metal, un yoduro de metal, un nitrato de metal, un sulfato de metal, un carbonato de metal, un oxalato de metal, un acetato metálico y un óxido metálico; o un compuesto complejo tal como un complejo de olefina, un complejo de fosfina, un complejo de amina, un complejo de amina y un complejo de acetilacetato. Se prefiere un catalizador de paladio.

45

50

55

Ejemplos de catalizador de paladio incluyen metales de paladio tales como negro de paladio y esponja de paladio; y metales de paladio soportados tales como paladio/alúmina, paladio/carbono, paladio/sílice y paladio/zeolita tipo Y. También se incluyen sales metálicas de paladio tales como cloruro de paladio, bromuro de paladio, yoduro de paladio y acetato de paladio. Ejemplos del compuesto complejo de paladio incluyen dímero de cloruro de π-alilpaladio, acetilacetato de paladio, diclorobis(acetonitrilo)paladio, diclorobis(benzonitrilo)paladio, bis(dibencilidenoacetona)paladio, tris(dibencilidenoacetona)dipaladio, tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (aducto de cloroformo), diclorodiamina paladio, diclorobis(trifenilfosfina)paladio, diclorobis(triciclohexilfosfina)paladio, tetraquis(trifenilfosfina)paladio, dicloro[1,2-bis(difenilfosfino)etano]paladio, dicloro[1,3-bis(difenilfosfino)propano]paladio, dicloro[1,4-bis(difenilfosfino)butano]paladio, dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y un complejo de [(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio-diclorometano.

Estos catalizadores de paladio se pueden usar solos o junto con una fosfina terciaria. Los ejemplos de la fosfina

terciaria que se pueden usar junto con el catalizador de paladio incluyen trifenilfosfina, trimetilfosfina, trietilfosfina, tributilfosfina, tri(*tert*-butil)fosfina, triciclohexilfosfina, tri-*o*-tolilfosfina, trioctilfosfina, 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno, 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfino)bifenilo, 1,2-bis(difenilfosfino)etano, 1,3-bis(difenilfosfino)propano, 1,4-bis(difenilfosfino)butano, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, (S)-(-)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo y (\pm)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo.

Ejemplos del compuesto de ácido borónico que se puede usar en esta reacción incluyen ácido fenilborónico, ácido 3-carboxifenilborónico, ácido 4-clorofenilborónico, ácido 4-(4-propilciclohexil)fenilborónico, ácido 4-fluorofenilborónico, ácido 4-trifluorometilfenilborónico, ácido 4-trifluorometoxifenilborónico, ácido (4-propilciclohexil)fenilborónico y ácido ciclopropilborónico. Se pueden utilizar productos comercialmente disponibles de estos compuestos.

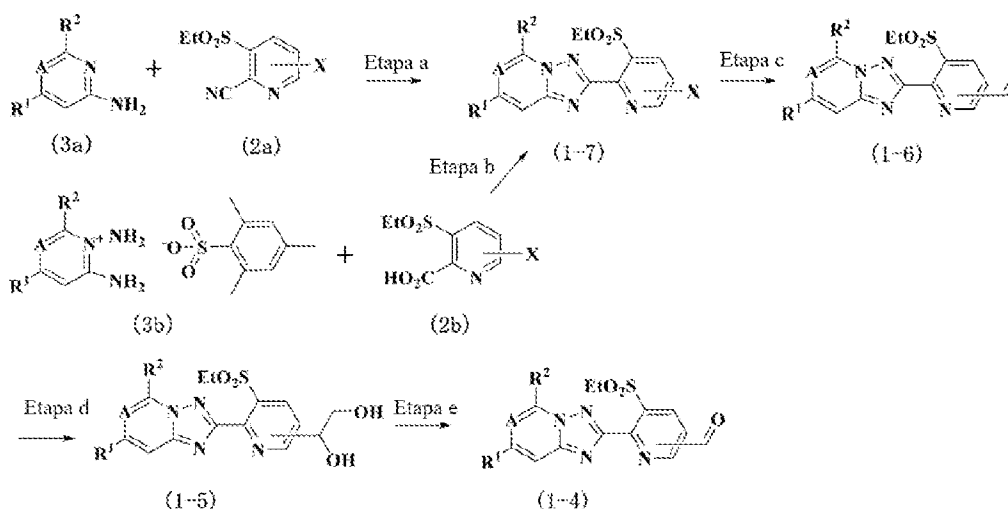
Los ejemplos de la base que se puede usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato de sodio e hidrogenocarbonato de potasio. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de aproximadamente 1 a 5 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (1b).

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen disolventes no polares o polares tales como alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres en cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano y 1,2-dimetoxietano (DME); hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo; ésteres, tales como acetato de etilo; y otros tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y otros disolventes inertes tales como agua. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

La temperatura de reacción en esta reacción habitualmente está en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similar, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado del intervalo de unos minutos a 48 horas. Esta reacción se puede llevar a cabo en la atmósfera de un gas inerte tal como gas nitrógeno y gas argón. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción 3

[Fórmula química 4]



(En la fórmula, R¹, R², R³, R⁴ y A son los mismos que los anteriores, y X representa un átomo de halógeno).

Método de producción en la etapa [a]

El compuesto representado por la fórmula general (1-7) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (3a) y el compuesto representado por la fórmula general (2a) de acuerdo con el método descrito en J. Am. Química. Soc. 2009, 131, 15080-15081 o en el documento WO 2013/041472. Una vez completada la reacción, el

compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [b]

- 5 De forma alternativa, el compuesto representado por la fórmula general (1-7) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (3b), que se produce de acuerdo con el método descrito en J. Heterocyclic. Chem., 1975, 12, 107-110 o en el documento WO 2015/000715, y el compuesto representado por la fórmula general (2b) de acuerdo con el método descrito en la bibliografía antes mencionada. Una vez completada la reacción, el compuesto
- 10 de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [c]

- 15 El compuesto representado por la fórmula general (1-6) se puede producir sometiendo el compuesto representado por la fórmula general (1-7) a acoplamiento cruzado con un compuesto de ácido vinilborónico en presencia de un catalizador metálico y una base en un disolvente inerte.

- 20 Los ejemplos del catalizador metálico que se pueden usar en esta reacción incluyen un catalizador de paladio, un catalizador de níquel, un catalizador de hierro, un catalizador de rutenio, un catalizador de platino, un catalizador de rodio y un catalizador de iridio. Tal catalizador metálico se puede usar en forma de un metal; un metal soportado; una sal metálica tal como cloruro de metal, un bromuro de metal, un yoduro de metal, un nitrato de metal, un sulfato de metal, un carbonato de metal, un oxalato de metal, un acetato metálico y un óxido metálico; o un compuesto complejo tal como un complejo de olefina, un complejo de fosfina, un complejo de amina, un complejo de amina y un complejo
- 25 de acetilacetato.

- Ejemplos de catalizador de paladio incluyen metales de paladio tales como negro de paladio y esponja de paladio; y metales de paladio soportados tales como paladio/alúmina, paladio/carbono, paladio/sílice y paladio/zeolita tipo Y. También se incluyen sales metálicas de paladio tales como cloruro de paladio, bromuro de paladio, yoduro de paladio y acetato de paladio. Ejemplos del compuesto complejo de paladio incluyen dímero de cloruro de π -alilpaladio, acetilacetato de paladio, diclorobis(acetonitrilo)paladio, diclorobis(benzonitrilo)paladio, bis(dibencilidenoacetona)paladio, tris(dibencilidenoacetona)dipaladio, tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (aducto de cloroformo), diclorodiamina paladio, diclorobis(trifenilfosfina)paladio, diclorobis(triciclohexilfosfina)paladio, tetraquis(trifenilfosfina)paladio, dicloro[1,2-bis(difenilfosfino)etano]paladio, dicloro[1,3-
- 30 bis(difenilfosfino)propano]paladio, dicloro[1,4-bis(difenilfosfino)butano]paladio, dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y un complejo de [(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio-diclorometano.
- 35

- Estos catalizadores de paladio se pueden usar solos o junto con una fosfina terciaria. Los ejemplos de la fosfina terciaria que se pueden usar junto con el catalizador de paladio incluyen trifenilfosfina, trimetilfosfina, trietilfosfina, tributilfosfina, tri(*tert*-butil)fosfina, triciclohexilfosfina, tri-*o*-tolilfosfina, triocilfosfina, 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno, 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfino)bifenilo, 1,2-bis(difenilfosfino)etano, 1,3-bis(difenilfosfino)propano, 1,4-bis(difenilfosfino)butano, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno, (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, (S)-(-)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo y (\pm)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo.
- 40

- 45 Los ejemplos del compuesto de ácido arilborónico que se puede usar en esta reacción incluyen bromuro de vinilmagnesio, cloruro de vinilmagnesio, cloruro de vinilcinc, tributilvinilestaño, viniltrifluoroborato de potasio, ácido vinilborónico, anhídrido vinilborónico, 2-metil-2,4-pentanodiol éster del ácido vinilborónico, pinacol éster del ácido vinilborónico y trietoxivinilsilano.

- 50 Los ejemplos de la base que se puede usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato de sodio e hidrogenocarbonato de potasio. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de aproximadamente 1 a 5 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (1-6).

- 55 El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen disolventes no polares o polares tales como alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres en cadena o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, dioxano y 1,2-dimetoxietano (DME); hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo; ésteres, tales como acetato de etilo; y otros tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y otros disolventes inertes tales como agua. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.
- 60

- 65 La temperatura de reacción en esta reacción habitualmente está en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y

similar, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado del intervalo de unos minutos a 48 horas. Esta reacción se puede llevar a cabo en la atmósfera de un gas inerte tal como gas nitrógeno y gas argón. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [d]

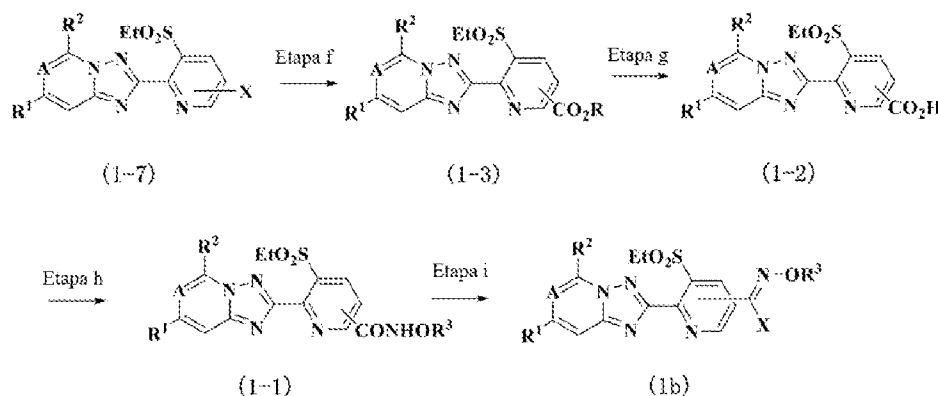
El compuesto heterocíclico condensado que contiene diol representado por la fórmula general (1-5) se puede producir mediante reacción del compuesto heterocíclico condensado que contiene vinilo representado por la fórmula general (1-6) en presencia de tetróxido de osmio y un agente oxidante de acuerdo con el método descrito en Lecture of Experimental Chemistry (Jikken Kagaku Kouza), 4ª edición, vol. 23, Organic Chemistry V, Oxidation Reaction (publicado por Maruzen Co., Ltd.). Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. De forma alternativa, el producto en bruto puede someterse a la siguiente etapa sin purificación.

Método de producción en la etapa [e]

El compuesto representado por la fórmula general (1-4) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto que contiene diol representado por la fórmula general (1-5) con un compuesto de ácido peryódico en presencia de un disolvente inerte de acuerdo con el método descrito en New Lecture of Experimental Chemistry (Shin Jikken Kagaku Kouza), vol. 15, Oxidation and Reduction I-1 (publicado por Maruzen Co., Ltd). Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción 4

[Fórmula química 5]



(En la fórmula, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y A son los mismos que los anteriores, y X representa un átomo de halógeno).

Método de producción en la etapa [f]

El compuesto representado por la fórmula general (1-3) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1-7), que se produce mediante el método descrito en el Método de Producción 3 anterior, de acuerdo con el método descrito en el documento JP 2005-272338, la llamada reacción de Heck. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Si se desea, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [g]

El compuesto representado por la fórmula general (1-2) se puede producir hidrolizando el compuesto representado por la fórmula general (1-3) en presencia de una base y/o un disolvente inerte.

Los ejemplos de la base usada en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato de sodio e hidrogenocarbonato de potasio.

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso

de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres en cadena o cíclicos tales como éter dietílico, metil *terc*-butil éter, dioxano y tetrahidrofurano; y agua. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

5 La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero básicamente está en el intervalo de unos minutos a 48 horas.

10 Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [h]

15 El compuesto representado por la fórmula general (1-1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1-2) con el compuesto representado por R^3O-NH_2 (en donde R^3 es el mismo que el anterior) en presencia de un agente de condensación y una base en un disolvente inerte.

20 Ejemplos del agente de condensación usado en esta reacción incluyen clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (EDCI), fosforocianidato de dietilo (DEPC), carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), ésteres clorocarbónicos y yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio. La cantidad de agente de condensación usada se selecciona apropiadamente del intervalo de una cantidad molar de 1 a 1,5 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (1-2).

25 Los ejemplos de la base usada incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio e hidrogenocarbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos de metal alcalino tales como *t*-butóxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropilamina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y dimetilaminopiridina. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (1-2).

35 El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres en cadena o cíclicos tales como éter dietílico, metil *terc*-butil éter, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres, tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y otros disolventes tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

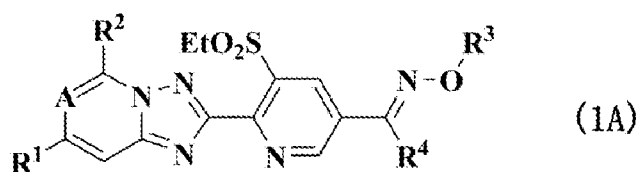
45 Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, estos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero básicamente está en el intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

50 Método de producción en la etapa [i]

55 El compuesto representado por la fórmula general (1b) se puede producir mediante la denominada reacción de Appel (Org. Synth. 54, 63-63), es decir, haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1-1) con trifenilfosfina y tetracloruro de carbono o tetrabromuro de carbono. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

60 Los ejemplos específicos del compuesto de la presente invención se muestran a continuación. En las siguientes tablas, Me representa un grupo metilo, Et representa un grupo etilo, *n*-Pr representa un grupo *n*-propilo, *i*-Pr representa un grupo isopropilo, *c*-Pr representa un grupo ciclopropilo, Vinilo representa un grupo vinilo, Ph representa un grupo fenilo, Py representa un grupo piridilo y Ac representa un grupo acetilo. En la columna de "Valor de propiedad física" se muestra un punto de fusión (°C) o "RMN de 1H ". Los datos de RMN de 1H se muestran en la Tabla 10.

[Fórmula química 6]



[Tabla 1]

Tabla 1

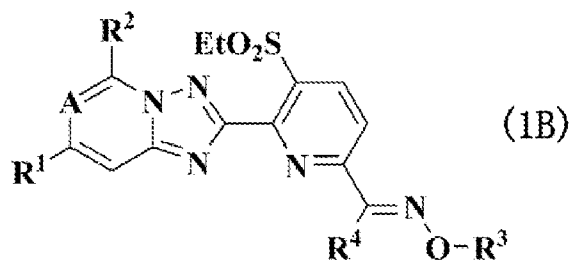
N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ²	R ⁴	A	Valor de la propiedad física
1-1	CF ₃	H	H	H	MC	
1-2	CF ₃	Me	H	H	MC	
1-3	CF ₃	Et	H	H	MC	188-189
1-4	CF ₃	n-Pr	H	H	MC	
1-5	CF ₃	i-Pr	H	H	MC	184-185
1-6	CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H	MC	191-192
1-7	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	H	H	MC	189-190
1-8	CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	MC	171-172
1-9	CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	MC	164-165
1-10	CF ₃	H	Me	H	MC	
1-11	CF ₃	Me	Me	H	MC	
1-12	CF ₃	Et	Me	H	MC	
1-13	CF ₃	n-Pr	Me	H	MC	
1-14	CF ₃	i-Pr	Me	H	MC	
1-15	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	H	MC	210-211
1-16	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Me	H	MC	169-170
1-17	CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	MC	
1-18	CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	Me	H	MC	
1-19	H	H	H	H	CCF ₃	
1-20	H	Me	H	H	CCF ₃	
1-21	H	Et	H	H	CCF ₃	
1-22	H	n-Pr	H	H	CCF ₃	
1-23	H	i-Pr	H	H	CCF ₃	
1-24	H	CH ₂ CF ₃	H	H	CCF ₃	155-156
1-25	H	CH ₂ CHF ₂	H	H	CCF ₃	187-188
1-26	H	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	CCF ₃	145-146
1-27	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	CCF ₃	159-160

[Tabla 2]

Tabla 2

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ²	R ⁴	A	Valor de la propiedad física
1-28	CF ₃	H	H	H	N	
1-29	CF ₃	Me	H	H	N	
1-30	CF ₃	Et	H	H	N	
1-31	CF ₃	n-Pr	H	H	N	
1-32	CF ₃	i-Pr	H	H	N	
1-33	CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H	N	
1-34	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	H	H	N	
1-35	CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	N	
1-36	CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	N	
1-37	CF ₂ CF ₃	H	H	H	N	
1-38	CF ₂ CF ₃	Me	H	H	N	
1-39	CF ₂ CF ₃	Et	H	H	N	
1-40	CF ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	N	
1-41	CF ₂ CF ₃	i-Pr	H	H	N	
1-42	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H	N	
1-43	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CHF ₂	H	H	N	
1-44	CF ₂ CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	N	
1-45	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	N	
1-46	H	CH ₂ SCH ₃	H	H	CCF ₃	151-152
1-47	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	MC	162-164 (TLC, parte superior) *1
1-48	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	H	H	MC	140-141 (TLC, parte inferior) *1
1-49	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	H	H	MC	243-245
1-50	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	H	H	MC	148-149 (TLC, parte superior) *2
1-51	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	H	H	MC	82-83 (TLC, parte inferior) *2
1-52	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	H	H	MC	223-225
*1 Los compuestos 1-47 y 1-48 son isómeros (isómeros Z y E).						
*2 Los compuestos 1-50 y 1-51 son isómeros (isómeros Z y E).						

[Fórmula química 7]



[Tabla 3]

Tabla 3

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ²	R ⁴	A	Valor de la propiedad física
2-1	CF ₃	H	H	H	MC	
2-2	CF ₃	Me	H	H	MC	
2-3	CF ₃	Et	H	H	MC	
2-4	CF ₃	n-Pr	H	H	MC	
2-5	CF ₃	i-Pr	H	H	MC	
2-6	CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H	MC	135-136
2-7	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	H	H	MC	172-173
2-8	CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	MC	53-54
2-9	CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	MC	
2-10	CF ₃	H	Me	H	MC	
2-11	CF ₃	Me	Me	H	MC	
2-12	CF ₃	Et	Me	H	MC	
2-13	CF ₃	n-Pr	Me	H	MC	
2-14	CF ₃	i-Pr	Me	H	MC	
2-15	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	H	MC	174-175
2-16	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Me	H	MC	167-168
2-17	CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	MC	141-142
2-18	CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	Me	H	MC	
2-19	H	H	H	H	CCF ₃	
2-20	H	Me	H	H	CCF ₃	RMN
2-21	H	Et	H	H	CCF ₃	
2-22	H	n-Pr	H	H	CCF ₃	
2-23	H	i-Pr	H	H	CCF ₃	
2-24	H	CH ₂ CF ₃	H	H	CCF ₃	RMN
2-25	H	CH ₂ CHF ₂	H	H	CCF ₃	168-170
2-26	H	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	CCF ₃	
2-27	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	CCF ₃	

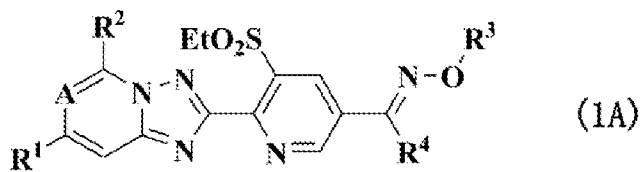
ES 2 969 738 T3

[Tabla 4]

Tabla 4

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ²	R ⁴	A	Valor de la propiedad física
2-28	CF ₃	H	H	H	N	
2-29	CF ₃	Me	H	H	N	
2-30	CF ₃	Et	H	H	N	
2-31	CF ₃	n-Pr	H	H	N	
2-32	CF ₃	i-Pr	H	H	N	
2-33	CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H	N	
2-34	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	H	H	N	
2-35	CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	N	
2-36	CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	N	
2-37	CF ₂ CF ₃	H	H	H	N	
2-38	CF ₂ CF ₃	Me	H	H	N	
2-39	CF ₂ CF ₃	Et	H	H	N	
2-40	CF ₂ CF ₃	n-Pr	H	H	N	
2-41	CF ₂ CF ₃	i-Pr	H	H	N	
2-42	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	H	N	141-142
2-43	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CHF ₂	H	H	N	171-172
2-44	CF ₂ CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	H	H	N	
2-45	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	H	H	N	
2-46	CF ₃	H	Me	H	N	
2-47	CF ₃	Me	Me	H	N	
2-48	CF ₃	Et	Me	H	N	190-191
2-49	CF ₃	n-Pr	Me	H	N	
2-50	CF ₃	i-Pr	Me	H	N	
2-51	CF ₃	CH ₂ CF ₃	Me	H	N	198-199
2-52	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	Me	H	N	186-187
2-53	CF ₃	CH ₂ C ₂ F ₅	Me	H	N	
2-54	CF ₃	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	Me	H	N	

[Fórmula química 8]



[Tabla 5]

Tabla 5

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ⁴	R ²	A	Valor de la propiedad física
3-1	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	OMe	H	MC	165-166
3-2	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	OMe	H	MC	
3-3	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OMe	H	MC	
3-4	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NH ₂	H	MC	
3-5	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NH ₂	H	MC	
3-6	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NH ₂	H	MC	
3-7	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHMe	H	MC	
3-8	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHMe	H	MC	
3-9	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHMe	H	MC	
3-10	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NMe ₂	H	MC	
3-11	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NMe ₂	H	MC	
3-12	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NMe ₂	H	MC	
3-13	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHAc	H	MC	
3-14	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHAc	H	MC	
3-15	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHAc	H	MC	
3-16	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	N(Me)Ac	H	MC	
3-17	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	N(Me)Ac	H	MC	
3-18	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	N(Me)Ac	H	MC	
3-19	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Br	H	MC	188-189
3-20	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Br	H	MC	
3-21	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Br	H	MC	
3-22	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SMe	H	MC	
3-23	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SMe	H	MC	
3-24	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SMe	H	MC	
3-25	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	MC	
3-26	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	MC	
3-27	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	MC	

[Tabla 6]

Tabla 6

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ⁴	R ²	A	Valor de la propiedad física
3-28	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	c-Pr	H	MC	167-168
3-29	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	c-Pr	H	MC	
3-30	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	c-Pr	H	MC	
3-31	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Vinilo	H	MC	
3-32	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Vinilo	H	MC	
3-33	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Vinilo	H	MC	
3-34	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Me	H	MC	
3-35	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Me	H	MC	
3-36	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Me	H	MC	
3-37	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C≡C-C-Pr	H	MC	
3-38	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	C≡C-C-Pr	H	MC	
3-39	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C≡C-C-Pr	H	MC	
3-40	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHCO ₂ Me	H	MC	
3-41	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHCO ₂ Me	H	MC	
3-42	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHCO ₂ Me	H	MC	
3-43	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHCONHMe	H	MC	
3-44	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHCONHMe	H	MC	
3-45	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHCONHMe	H	MC	
3-46	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Ph	H	MC	157-158
3-47	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Ph	H	MC	
3-48	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Ph	H	MC	
3-49	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CN	H	MC	
3-50	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CN	H	MC	
3-51	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CN	H	MC	
3-52	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	3-OCF ₃ Ph	H	MC	125-127
3-53	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	3-OCF ₃ Ph	H	MC	
3-54	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	3-OCF ₃ Ph	H	MC	

[Tabla 7]

Tabla 7

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ⁴	R ²	A	Valor de la propiedad física
3-55	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	3-Tienilo	H	MC	
3-56	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	3-Tienilo	H	MC	
3-57	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	3-Tienilo	H	MC	
3-58	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1-Metipirazol-4-ilo	H	MC	
3-59	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	1-Metipirazol-4-ilo	H	MC	
3-60	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	1-Metipirazol-4-ilo	H	MC	
3-61	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1-Metipirazol-5-ilo	H	MC	
3-62	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	1-Metipirazol-5-ilo	H	MC	
3-63	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	1-Metipirazol-5-ilo	H	MC	
3-64	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	OMe	H	CCF ₃	
3-65	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	OMe	H	CCF ₃	
3-66	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OMe	H	CCF ₃	
3-67	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NH ₂	H	CCF ₃	
3-68	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NH ₂	H	CCF ₃	
3-69	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NH ₂	H	CCF ₃	
3-70	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHMe	H	CCF ₃	
3-71	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHMe	H	CCF ₃	
3-72	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHMe	H	CCF ₃	
3-73	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NMe ₂	H	CCF ₃	
3-74	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NMe ₂	H	CCF ₃	
3-75	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NMe ₂	H	CCF ₃	
3-76	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHAc	H	CCF ₃	
3-77	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHAc	H	CCF ₃	
3-78	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHAc	H	CCF ₃	
3-79	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	N(Me)Ac	H	CCF ₃	
3-80	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	N(Me)Ac	H	CCF ₃	
3-81	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	N(Me)Ac	H	CCF ₃	

[Tabla 8]

Tabla 8

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ⁴	R ²	A	Valor de la propiedad física
3-82	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Br	H	CCF ₃	151-152
3-83	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Br	H	CCF ₃	
3-84	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Br	H	CCF ₃	
3-85	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SMe	H	CCF ₃	
3-86	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SMe	H	CCF ₃	
3-87	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SMe	H	CCF ₃	
3-88	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	CCF ₃	
3-89	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	CCF ₃	
3-90	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	CCF ₃	
3-91	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	c-Pr	H	CCF ₃	
3-92	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	c-Pr	H	CCF ₃	
3-93	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	c-Pr	H	CCF ₃	
3-94	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Vinilo	H	CCF ₃	
3-95	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Vinilo	H	CCF ₃	
3-96	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Vinilo	H	CCF ₃	
3-97	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Me	H	CCF ₃	
3-98	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Me	H	CCF ₃	
3-99	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Me	H	CCF ₃	
3-100	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	C≡C-C-Pr	H	CCF ₃	
3-101	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	C≡C-C-Pr	H	CCF ₃	
3-102	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	C≡C-C-Pr	H	CCF ₃	
3-103	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHCO ₂ Me	H	CCF ₃	
3-104	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHCO ₂ Me	H	CCF ₃	
3-105	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHCO ₂ Me	H	CCF ₃	
3-106	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	NHCONHMe	H	CCF ₃	
3-107	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	NHCONHMe	H	CCF ₃	
3-108	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	NHCONHMe	H	CCF ₃	

[Tabla 9]

Tabla 9

N.º de compuesto	R ¹	R ³	R ⁴	R ²	A	Valor de la propiedad física
3-109	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	Ph	H	CCF ₃	
3-110	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	Ph	H	CCF ₃	
3-111	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Ph	H	CCF ₃	
3-112	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CN	H	CCF ₃	
3-113	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CN	H	CCF ₃	
3-114	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CN	H	CCF ₃	
3-115	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	3-Py	H	CCF ₃	
3-116	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	3-Py	H	CCF ₃	
3-117	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	3-Py	H	CCF ₃	
3-118	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	3-Tienilo	H	CCF ₃	
3-119	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	3-Tienilo	H	CCF ₃	
3-120	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	3-Tienilo	H	CCF ₃	
3-121	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1-Metipirazol-4-ilo	H	CCF ₃	
3-122	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	1-Metipirazol-4-ilo	H	CCF ₃	
3-123	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	1-Metilpirazol-4-ilo	H	CCF ₃	
3-124	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	1-Metipirazol-5-ilo	H	CCF ₃	
3-125	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	1-Metipirazol-5-ilo	H	CCF ₃	
3-126	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	1-Metilpirazol-5-ilo	H	CCF ₃	

5

[Tabla 10]

Tabla 10 Datos de RMN de H	
N.º de compuesto	Datos de RMN de ¹ H (CDCl ₃)
2-20	9,00 (s, 1H), 8,58 (d, 1H), 8,30 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 7,77 (dd, 1H), 4,08 (s, 3H), 3,91 (c, 2H), 1,40 (t, 3H)
2-24	9,01 (s, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,77 (dd, 1H), 4,62 (c, 2H), 3,92 (c, 2H), 1,40 (t, 3H)

El insecticida agrícola u hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo en forma de un principio activo es adecuado para controlar diferentes plagas que puede dañar el arroz con cáscara, árboles frutales, verduras, otros cultivos y plantas ornamentales con flores. Las plagas diana son, por ejemplo, plagas agrícolas y forestales, plagas hortícolas, plagas de granos almacenados, plagas sanitarias, nematodos, termitas, etc.

Los ejemplos específicos de plagas, nematodos, etc. incluyen los siguientes:

15 las especies del orden *Lepidoptera* tales como *Parasa consocia*, *Anomis mesogona*, *Papilio xuthus*, *Matsumuraeses azukivora*, *Ostrinia scapularis*, *Spodoptera exempta*, *Hyphantria cunea*, *Ostrinia furnacalis*, *Pseudaletia separata*, *Tinea transducers*, *Bactra furfurana*, *Pamara guttata*, *Marasmia exigua*, *Pamara guttata*, *Sesamia inferens*, *Brachmia triannulella*, *Monema flavescens*, *Trichoplusia ni*, *Pleuroptya ruralis*, *Cystidia couaggaria*, *Lampides boeticus*, *Cephonodes hylas*, *Helicoverpa armigera*, *Phalerodonta manleyi*, *Eumeta japonica*, *Pieris brassicae*, *Malacosoma neustria testacea*, *Stathmopoda masinissa*, *Cuphodes diospyrosella*, *Archips xylosteanus*, *Agrotis segetum*, *Tetramoera schistaceana*, *Papilio machaon hippocrates*, *Endoclyta sinensis*, *Lyonetia prunifoliella*, *Phyllonorycter ringoneella*, *Cydia kurokoi*, *Eucoenogenes aestuosa*, *Lobesia botrana*, *Latoia sinica*, *Euzophora batangensis*, *Phalonidia mesotypa*, *Spilosoma imparilis*, *Glyphodes pyloalis*, *Olethreutes mori*, *Tineola bisselliella*, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *Cydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Sesamia calamistis*, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*,

Phthorimaea operculella, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella cinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*,
Spodoptera mauritia, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*,
Angerona prunaria, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia includens*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*,
5 *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconsersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*,
Homona magnanima, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis*
pillariana, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus*
flavidorsalis, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pirivorella*, *Grapholita molesta*, *Spulerina astaurota*, *Ectomyelois*
pyrivorella, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga*
10 *cerealella*, *Spodoptera litura*, una especie de la familia Tortricidae (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*,
Scopelodes contractus, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca*
bipunctata, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia*
ambiguella, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*, *Lymantria dispar*, *Dendrolimus spectabilis*,
Leguminivora glycinivorella, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*,
15 *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, *Bambalina* sp., *Carposina niponensis*,
Conogethes punctiferalis, *Synanthedon* sp., *Lyonetia clerkei*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera*
flavescens, las especies de la familia Pieridae tales como *Pieris rapae crucivora* y *Pieris rapae*, *Euproctis similis*,
Acrolepiopsis suzukiella, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phtheochroides clandestina*,
Hoshinoa adumbratana, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita*
inopinata, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*,
20 *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha deroga*, *Diaphania indica*, *Heliothis*
virescens y *Earias cupreoviridis*;
las especies del orden Hemiptera tales *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*,
Trigonotylus coelestialium, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus*
ficus, *Aonidiella aurantii*, *Graptosaltria nigrofuscata*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*,
25 *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwasakii*, *Aspidiotus*
destructor, *Taylorilygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*,
Anacanthocoris striicornis, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*,
Rhopalosiphum rufiabdominalis, *Saissetia oleae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aguriahana quercus*, *Lygus* spp.,
Euceraphis punctipennis, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus*
30 *spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciatarina*, *Trioza*
camphorae, *Leptocorisa chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhlerites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*,
Duplaspidiotus claviger, *Nephotettix nigropictus*, *Halticellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*,
Anomomeura mori, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagons*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus*
lucorum, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geoica lucifuga*, *Numata muiri*,
35 *Comstockaspis pernicioso*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella*
spectra, *Aspidiotus hederiae*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigrifloralis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*,
Brevicoryne brassicae, *Aphis glycines*, *Leptocorisa oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroeucon formosanus*,
Cyrtopeltis tenuis, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca*
onukii, *Plautia stall*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pirioides*, *Ceroplastes ceriferus*,
40 *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparus*,
Rhopalosiphum maidis, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*,
Psylla tobirae, *Eurydema rugosum*, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*,
Dysmicoccus wistariae, *Lepholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*,
Rhopalosiphum nymphaeae, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*,
45 *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhlerites*
debile, *Laodelphax striatellus*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovina punctata*, *Empoasca* spp., *Coccus*
hesperidum, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles*
fascifrons, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocorisa acuta*,
Macropes obnubilus, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Aphrophora costalis*, *Lygus*
50 *disponsi*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*,
Megacopta punctatissimum, *Eysarcoris guttiger*, *Lepidosaphes beekii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*,
Planococcus citri, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginella citri*, *Pulvinaria*
citricola, *Coccus discrepans*, *Pseudaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema*
calcaratum, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus*
55 *helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinose yanagicola*, *Metasalis*
populi, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla*
mali, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonuguis mali*, *Orientalis ishidae*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma*
lanigerum, *Ceroplastes rubens* y *Aphis gossypii*;
las especies del orden Coleoptera tales como *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*,
60 *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia*
provosti, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*,
Acanthoscelides obtectus, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus*
pisorum, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tenebrosa*,
Phyllotreta striolata, *Psacotheta hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*,
65 *Oxyctetonia jucunda*, *Diabrotica* spp., *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus*
oryzae, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa*

- 5 *decemlineata*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*, *Conotrachelus nenuphar*, *Ceuthorrhynchidius albosuturalis*, *Phaedon brassicae*, *Lasioderma serricorne*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolor japonicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*, *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*, *Tribolium confusum*, *Medythia nigrobilineata*, *Xylotrechus pirrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*, *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *Anthonomus pomorum*, *Linnaeidea aenea* y *Anthonomus grandis*;
- 10 las especies del orden *Diptera* tales como *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Chlorops oryzae*, *Hydrellia sasakii*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhacochlaena japonica*, *Muscina stabulans*, las especies de la familia *Phoridae* tales como *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, *Asphondylia* sp., *Delia platura*, *Delia antiqua*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens Forskal*, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinensis*, *Culex quinquefasciatus*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromiza nigriventris*, *Anastrepha ludens* y *Rhagoletis pomonella*;
- 20 las especies del orden *Hymenoptera* tales como *Pristomyrmex pungens*, *Bethylid wasps*, *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, *Vespid wasps*, *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Arge mali* y *Ochetellus glaber*;
- 25 las especies del orden *Orthoptera* tales como *Homorocoryphus lineosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricate*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* y *Teleogryllus emma*;
- 30 las especies del orden *Thysanoptera* tales como *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticolothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floridensis*, *Thrips simplex*, *Thrips nigropilosus*, *Heliothrips haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*, *Microcephalothrips abdominalis*, *Leeuwenia pasanii*, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Frankliniella lilivora* y *Liothrips vaneeckei*;
- 35 las especies del orden *Acari* tales como *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, las especies de la familia *Ixodidae* tales como *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanensis*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvairum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*, *Sarcoptes scabiei*, *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moored*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides ptrebyssus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptruta citri*, *Aculus schlechtendali*, *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*, *Rhyzoglyphus robini* y *Sancassania* sp.;
- 40 las especies del orden *Isoptera* tales como *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes guanzhoensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* y *Reticulitermes speratus*;
- 45 las especies del orden *Blattodea* tales como *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* y *Periplaneta americana*;
- 50 las especies del orden *Siphonaptera* tales como *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* y *Ceratophyllus gallinae*;
- las especies del filo *Nematoda* tales como *Nothotylenchus acris*, *Aphelenchoides besseyi*, *Pratylenchus penetrans*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Globodera rostochiensis*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycinas*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* y *Tylenchus semipenetrans*; y
- las especies del filo *Mollusca* tales como *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* y *Acusta despecta sieboldiana*.

55 Además, el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención tiene un fuerte efecto insecticida sobre *Tuta absoluta* también.

Además, también se incluyen ácaros y garrapatas parásitos de animales en las plagas diana, y los ejemplos incluyen las especies de la familia *Ixodidae* tales como *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinosa*, *Dermacentor reticulatus* y *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; las especie del género *Ornithonyssus* tales como *Ornithonyssus sylvairum* y *Ornithonyssus bursa*; las especies de la familia *Trombiculidae* tales como *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* y *Helenicula miyagawai*; las especies de la familia *Cheyletidae* tales como *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* y *Cheyletiella blakei*; las especies de la superfamilia *Sarcoptoidea* tales como *Psoroptes*

cuniculi, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* y *Notoedres cati*; y las especies de la familia *Demodicidae* tales como *Demodex canis*.

- 5 Otras plagas diana incluyen pulgas, incluyendo insectos sin alas ectoparasitarios que pertenecen al orden *Siphonaptera*, más específicamente, las especies pertenecientes a las familias *Pulicidae* y *Ceratophyllidae*. Los ejemplos de las especies que pertenecen a la familia *Pulicidae* incluyen *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* y *Monopsyllus anisus*.
- 10 Otras plagas diana incluyen ectoparásitos, por ejemplo, las especies del suborden *Anoplura* tales como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* y *Pediculus capitis*; las especies del suborden *Mallophaga* tales como *Trichodectes canis*; y plagas de insectos dípteros hematófagos tales como *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* y *Simulium ornatum*.
- 15 Otras plagas diana incluyen endoparásitos, por ejemplo, los siguientes endoparásitos:
- del orden *Enoplida*, por ejemplo, *Trichuris* spp. (tricocéfalos), *Capillaria* spp. (gusanos del pelo), *Trichomosoides* spp., *Trichinella* spp. (lombrices intestinales), etc.;
- 20 del orden *Rhabditida*, por ejemplo, *Micronema* spp., *Strongyloides* spp., etc.;
- del orden *Strongylida*, por ejemplo, *Strongylus* spp. (estrongilos), *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *Cyclococercus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp. (gusanos nódulos), *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp. (*Stephanurus dentatus*), *Ancylostoma* spp. (*Ancylostoma duodenale*), *Uncinaria* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongylus* spp. (gusanos pulmonares), *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Neostrongylus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Angiostrongylus* spp. (*Angiostrongylus cantonensis*), *Aelurostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Trichostrongylus* spp. (tricostrongilos), *Haemonchus* spp. (*Haemonchus contortus*), *Ostertagia* spp., *Marshallagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp. (nematodos), *Hyostrongylus* spp., *Obeliscooides* spp., *Amidostomum* spp., *Ollulanus* spp., etc.;
- 25 del orden *Oxyurida*, por ejemplo, *Oxyuris* spp. (*Oxyuris equi*), *Enterobius* spp. (oxiuros), *Passalurus* spp., *Syphacia* spp., *Aspicularis* spp., *Heterakis* spp., etc.;
- del orden *Ascaridia*, por ejemplo, *Ascaris* spp. (ascáridos), *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp. (*Toxocara canis*), *Parascaris* spp. (*Parascaris equorum*), *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp., etc.; del orden *Spirurida*, por ejemplo, *Gnathostoma* spp., *Physaloptera* spp., *Thelazia* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Parabronema* spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp. (*Dracunculus medinensis*), etc.;
- 30 del orden *Filariida*, por ejemplo, *Stephanofilaria* spp., *Parafilaria* spp., *Setaria* spp., *Loa* spp., *Dirofilaria* spp. (*Dirofilaria immitis*), *Litomosoides* spp., *Brugia* spp., *Wuchereria* spp., *Onchocerca* spp., etc.; y
- del orden *Gigantorhynchida*, por ejemplo, *Filicollis* spp., *Moniliformis* spp., *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp., etc.

El agente de control de endoparásitos que comprende el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo como principio activo es eficaz no sólo contra parásitos que viven en el cuerpo de un huésped intermedio o final, sino también contra parásitos que viven en el cuerpo de un huésped reservorio. El compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención es eficaz en todas las etapas del desarrollo de los parásitos. Por ejemplo, en el caso de los protozoos, el compuesto es eficaz contra sus quistes, formas prequisticas y trofozoitos; esquizontes y formas ameboides en la etapa asexual; gametocitos, gametos y cigotos en la etapa sexual; esporozoitos; etc. En el caso de los nematodos, el compuesto es eficaz contra sus huevos, larvas y adultos. El compuesto de la presente invención es capaz no sólo de combatir parásitos en el cuerpo vivo, sino también incluso para prevenir la infección parasitaria mediante su aplicación al medio ambiente como vía de infección. Por ejemplo, infección transmitida por el suelo, es decir, infección del suelo de campos de cultivo y parques; infección percutánea por agua de ríos, lagos, embalses, arrozales, etc.; infección oral por heces de animales como perros y gatos; infección oral por peces de agua salada, pescado de agua dulce, crustáceos, marisco, carne cruda de animales domésticos, etc.; infección por mosquitos, tábanos, moscas, cucarachas, ácaros y garrapatas, pulgas, piojos, insectos asesinos, ácaros trombicúlidos, etc.; y similares, se puede evitar que ocurran.

Para el control de ectoparásitos o endoparásitos en mamíferos y aves domésticos usando el compuesto de la presente invención, se puede administrar una cantidad eficaz del compuesto de la presente invención con excipientes farmacéuticos mediante administración oral; administración parenteral como inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa o intraperitoneal); administración transdérmica tal como inmersión, pulverización, baño, lavado, vertido, manchado o espolvoreado; o administración transnasal. Para la administración del compuesto de la presente invención, productos moldeados que contienen el compuesto, tales como tiras, placas, bandas, collares, crotales, bandas para extremidades y dispositivos de etiquetas, también se pueden usar. El compuesto de la presente invención se puede formular en cualquier forma farmacéutica adecuada para la vía de administración seleccionada en la administración.

5 Ejemplos de la forma farmacéutica incluyen preparaciones sólidas, tales como polvos, gránulos, polvos humectables, bolitas, comprimidos, bolos, cápsulas y productos moldeados que contienen el compuesto activo; soluciones inyectables, soluciones orales y soluciones para uso en la piel o en cavidades corporales; preparaciones de la solución, tales como soluciones de vertido, soluciones de aplicación puntual, fluidos y emulsiones; y preparaciones semisólidas
 5 tales como ungüentos y geles. Las preparaciones sólidas se pueden usar principalmente para administración oral o para administración transdérmica después de dilución con agua, o para tratamiento ambiental.

10 Las preparaciones sólidas se pueden producir mezclando el compuesto activo y, si es necesario, un adyuvante, con una carga adecuada y luego darle a la mezcla la forma deseada. Ejemplos de carga apropiada incluyen sustancias inorgánicas tales como sales de carbonato, sales de carbonato de hidrógeno, sales de fosfato, óxido de aluminio, sílice y arcilla; y sustancias orgánicas tales como azúcar, celulosa, cereales molidos y almidón.

15 Las soluciones inyectables se pueden administrar por vía intravenosa, intramuscular o subcutánea. Las soluciones inyectables se pueden producir disolviendo el compuesto activo en un disolvente apropiado y, si es necesario, añadiendo excipientes como agentes solubilizantes, ácidos, bases, sales tampón, antioxidantes y agentes protectores de la solución. Ejemplos del disolvente apropiado incluyen agua, etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerina, propilenglicol, polietilenglicol, N-metilpirrolidona y una mezcla de los mismos, aceites vegetales fisiológicamente aceptables y aceites sintéticos aptos para inyección. Ejemplos del agente solubilizante incluyen polivinil pirrolidona, aceite de ricino polioxiethylado y éster de sorbitán polioxiethylado. Ejemplos del agente protector incluyen alcohol
 20 bencílico, triclorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

Las soluciones orales se pueden administrar directamente o después de su dilución. Las soluciones orales se pueden preparar como se ha descrito anteriormente para las soluciones inyectables.

25 Pueden utilizarse fluidos, emulsiones y similares, directamente o después de su dilución, para administración transdérmica o para tratamiento ambiental.

30 Las soluciones para uso sobre la piel se pueden administrar vertiendo, extendiendo, frotando, pulverizando, dispersando o sumergiendo (inmersión, baño o lavado) o aplicarse de otro modo. Estas soluciones se pueden preparar como se ha descrito anteriormente para las soluciones inyectables.

35 Las soluciones de vertido y las soluciones para aplicación puntual se gotean o pulverizan sobre una zona definida de la piel y, de este modo, se permite que el compuesto activo penetre a través de la piel y actúe sistémicamente. Las soluciones de vertido y las soluciones de aplicación puntual se pueden preparar disolviendo, suspendiendo o emulsionando el principio activo en un disolvente apropiado o una mezcla de disolventes adecuados para su uso en la piel. Si fuera necesario, un adyuvante tal como un tensioactivo, un colorante, un potenciador de la absorción, un antioxidante, un estabilizador de luz y/o un adhesivo pueden estar contenidos. Ejemplos del disolvente incluyen agua, alcohol, glicol, polietilenglicol, polipropilenglicol, glicerina, alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, dipropilenglicol monometil éter, dietilenglicol monobutil éter, acetona, metil etil
 40 cetona, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, parafina líquida, parafina líquida ligera, silicona, dimetilacetamida, N-metilpirrolidona y 2,2-dimetil-4-oxi-metilen-1,3-dioxolano. Ejemplos de potenciadores de la absorción incluyen dimetilsulfóxido (DMSO), miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceite de silicona, éster alifático, triglicérido y alcohol graso. Ejemplos de antioxidantes incluyen sales de sulfito, sales de metabisulfito, ácido ascórbico, hidroxitolueno butilado, hidroxianisol butilado y tocoferol.

45 Las emulsiones pueden administrarse mediante administración oral, administración transdérmica o inyección. Las emulsiones se pueden preparar disolviendo el principio activo en una fase hidrófoba o hidrófila y homogeneizando la solución con la otra fase disolvente con la adición de un emulsionante apropiado y, si es necesario, un adyuvante tal como un colorante, un potenciador de la absorción, un agente protector, un antioxidante, un agente protector de la luz
 50 y/o un espesante.

55 Ejemplos de la fase hidrófoba (aceite) incluyen aceite de parafina, aceite de silicona, aceite de sésamo, aceite de almendras, aceite de ricino; triglicéridos sintéticos; ésteres tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, pelargonato de dipropilenglicol, ésteres de ácidos grasos de cadena corta ramificada y ácidos grasos saturados C₁₆-C₁₈, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico o cáprico de alcoholes alifáticos saturados C₁₂-C₁₈, estearato de isopropilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, éster de ácido graso ceroso, ftalato de dibutilo y adipato de diisopropilo; y alcoholes tales como alcohol isotridecílico, 2-ocildodecanol, alcohol cetilestearílico y alcohol oleílico.

60 Ejemplos de la fase hidrófila incluyen agua, propilenglicol, glicerina y sorbitol.

65 Ejemplos de emulsionantes incluyen tensioactivos no iónicos tales como aceite de ricino polioxiethylado, monoolefinato de sorbitán polioxiethylado, monoestearato de sorbitán, monoestearato de glicerilo, estearato de polioxiethylato y éter de alquilfenol poliglicol; tensioactivos anfóteros tales como N-lauril β-iminodipropionato de sodio y lecitina; tensioactivos aniónicos, tales como laurilsulfato de sodio, sulfato de éter de alcohol graso y sales de monoetanolamina de éster de ácido ortofosfórico de mono-/di-alquilpoliglicol; y tensioactivos catiónicos tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

Otros adyuvantes incluyen carboximetilcelulosa, metilcelulosa, poliacrilato, alginato, gelatina, goma arábica, polivinil pirrolidona, alcohol polivinílico, éter metilvinílico, copolímeros de anhídrido maleico, polietilenglicol, ceras y sílice coloidal.

5 Las preparaciones semisólidas se pueden administrar aplicándolas o extendiéndolas sobre la piel o introduciéndolas en cavidades corporales. Los geles se pueden preparar preparando una solución como se ha descrito anteriormente para las soluciones inyectables y añadiendo, a la solución, un espesante en cantidad suficiente para dar una sustancia clara, untuosa y viscosa.

10 En el caso en el que el agente de control de endoparásitos de la presente invención se use como producto farmacéutico para animales de especies de mamíferos o aves no humanas, la cantidad óptima (cantidad efectiva) del principio activo varía según el propósito (tratamiento o prevención), el tipo de parásito infeccioso, el tipo y la gravedad de la infección, la forma farmacéutica, etc., pero, en general, la dosis diaria oral está en el intervalo de aproximadamente 0,0001 a 15 10.000 mg/kg de peso corporal y la dosis diaria parenteral está en el intervalo de aproximadamente 0,0001 a 10.000 mg/kg de peso corporal. Esta dosis se puede administrar como dosis única o en dosis divididas.

20 La concentración del principio activo en el agente de control de endoparásitos de la presente invención es generalmente de aproximadamente 0,001 a 100 % en masa, preferentemente aproximadamente del 0,001 al 99 % en masa, y más preferentemente aproximadamente del 0,005 al 20 % en masa. El agente de control de endoparásitos de la presente invención puede ser una composición que se puede administrar directamente o una composición altamente concentrada que es necesario diluir hasta una concentración adecuada antes de su uso.

25 El agente de control de endoparásitos de la presente invención se puede utilizar en combinación con cualquier agente de control de endoparásitos existente con el fin de reforzar o complementar su efecto. En tal uso combinado, se pueden mezclar y formular dos o más principios activos en una única preparación antes de la administración, o se pueden administrar dos o más preparaciones diferentes por separado.

30 El insecticida agrícola u hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo en forma de principio activo tiene un notable efecto de control sobre las plagas anteriormente descritas que dañan los cultivos de llanura, cultivos de campo, árboles frutales, verduras, otros cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. Se puede obtener el efecto deseado cuando el insecticida agrícola u hortícola se aplica a los viveros para plántulas, arrozales, campos, árboles frutales, verduras, otros cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. y sus semillas, agua de arrozal, follaje, medios de cultivo tales como el suelo o similares, alrededor del momento esperado de infestación por plagas, es decir, antes de la infestación o tras la confirmación de la infestación. En realizaciones particularmente preferibles, la aplicación del insecticida agrícola u hortícola utiliza la denominada penetración y translocación. Esto es, el suelo de vivero, suelo en hoyos de trasplante, pie de planta, agua de riego, agua de cultivo en cultivos hidropónicos, o similares, se trata con el insecticida agrícola u hortícola para permitir que los cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. absorban el compuesto de la presente invención por las raíces a través del suelo o de otro modo.

45 Ejemplos de plantas útiles a las cuales se puede aplicar el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención incluyen, aunque sin limitación particular, cereales (p.ej., arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, etc.), legumbres (p. ej., soja, judía adzuki, habas, guisante verde, alubias rojas, cacahuetes, etc.), árboles frutales y frutas (p. ej., manzanas, frutas cítricas, peras, uvas, melocotones, ciruelas, cerezas, nueces, castañas, almendras, plátanos, etc.), verduras de hojas y frutas (p. ej., repollos, tomates, espinaca, brócoli, lechuga, cebollas, cebollas verdes (cebollino, cebolletas, etc.), pimientos verdes, berenjenas, fresas, cultivos de pimientos, quingombó, *Allium tuberosum*, etc.), verduras de raíz (p. ej., zanahorias, patatas, batatas, colocasias, rábanos japoneses, nabos, raíces de loto, raíces de bardana, ajo, cebolletas chinas, etc.), cultivos para procesamiento (p. ej., algodón, cáñamo, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha azucarera, aceitunas, caucho, café, tabaco, té, etc.), calabazas (p. ej., calabazas japonesas, pepinos, sandías, melones dulces orientales, melones, etc.), pasto (p. ej., dátilo, sorgo, fleo, trébol, alfalfa, etc.), césped (p. ej., césped coreano, agrostis, etc.), cultivos de especias y aromáticos y cultivos ornamentales (p. ej., lavanda, romero, tomillo, perejil, pimiento, jengibre, etc.), plantas ornamentales con flores (p. ej., crisantemo, rosa, clavel, orquídea, tulipán, lirio, etc.), árboles de jardín (p. ej., ginkgos, cerezos, laurel moteado, etc.) y árboles forestales (p. ej., *Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, pino, enebro amarillo, cedro japonés, falso ciprés japonés hinoki, eucalipto, etc.).

60 Las "plantas" mencionadas anteriormente también incluyen plantas provistas de tolerancia a herbicidas mediante una técnica de mejora clásica o una técnica de recombinación genética. Los ejemplos de dicha tolerancia a herbicidas incluyen tolerancia a inhibidores de HPPD, tales como isoxaflutol; inhibidores de ALS, tales como imazetapir y tifensulfuron-metilo; inhibidores de la EPSP sintasa, tales como glifosato; inhibidores de la glutamina sintetasa, tales como glufosinato; inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, tales como setoxidim; u otros herbicidas, tales como bromoxinilo, dicamba y 2,4-D.

65 Los ejemplos de las plantas provistas de tolerancia a herbicidas mediante una técnica de mejora clásica incluyen variedades de colza, trigo, girasol y arroz tolerantes a la familia de imidazolinona de herbicidas inhibidores de ALS

tales como imazetapir y dichas plantas se venden con el nombre comercial de Clearfield (marca registrada). También se incluye una variedad de soja provista de tolerancia a la familia de las sulfonilureas de herbicidas inhibidores de ALS tales como el tifensulfuron-metilo mediante una técnica de mejora clásica y se vende con el nombre comercial de soja STS. También se incluyen plantas provistas de tolerancia a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa tales como herbicidas de triona oxima y herbicidas de ácido ariloxi fenoxipropiónico mediante una técnica de mejora clásica, por ejemplo, maíz SR y similares.

Las plantas provistas de tolerancia a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa se describen en Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990) y similares. Además, se informa de mutantes de acetil-CoA carboxilasa resistentes a los inhibidores de acetil-CoA carboxilasa en Weed Science, 53, 728-746 (2005), y similares, e introduciendo el gen de dicho mutante de acetil-CoA carboxilasa en plantas mediante una técnica de recombinación génica o introduciendo una mutación que confiere resistencia en acetil-CoA carboxilasa de plantas, pueden obtenerse por ingeniería genética plantas tolerantes a inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa. De forma alternativa, mediante la introducción de un ácido nucleico que provoca una mutación de sustitución de bases en células vegetales (un ejemplo típico de esta técnica es la técnica de quimeroplastia (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318.)) para permitir la mutación de sustitución específica del sitio en los aminoácidos codificados por un gen de acetil-CoA carboxilasa, un gen de ALS o similar de plantas, plantas tolerantes a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, Se pueden diseñar inhibidores de ALS o similares. El insecticida agrícola u hortícola de la presente invención se puede aplicar también a estas plantas.

Además, las toxinas ilustrativas expresadas en plantas modificadas genéticamente incluyen proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; δ -endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, tal como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 y Cry9C, y otras proteínas insecticidas, tal como VIP1, VIP2, VIP3 y VIP3A; proteínas insecticidas de nematodos; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arañas, toxinas de abejas y neurotoxinas específicas de insectos; toxinas de hongos filamentosos; lectinas vegetales; aglutinina; inhibidores de proteasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, inhibidores de cistatina y papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina y briodina; enzimas metabolizadoras de esteroides, tales como la 3-hidroxi esteroide oxidasa, ecdisteroide-UDP-glucosiltransferasa y colesterol oxidasa; inhibidores de ecdisona; HMG-CoA reductasa; inhibidores de canales de iones, tales como inhibidores de los canales de sodio e inhibidores de los canales de calcio; hormona esterasa juvenil; receptores de la hormona diurética; estilbena sintasa; bibencil sintasa; quitinasa; y glucanasa.

También se incluyen toxinas híbridas, toxinas parcialmente deficientes y toxinas modificadas procedentes de lo siguiente: proteínas δ -endotoxinas tales como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab y Cry35Ab, y otras proteínas insecticidas tales como VIP1, VIP2, VIP3 y VIP3A. La toxina híbrida se puede producir combinando algunos dominios de estas proteínas de forma diferente a la combinación original en la naturaleza con el uso de una técnica de recombinación. Como toxina parcialmente deficiente, se conoce una toxina Cry1Ab en la que se elimina una parte de la secuencia de aminoácidos. En la toxina modificada, se sustituyen uno o más aminoácidos de una toxina de origen natural.

Se describen ejemplos de las toxinas anteriores y de plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar estas toxinas en los documentos EP0374753A, WO93/07278, WO95/34656, EP0427529A, EP451878A, WO03/052073, etc.

Debido a las toxinas contenidas en tales plantas modificadas genéticamente, las plantas presentan resistencia a plagas, en particular, plagas de insectos coleópteros, plagas de insectos hemípteros, plagas de insectos dípteros, plagas de insectos lepidópteros y nematodos. Las tecnologías anteriormente descritas y el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención se pueden usar en combinación o usar de forma sistemática.

Para controlar las plagas diana, el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención, con o sin dilución o suspensión adecuada en agua, etc., se aplica a plantas potencialmente infestadas con las plagas de insectos o nematodos diana en una cantidad eficaz para el control de las plagas de insectos o nematodos. Por ejemplo, para combatir plagas de insectos y nematodos que pueden dañar plantas de cultivo tales como árboles frutales, cereales y verduras, pueden realizarse aplicaciones foliares y tratamientos de semillas tales como inmersión, revestimiento con polvo y revestimiento con peróxido de calcio. Además, también se puede realizar un tratamiento del suelo o similar para permitir que las plantas absorban productos agroquímicos a través de sus raíces. Los ejemplos de dicho tratamiento incluyen la incorporación a suelo completo, tratamiento de hileras de siembra, incorporación en el suelo del semillero, tratamiento de plántulas en tapón, tratamiento del hoyo de plantación, tratamiento del pie de la planta, aplicación de cobertura, tratamiento de cajas de vivero para arroz con cáscara y aplicación sumergida. Además, la aplicación a medios de cultivo en cultivos hidropónicos, tratamiento de ahumado, inyección en el tronco, y similares, también se pueden realizar.

Además, el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención, con o sin dilución o suspensión adecuada en agua, etc., se puede aplicar a sitios potencialmente infestados de plagas en una cantidad eficaz para el control de las plagas. Por ejemplo, se puede aplicar directamente a las plagas de granos almacenados, plagas domésticas, plagas sanitarias, plagas forestales, etc., y también se puede usar para el revestimiento de materiales de construcción

residencial, para el tratamiento con humo o como una formulación de cebo.

5 Los métodos ilustrativos de tratamiento de semillas incluyen sumergir las semillas en un líquido diluido o sin diluir de una formulación líquida o sólida para la penetración de productos agroquímicos en las semillas; mezcla o revestimiento en polvo de semillas con una formulación sólida o líquida para la adherencia de la formulación a las superficies de las semillas; revestimiento de semillas con una mezcla de una formulación sólida o líquida y un vehículo adhesivo tal como resinas y polímeros; y aplicación de una formulación sólida o líquida en las proximidades de las semillas al mismo tiempo que la siembra.

10 El término "semilla" en el tratamiento de semillas mencionado anteriormente se refiere a un cuerpo vegetal que se encuentra en las primeras etapas de cultivo y se usa para la propagación de plantas. Los ejemplos incluyen, además de la llamada semilla, un cuerpo vegetal para la propagación vegetativa, tal como un bulbo, un tubérculo, una patata de siembra, un bulbillo, un propágulo, un tallo discoide y un tallo usado para propagación por esquejes.

15 El término "suelo" o "medio de cultivo" en el método de la presente invención para usar un insecticida agrícola u hortícola se refiere a un medio de soporte para el cultivo de cosechas, en particular, un medio de soporte que permita que las plantas de cultivo extiendan sus raíces en el mismo, y los materiales no están particularmente limitados siempre que permitan que las plantas crezcan. Los ejemplos del medio de soporte incluyen lo que se denomina suelos, esteras de plántulas y agua, y los ejemplos específicos de los materiales incluyen arena, piedra pómez, vermiculita, diatomita, agar, sustancias gelatinosas, sustancias de alto peso molecular, lana de roca, lana de vidrio, virutas y corteza de madera.

25 Los métodos ilustrativos de aplicación al follaje de cultivos o a plagas de granos almacenados, plagas domésticas, plagas sanitarias, plagas forestales, etc. incluyen la aplicación de una formulación líquida, tal como un concentrado emulsionable y una formulación fluida o sólida, tal como un polvo humectable y un gránulo dispersable en agua, después de una dilución adecuada en agua; aplicación en polvo; y humo.

30 Los métodos ilustrativos de aplicación al suelo incluyen la aplicación de una formulación líquida diluida en agua o sin diluir al pie de las plantas, semilleros de viveros para plántulas o similares; aplicación de un gránulo al pie de las plantas, semilleros de viveros para plántulas o similares; aplicación de un polvo, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar en el suelo y la posterior incorporación de la formulación en todo el suelo antes de sembrar o trasplantar; y aplicación de un polvo, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar a hoyos de siembra, hileras de siembra o similares antes de sembrar o plantar.

35 A cajas de vivero para arroz con cáscara, por ejemplo, un polvo fino, un gránulo dispersable en agua, un gránulo, o similares, se les puede aplicar, aunque la formulación adecuada puede variar según el momento de aplicación, en otras palabras, según la etapa de cultivo, tal como el tiempo de siembra, periodo de reverdecimiento y tiempo de siembra. Una formulación tal como polvo, un gránulo dispersable en agua y un gránulo se pueden mezclar con suelo de vivero. Por ejemplo, dicha formulación se incorpora al suelo del semillero, cubriendo el suelo o a todo el suelo.

40 Simplemente, se pueden colocar alternativamente en capas suelo de vivero y tal formulación.

45 En la aplicación a los arrozales, una formulación sólida, tal como un jumbo, una compresa, un gránulo y un gránulo dispersable en agua, o una formulación líquida, tal como un concentrado fluido y uno emulsionable, se aplica habitualmente a arrozales inundados. En un periodo de siembra de arroz, una formulación adecuada, tal cual o después de mezclar con un fertilizante, puede aplicarse al suelo o inyectarse en el suelo. Además, un concentrado emulsionable, un fluido o similar se puede aplicar a la fuente de suministro de agua para los arrozales, tal como una entrada de agua y un dispositivo de riego. En este caso, el tratamiento se puede lograr con el suministro de agua y, por lo tanto, se puede lograr de una manera que ahorre trabajo.

50 En el caso de cultivos de campo, sus semillas, los medios de cultivo en las proximidades de sus plantas, o similares, pueden tratarse con el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención en el período desde la siembra hasta el cultivo de las plántulas. En el caso de plantas cuyas semillas se siembran directamente en el campo, además del tratamiento directo de semillas, es preferible el tratamiento del pie de las plantas durante el cultivo. Específicamente, el tratamiento puede realizarse, por ejemplo, aplicando un gránulo sobre el suelo o empapando el suelo con una

55 formulación en forma líquida diluida en agua o sin diluir. Otro tratamiento preferible es la incorporación de un gránulo al medio de cultivo antes de la siembra.

60 En el caso de plantas de cultivo para trasplantar, los ejemplos preferibles del tratamiento en el periodo de cultivo de siembra a plántulas incluyen, además del tratamiento directo de semillas, tratamiento por empapamiento de semilleros de vivero para plántulas con una formulación en forma líquida; y aplicación de gránulos a semilleros de vivero para plántulas. También se incluyen el tratamiento de hoyos de siembra con un gránulo; y la incorporación de un gránulo al medio de cultivo en las proximidades de los puntos de siembra en el momento de la plantación fija.

65 El insecticida agrícola u hortícola de la presente invención se usa normalmente en forma de una formulación conveniente para su aplicación, la cual se prepara según el método habitual de preparación de formulaciones agroquímicas.

5 Esto es, el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo y un vehículo inactivo apropiado y, si se necesita, un adyuvante, se combinan en una proporción apropiada y mediante la etapa de disolución, separación, suspensión, mezclado, impregnación, adsorción y/o adhesión, se formulan en una forma apropiada para aplicación, tal como un concentrado en suspensión, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo, un polvo fino, y comprimido y un paquete.

10 La composición (insecticida agrícola u hortícola o agente de control parasitario animal) de la presente invención opcionalmente puede contener un aditivo usado para formulaciones agroquímicas o agentes de control parasitario animal junto con el principio activo. Los ejemplos de aditivos incluyen vehículos tales como vehículos sólidos o líquidos, tensioactivos, dispersantes, agentes humectantes, aglutinantes, adherentes, espesantes, colorantes, esparcidores, agentes de adhesión/esparcidores, agentes anticongelantes, agentes antiaglomerantes, agentes disgregantes y estabilizantes. Si se necesitara, conservantes, fragmentos de plantas, etc. también se pueden utilizar como aditivo. Se puede usar uno de estos aditivos solo y también se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

20 Los ejemplos de vehículos sólidos incluyen minerales naturales, tales como cuarzo, arcilla, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita y diatomita; sales inorgánicas, tales como carbonato cálcico, sulfato de amonio, sulfato de sodio y cloruro de potasio; vehículos sólidos orgánicos, tales como ácido silícico sintético, silicatos sintéticos, almidón, celulosa y polvos vegetales (por ejemplo, serrín, cáscara de coco, mazorca de maíz, tallo del tabaco, etc.); vehículos plásticos, tal como polietileno, polipropileno y cloruro de polivinilideno; urea; materiales inorgánicos huecos; materiales plásticos huecos; y sílice pirógena (carbón blanco). Se puede usar uno de estos vehículos sólidos solo y también se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

25 Los ejemplos de vehículos líquidos incluyen alcoholes, incluyendo alcoholes monohídricos, tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol y butanol y alcoholes polihídricos, tales como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol, hexilenglicol, polietilenglicol, polipropilenglicol y glicerina; compuestos de poliol, tales como éter de propilenglicol; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona y ciclohexanona; éteres, tales como éter etílico, dioxano, monoetiléter de etilenglicol, dipropil éter y tetrahidrofurano; hidrocarburos alifáticos, tales como parafina normal, nafteno, isoparafina, queroseno y aceite mineral; hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, nafta disolvente y alquil naftaleno; hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano, cloroformo y tetracloruro de carbono; ésteres, tales como acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo y adipato de dimetilo; lactonas, tales como γ -butirolactona; amidas, tales como dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida y N-alquil pirrolidinona; nitrilos, tales como acetonitrilo; compuestos de azufre, tales como dimetilsulfóxido; aceites vegetales, tales como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón y aceite de ricino; y agua. Se puede usar uno de estos vehículos líquidos solo y también se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

40 Los ejemplos de tensioactivos usados como dispersante o agente humectante/esparcidos incluyen tensioactivos no iónicos, tales como éster de ácido graso de sorbitano, éster de ácido graso de polioxietileno sorbitano, éster de ácido graso de sacarosa, éster de ácido graso de polioxietileno, éster de ácido de resina de polioxietileno, diéster de ácido graso de polioxietileno, alquil éter de polioxietileno, alquil aril éter de polioxietileno, alquil fenil éter de polioxietileno, dialquil fenil éter de polioxietileno, condensados de formaldehído-alquil fenil éter de polioxietileno, copolímeros en bloque de polioxietileno-polioxipropileno, polímeros en bloque de poliestireno-polioxietileno, alquil éter de copolímero en bloque de polioxietileno-polipropileno, alquilamina de polioxietileno, amida de ácido graso de polioxietileno, bis (fenil éter) de ácido graso de polioxietileno, bencil fenil éter de polialquileno, estiril fenil éter de polioxialquileno, acetilen diol, acetilen diol con polioxialquileno añadido, silicona de tipo polioxietileno éter, silicona de tipo éster, fluorotensioactivos, aceite de ricino de polioxietileno y aceite de ricino hidrogenado de polioxietileno; tensioactivos aniónicos, tales como alquil sulfatos, alquil éter sulfatos de polioxietileno, alquil fenil éter sulfatos de polioxietileno, estiril fenil éter sulfatos de polioxietileno, alquilbencen sulfonatos, alquilaril sulfonatos, lignosulfonatos, alquil sulfosuccinatos, naftalen sulfonatos, alquilnaftalen sulfonatos, sales de condensados de ácido naftalenosulfónico-formaldehído, sales de condensados de ácido alquilnaftalenosulfónico-formaldehído, sales de ácidos grasos, sales de ácido policarboxílico, poliácridatos, sarcosinatos de ácido N-metil-graso, resinatos, fosfatos de polioxietileno alquil éter y fosfatos de polioxietileno alquil fenil éter; tensioactivos catiónicos que incluyen sales de alquil amina, tales como clorhidrato de lauril amina, clorhidrato de estearil amina, clorhidrato de oleil amina, acetato de estearil amina, acetato de estearil aminopropil amina, cloruro de alquiltrimetilamonio y cloruro de alquildimetilbenzalconio; y tensioactivos anfóteros, tales como tensioactivos anfotéricos de tipo aminoácido o de tipo betaína. Se puede usar uno de estos tensioactivos solo y también se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

60 Los ejemplos de aglutinantes o de adherentes incluyen carboximetilcelulosa o sales de la misma, dextrina, almidón soluble, goma xantana, goma guar, sacarosa, polivinil pirrolidona, goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, poliácridato de sodio, polietilenglicoles con un peso molecular medio de 6.000 a 20.000, óxidos de polietileno con un peso molecular medio de 100.000 a 5.000.000, fosfolípidos (por ejemplo, cefalina, lecitina, etc.), polvo de celulosa, dextrina, almidón modificado, compuestos quelantes de ácido poliaminocarboxílico, polivinilpirrolidona reticulada, copolímeros de ácido maleico-estireno, copolímeros de ácido (met)acrílico, semiésteres de polímero de alcohol polihídrico y anhídrido dicarboxílico, poliestireno sulfonatos solubles en agua, parafina, terpeno, resinas de

poliamida, poliácridatos, polioxiétileno, ceras, polivinil alquil éter, condensados de alquilfenol-formaldehído y emulsiones de resinas sintéticas.

5 Los ejemplos de espesantes incluyen polímeros solubles en agua, tales como goma xantana, goma guar, goma diutano, carboximetilcelulosa, polivinil pirrolidona, polímeros de carboxivinilo, polímeros acrílicos, compuestos de almidón y polisacáridos; y polvos finos inorgánicos, tales como bentonita de alta calidad y sílice pirógena (carbón blanco).

10 Los ejemplos de los colorantes incluyen pigmentos inorgánicos, tales como óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia; y tintes orgánicos, tales como tintes de alizarina, tintes azo y tintes de ftalocianina metálica.

Los ejemplos de agentes anticongelantes incluyen alcoholes polihídricos, tales como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol y glicerina.

15 Los ejemplos de los adyuvantes que sirven para evitar el apelmazamiento o facilitar la disgregación incluyen polisacáridos (almidón, ácido algínico, manosa, galactosa, etc.), polivinil pirrolidona, sílice pirógena (carbón blanco), goma de éster, resina de petróleo, tripolifosfato de sodio, hexametáfosfato de sodio, estearatos metálicos, polvo de celulosa, dextrina, copolímeros de metacrilato, polivinil pirrolidona, compuestos quelantes de ácido poliaminocarboxílico, copolímeros de anhídrido estiren-isobutilen-maleico sulfonados y copolímeros de injerto de almidón-poliacrilonitrilo.

20 Los ejemplos de los agentes estabilizantes incluyen desecantes, tales como zeolita, cal viva y óxido de magnesio; antioxidantes, tales como compuestos fenólicos, compuestos de amina, compuestos de azufre y compuestos de ácido fosfórico; y absorbedores de ultravioleta, tales como compuestos de ácido salicílico y compuestos de benzofenona.

25 Los ejemplos de los conservantes incluyen sorbato de potasio y 1,2-benzotiazolin-3-ona.

30 Además, otros adyuvantes que incluyen agentes dispersantes funcionales, potenciadores de la actividad tales como inhibidores metabólicos (butóxido de piperonilo, etc.), agentes anticongelantes (propilenglicol, etc.), antioxidantes (BHT, etc.) y absorbentes ultravioleta se pueden usar también si se necesitan.

35 La cantidad del compuesto del principio activo en el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención se puede ajustar si fuera necesario y, básicamente, la cantidad de compuesto del principio activo se selecciona de forma apropiada dentro del intervalo de 0,01 a 90 partes en peso en 100 partes en peso del insecticida agrícola u hortícola. Por ejemplo, en el caso en el que el insecticida agrícola u hortícola es un polvo, un gránulo, un concentrado emulsionable o un polvo humectable, es adecuado que la cantidad del compuesto del principio activo sea de 0,01 a 50 partes en peso (0,01 a 50 % en peso con respecto al peso total del insecticida agrícola u hortícola).

40 La velocidad de aplicación del insecticida agrícola u hortícola de la presente invención puede variar debido a diversos factores, por ejemplo, el fin, la plaga diana, las condiciones de crecimiento de los cultivos, la tendencia a la infestación por plagas, el clima, las condiciones ambientales, la forma farmacéutica, el método de aplicación, el sitio de aplicación, la esterificación de la aplicación, etc., pero básicamente, la velocidad de aplicación del compuesto del principio activo se selecciona de manera apropiada del intervalo de 0,001 g a 10 kg y, preferentemente, de 0,01 g a 1 kg por 10 áreas, dependiendo del propósito.

45 Adicionalmente, para la expansión de la variedad de plagas diana y el tiempo apropiado para el control de la plaga o para la reducción de la dosis, el insecticida agrícola u hortícola de la presente invención se puede usar después de mezclar con otros insecticidas agrícolas u hortícolas, acaricidas, nematocidas, microbicidas, parasiticidas y/o similares. Además, el insecticida agrícola u hortícola se puede usar después de mezclarlo con herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fertilizantes y/o similares, dependiendo de la situación.

50 Ejemplos de tales otros insecticidas agrícolas u hortícolas, acaricidas y nematocidas usados para los fines mencionados anteriormente incluyen metilcarbamato de 3,5-xililo (XMC), toxinas proteicas cristalinas producidas por *Bacillus thuringiensis* tal como *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* y *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, compuestos insecticidas derivados de la toxina Bt, CPCBS (clorfenson), DCIP (éter diclorodiisopropílico), D-D (1,3-dicloropropeno), DDT, NAC, O-4-dimetilsulfamoilfenil O,O-dietil fosforotioato (DSP), O-etil O-4-nitrofenil fenilfosfonotioato (EPN), tripropilisocianurato (TPIC), acrinatrina, azadiractina, azinfós-metilo, acequinocilo, acetamiprid, acetoprol, acefato, abamectina, avermectina-B, amidoflumet, amitraz, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aldrina, alfa-endosulfán, alfa-cipermetrina, albendazol, aletrina, isazofós, isamidofós, isoamidofós isoxatión, isofenfós, isoprocarb (MIPC), ivermectina, imiciafós, imidacloprid, imiprotrina, indoxacarb, esfenvalerato, etiofencarb, etión, etiprol, etoxazol, etofenprox, etoprofós, etrimfós, emamectina, benzoato de emamectina, endosulfán, empentrina, oxamilo, oxidemetón-metilo, oxideprofós (ESP), oxibendazol, oxfendazol, oleato de potasio, oleato de sodio, cadusafós, cartap, carbarilo, carbosulfano, carbofurano, gamma-cihalotrina, xilicarb, quinalfós, kinopreno, cinometionat, cloetocarb, clotianidina, clofentezina, cromafenoazida, clorantraniliprol, cloretoxifós, clordimeform, clordano, clorpirifós, clorpirifós-metilo, clorfenapir, clorfensón, clorfenvinfós, clorfluzazurón, clorobencilato, clorobenzoato, kelthane (dicofol), salitión, cianofós

(CYAP), diafentiurón, diamidafós, ciantranilprol, theta-cipermetrina, dienocloro, cienopirafeno, dioxabenzofós, diofenolán, sigma-cipermetrina, diclofentión (ECP), cicloprotrina, diclorvos (DDVP), disulfotón, dinotefurano, cihalotrina, cifenotrina, ciflutrina, diflubenzurón, ciflumetofeno, diflovidazina, cihexatina, cipermetrina, dimetilvinfós, dimetoato, dimeflutrina, silafluofeno, ciromazina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espirotetramat, 5 espiromesifeno, sulfluramida, sulprofós, sulfoxaflor, zeta-cipermetrina, diacinón, tau-fluvalinato, dazomet, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiociclam, tiosultap, tiosultap-sodio, tionazina, tiometón, deet, dieldrina, tetraclorvinfós, tetradifón, tetrametilflutrina, tetrametrina, tebupirimfós, tebufenozida, tebufenpirad, teflutrina, teflubenzurón, demetón-S-metilo, temefós, deltametrina, terbufós, tralazirilo, tralometrina, transflutrina, triazamato, fluvalinato, flupirazofós, tricloflorón (DEP), triflumurón, tolfenpirad, naled (BRP), nitiazina, nitenpiram, novalurón, noviflumurón, hidropreno, 10 vanilprol, vamidotión, paratión, paratión-metilo, halfenprox, halofenozida, bistriflurón, bisultap, hidrametilnona, almidón de hidroxipropilo, binapacril, bifenazato, bifentrina, pimetrocina, piraclorós, pirafluprol, piridafentión, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazón, piriprol, piriproxifeno, pirimicarb, pirimidifeno, pirimifós-metilo, piretrinas, fipronil, fenazaquina, fenamifós, bromopropilato, fenitrotión (MEP), fenoxicarb, fenotiocarb, fenotrina, fenobucarb, fensulfotión, fentión (MPP), fentoato (PAP), fenvalerato, fenpiroximato, fenpropatrina, fenbendazol, fostiazato, butatofós, buprofezina, furatiocarb, praletrina, flucacipirim, fluzinam, flazuril, flusulfona, fluciclorurón, flucitrinato, fluvalinato, flurimfeno, flufenerim, flufenoxurón, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, flubrocitrinato, flubendiamida, flumetrina, flurimfeno, protiofós, protrifenbuto, flonicamid, propafós, propargita (BPPS), profenofós, proflutrina, propoxur (PHC), bromopropilato, beta-ciflutrina, hexaflumurón, hexitiazox, heptenofós, permetrina, bencloflor, bendiocarb, bensultap, benzoximato, benfuracarb, foxim, fosadona, fostiazato, fostietano, fosfamidón, fosfocarb, fosmet (PMP), polinactinas, 20 formetanato, formotión, forato, aceite para máquinas, malatión, milbemicina, milbemicina-A, milbemectina, mecarbam, mesulfenfós, metomilo, metaldehído, metaflumizona, metamidofós, metam-amonio, metam-sodio, metiocarb, metidatión (DMTP), metilisotiocianato, metilneodecanamida, metilparatión, metoxadiazona, metoxicloro, metoxifenozida, metoflutrina, metopreno, metolcarb, meperflutrina, mevinfós, monocrotofós, monosultap, lambda-cihalotrina, rianodina, lufenurón, resmetrina, lepimectina, rotenona, clorhidrato de levamisol, óxido de fenbutatina, tartarato de morantel, bromuro de metilo, hidróxido de triciclohexilestaño (cihexatina), cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, azufre y nicotina-sulfato.

Los microbicidas agrícolas u hortícolas a modo de ejemplo usados para los mismos propósitos que los anteriores incluyen aureofungina, azaconazol, azitiram, acipetacs, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, azoxiestrobina, anilacina, 30 amisulbrom, ampropilfós, ametrotradina, alcohol alílico, aldimorf, amobam, isotianilo, isovalediona, isopirazam, isoprotilano, ipconazol, iprodiona, iprovalicarb, iprobenfós, imazalil, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, eclomezol, edifenfós, etaconazol, etaboxam, etirimol, etem, etoxiquina, etridiazol, enestroburina, epoxiconazol, oxadixilo, oxicarboxina, quinolinolato de cobre-8, oxitetraciclina, oxinato de cobre, oxpoconazol, fumarato de oxpoconazol, ácido oxolínico, octilnona, ofurace, 35 orisastrobina, metam-sodio, kasugamicina, carbamorf, carpropamid, carbendazim, carboxina, carvona, quinazamida, quinaacetol, quinoxifeno, quinometionato, captafol, captán, kiralaxilo, quinconazol, quintoceno, guazatina, cufraneb, cuprobam, gliodina, griseofulvina, climbazol, cresol, kresoxim-metilo, clozolinato, clotrimazol, clobentiazona, cloraniformetano, cloranilo, clorquinox, cloropicrina, clorfenazol, clorodinitronaftaleno, clorotalonilo, cloroneb, zarilamida, salicilanilida, ciazofamid, pirocarbonato de dietilo, dietofencarb, ciclafuramida, diclocimet, diclozolina, 40 diclobutrazol, diclofluanida, cicloheximida, diclomezina, diclorán, diclorofeno, diclona, disulfiram, ditalimfós, ditianona, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinoción, dinosulfón, dinoterbón, dinobutón, dinopentón, dipiritiona, difenilamina, difenoconazol, ciflufenamid, diflumentorim, ciproconazol, ciprodinilo, ciprofuram, cipendazol, simeconazol, dimetirimol, dimetormorf, cimoxanilo, dimoxistrobina, bromuro de metilo, ziram, siltiofam, estreptomina, espiroxamina, sultropeno, sedaxano, zoxamida, dazomet, tiadiazina, tiadinil, tiadifluor, tiabendazol, tioximida, tioclorfenfim, tiofanato, 45 tiofanato-metilo, ticiofeno, tioquinox, cinometionat, tifulzamida, tiram, decafentina, tecnazeno, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, ácido deshidroacético, tebuconazol, tebufloquina, dodicina, dodina, dodecil bencensulfonato bis-etilendiamina de cobre (II) (DBEDC), dodemorf, drazoxolona, triadimenol, triadimefón, triazbutil, triazóxido, triamifós, triarimol, triclamida, triciclazol, triticonazol, tridemorf, óxido de tributiltina, triflumizol, trifloxistrobina, triforina, toliifluanida, tolclofós-metilo, natamicina, nabam, nitrotal-isopropilo, nitrostireno, nuarimol, nonilfenol sulfonato de 50 cobre, halacrinato, validamicina, valifenalato, proteína harpina, bixafeno, picoxiestrobina, picobenzamida, bitionol, bitertanol, hidroxisoxazol, hidroxisoxazol-potasio, binapacril, bifenilo, piperalina, himexazol, piraoxistrobina, piracarbolid, piraclostrobina, pirazofós, pirametostrobina, piriofenona, piridinitrilo, pirifenox, piribencarb, pirimetanilo, piroxicloro, piroxifur, piroquilón, vinclozolina, famoxadona, fenapanilo, fenamidona, fenaminosulf, fenarimol, fenitropán, fenoxanilo, ferimzona, ferbam, fentina, fenciclonil, fentiazamina, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidina, fenpropimorf, 55 fenhexamida, ftalida, butiobato, butilamina, bupirinato, fuberidazol, blasticidina-S, furametpir, furalaxilo, flucacipirim, fluzinam, fluoxastrobina, fluotrimazol, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, furcarbonil, fluxaproxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonilo, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, furfural, furmeciclox, flumetover, flumorf, proquinazid, procloraz, procimidona, protiocarb, protioconazol, propamocarb, propiconazol, propineb, furofanato, probenazol, bromuconazol, hexaclorobutadieno, hexaconazol, hexiltiofós, betoxazina, benalaxilo, 60 benalaxilo-M, benodanil, benomilo, pefurazoato, benquinox, penconazol, benzamorf, pencicurón, ácido benzohidroxámico, bentalurón, bentiazol, bentiavalicarb-isopropilo, pentioperad, penflufeno, boscalid, fosdifeno, fosetilo, fosetilo-AI, polioxinas, polioxorim, policarbamato, folpet, formaldehído, aceite para máquinas, maneb, mancozeb, mandipropamid, miclozolina, miclobutanil, mildiomicina, milneb, mecarbinezida, metasulfocarb, metazonolona, metam, metam-sodio, metalaxilo, metalaxilo-M, metiram, isotiocianato de metilo, meptildinocap, 65 metconazol, metsulfovax, metfuroxam, metominostrobina, metrafenona, mepanipirim, mefenoxam, meptildinocap, mepronilo, mebenilo, yodometano, rabenzazol, cloruro de benzalconio, cloruro de cobre básico, sulfato de cobre

básico, microbicidas inorgánicos tales como plata, hipoclorito de sodio, hidróxido cúprico, azufre humectable, polisulfuro de calcio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, azufre, anhídrido de sulfato de cobre, dimetilditiocarbamato de níquel, compuestos de cobre tales como quinolinolato de cobre-8 (oxina de cobre), sulfato de cinc y sulfato de cobre pentahidratado.

5 Los herbicidas ilustrativos usados para los mismos fines anteriores incluyen 1-natilacetamida, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, ioxinilo, aclonifeno, azafenidina, acifluorfenó, aciprotina, azimsulfurón, asulam, acetocloro, atrazina, atratón, anisurón, anilofós, aviglicina, ácido abscísico, amicarbazona, amidosulfurón, amitrol, aminociclopiracloro, aminopirialida, amibuzina, amiprofós-metilo, ametrídiona, ametrina, alacloro, alidocloro, aloxidim, alorac, isourón, isocarbamida, isoxaclortol, isoxapirifop, isoxaflutol, isoxabeno, isocilo, isonorurón, isoproturón, isopropalina, isopolinato, isometiozina, inabenfida, ipacina, ipfencarbazona, iprimidam, imazaquina, imazapic, imazapir, imazametapir, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazetapir, imazosulfurón, indaciflam, indanofán, ácido indolbutírico, uniconazol-P, eglinacina, esprocarb, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etalfluralina, etiolato, eticlozato-etilo, etidimurón, etinofeno, etefón, etoxisulfurón, etoxifeno, etnipromida, etofumesato, etobenzanida, epronaz, erbón, endotal, oxadiazón, oxadiargilo, oxaziclomefona, oxasulfurón, oxapirazona, oxifluorfenó, orizalina, ortosulfamurón, orbencarb, cafenstrol, cambendiclor, carbasulam, carfentrazona, carfentrazona-etilo, carbutilato, carbetamida, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etilo, xilaclor, quinoclamina, quinonamida, quinclorac, quinmerac, cumilurón, clidinato, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, credacina, cletodim, cloxifonac, clodinafop, clodinafop-propargilo, clorotolurón, clopiralida, cloproxidim, cloprop, clorbromurón, clofop, clomazona, clometoxinilo, clometoxifeno, clomeprop, cloracifop, cloracina, cloransulam, clorancrilo, clorambeno, cloransulam-metilo, cloridazón, clorimurón, clorimurón-etilo, clorsulfurón, clortal, clortiamida, clortolurón, clornitrofenó, clorfenac, clorfenprop, clorbufam, clorflurazol, clorflurenol, clorprocarb, clorprofam, clormequat, cloreturón, cloroxinilo, cloroxurón, cloropón, saflufenacil, cianazina, cianatrina, di-alato, diurón, dietamquat, dicamba, ciclurón, cicloato, cicloxidim, diclosulam, ciclosulfamurón, diclorprop, diclorprop-P, diclobenil, diclofop, diclofop-metilo, diclormato, dicloralurea, diquat, cisanilida, disul, sidurón, ditiopir, dinitramina, cinidón-etilo, dinosam, cinosulfurón, dinoseb, dinoterb, dinofenato, dinoprop, cihalofop-butilo, difenamida, difenoxurón, difenopenteno, difenzoquat, ciburtrina, cipracina, ciprazol, diflufenicán, diflufenzopir, dipropetrina, cipromid, ciperquat, giberelina, simazina, dimexano, dimetaclor, dimidazona, dimetametrina, dimetenamid, simetrina, simetón, dimepiperato, dimefurón, cinmetilina, swep, sulglicapina, sulcotriona, sulfalato, sulfentrazona, sulfosulfurón, sulfometurón, sulfometurón-metilo, secbumetón, setoxidim, sebutilacina, terbacilo, daimurón, dazomet, dalapón, tiazaflurón, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tiocarbazilo, tioclorim, tiobencarb, tidiazimina, tidiazurón, tifensulfurón, tifensulfurón-metilo, desmedifam, desmetrina, tetraflurón, tenilcloro, tebutam, tebutiurón, terbumetón, tepraloxidim, tefultriona, tembotriona, delacloro, terbacilo, terbucarb, terbucloro, terbutilazina, terbutrina, topramezona, tralcoxidim, triaziflam, triasulfurón, tri-alato, trietazina, tricamba, triclopir, tridifano, tritac, tritosulfurón, triflusulfurón, triflusulfurón-metilo, trifluralina, trifloxisulfurón, tripropindano, tribenurón-metilo, tribenurón, trifop, trifopsima, trimetralam, naptalam, naproanilida, napropamida, nicosulfurón, nitalina, nitrofenó, nitrofluorfenó, nipiraclorfenó, neburón, norflurazón, norurón, barbano, paclobutrazol, paraquat, paraflurón, haloxidina, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-metilo, halosafeno, halosulfurón, halosulfurón-metilo, picloram, picolinafeno, biciclopirona, bispiribac, bispiribac-sodio, pidanona, pinoxadeno, bifenox, piperofos, himexazol, piraclonil, pirasulfotol, pirazoxifeno, pirazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, pirazolato, bilanafós, piraflufeno-etilo, piri-clor, piridafol, piritiobac, piritiobac-sodio, piridato, pirifalida, piributicarb, piribenzoxim, pirimisulfán, pirimisulfurón, piriminobac-metilo, piroxasulfona, piroxasulfam, fenasulam, fenisofam, fenurón, fenoxasulfona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenotiól, fenoprop, fenobenzurón, fentiaprop, fenteracol, fentrazamida, fenmedifam, fenmedifam-etilo, butacloro, butafenacilo, butamifós, butiurón, butidazol, butilato, buturón, butenacloro, butroxidim, butralina, flazasulfurón, flamprop, furiloxifeno, prinacloro, pirimisulfurón-metilo, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazolato, fluoxipir, fluotiurón, fluometurón, fluoroglicofeno, fluoro-cloridona, fluorodifeno, fluoronitrofenó, fluoromidina, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucloralina, flucetosulfurón, flutiacet, flutiacet-metilo, flupirsulfurón, flufenacet, flufenicán, flufenpir, flupropacilo, flupropanato, flupoxam, flumioxazina, flumiclorac, pentilflumiclorac, flumipropina, flumecina, fluometurón, flumetsulam, fluridona, flurtamona, fluroxipir, pretilacloro, proxano, proglinacina, prociacina, prodiamina, prosulfalina, prosulfurón, pro-sulfocarb, propaquizafop, propacloro, propazina, propanil, propizamida, propisocloro, prohidro-jasmón, propirisulfurón, profam, profluzol, profluralina, prohexadiona-calcio, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, profoxidim, bromacil, brompirazón, prometrina, prometón, bromoxinilo, bromofenoxim, bromobutida, bromobonilo, florasulam, hexacloroacetona, hexazinona, petoxamida, benazolina, penoxsulam, pebulato, beflubutamida, vernolato, perfluidona, bencarbazona, benzadox, bencipram, bencilaminopurina, benztiázurón, benzfendizona, bensulida, bensulfurón-metilo, benzoilprop, benzobici-clón, benzofenap, benzofluoro, bentazona, pentanocloro, bentiocarb, pendimetalina, pentoxazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, fomesafeno, foramsulfurón, forclorfenurón, hidrazina maleica, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfurón, mesosulfurón-metilo, mesotriona, mesopracina, metoprotrina, metazacloro, metazol, metazosulfurón, metabenztiázurón, metamitrón, metamifop, metam, metalpropalina, metiurón, metiozolina, metiobencarb, metildimrón, metoxurón, metosulam, metsulfurón, metsulfurón-metilo, metflurazón, metobromurón, metobenzurón, metometón, metolacloro, metribuzina, cloruro de mepiquat, mefenacet, mefluidida, monalida, monisourón, monurón, ácido monocloroacético, monolinurón, molinato, morfamcuat, yodosulfurón, yodosulfurón-metil-sodio, yodobonilo, yodometano, lactofeno, linurón, rimsulfurón, lenacilo, rodetanilo, peróxido de calcio y bromuro de metilo.

Los bioplaguicidas ilustrativos usados para los mismos fines que los anteriores incluyen formulaciones víricas tales

como virus de la poliedrosis nuclear (NPV), virus de la granulosis (GV), virus de la poliedrosis citoplasmática (CPV) y entomopoxvirus (EPV); plaguicidas microbianos usados como insecticida o nematicida, tales como *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* y *Pasteuria penetrans*; plaguicidas microbianos usados como microbicida, tales como *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, avirulento *Erwinia carotovora* y *Bacillus subtilis*; y bioplaguicidas usados como herbicida, tales como *Xanthomonas campestris*. Se puede esperar que dicho uso combinado del insecticida agrícola u hortícola de la presente invención con el bioplaguicida anterior en forma de una mezcla proporcione el mismo efecto que anteriormente.

Otros ejemplos de bioplaguicidas incluyen depredadores naturales tales como *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* y *Orius sauteri*; plaguicidas microbianos tales como *Beauveria brongniartii*; y feromonas tales como acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo, acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona y 14-metil-1-octadeceno.

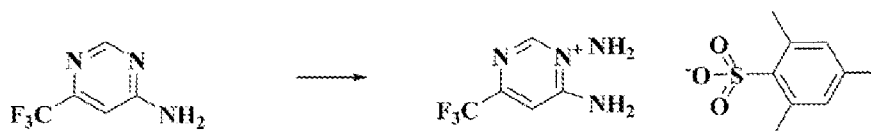
En lo sucesivo en el presente documento, los ejemplos de producción de compuestos representativos de la presente invención y sus intermedios se describirán con más detalle, pero la presente invención no se limita solo a estos ejemplos.

Ejemplos

Ejemplo de referencia 1

Método de producción de 4-trifluorometilpirimidin-1-ilo-1,6-diamina, 2,4,6-trimetilbencenosulfonato (sal)

[Fórmula química 9]

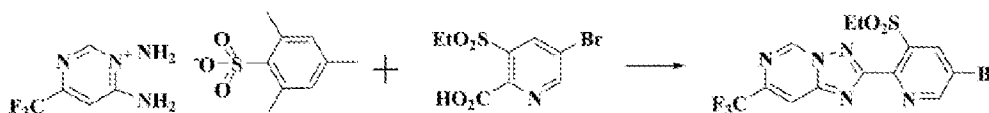


A un tubo de microondas equipado con una barra agitadora magnética, se le añadió ácido 2,2,2-trifluoroacético (4,4 g, 2,54 mmol, 2,9 ml) y posteriormente se le añadió 2,4,6-trimetilbencenosulfonato de (t-butoxicarbonilamino) (1 g, 2,54 mmol) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a 0 °C durante 2 horas, se le añadió agua enfriada con hielo y el precipitado se recogió por filtración. La torta húmeda se lavó con agua y se disolvió en diclorometano (5 ml). La solución resultante se secó sobre sulfato de sodio y se añadió gota a gota a una solución agitada de 6-trifluorometilpirimidin-4-amina (0,373 g, preparada de acuerdo con la descripción en el documento WO 2007/113558) en diclorometano (5 ml) a 0 °C. La mezcla de reacción se dejó reposar a esa temperatura durante 1 hora y luego a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción obtenida como una suspensión blanca se diluyó con éter dietílico (8 ml) y el precipitado se recogió mediante filtración para dar el producto deseado (0,79 g, 82 %).

Ejemplo de referencia 2

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-bromo-2-piridil)-7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-c]pirimidina

[Fórmula química 10]

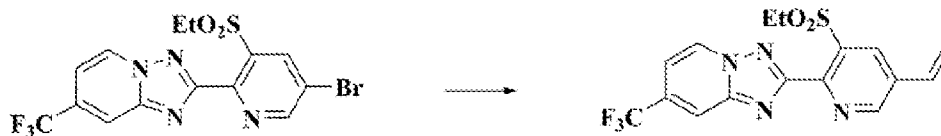


4-Trifluorometilpirimidin-1-ilo-1,6-diamina, 2,4,6-trimetilbencenosulfonato (sal) (0,3 g, 0,791 mmol), ácido 3-etilsulfonil-5-bromopiridin-2-carboxílico (0,284 g, 1,18 mmol) y clorhidrato de 3-(etiliminometileno)-N,N-dimetil-propan-1-amina (0,18 g, 0,94 mmol) se disolvieron en piridina (2 ml) y la mezcla se calentó a 120 °C durante 3 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua y la capa acuosa se extrajo con EtOAc (acetato de etilo) tres veces. Las capas orgánicas combinadas se lavaron sucesivamente con agua y salmuera, se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro (sulfato de sodio), y se filtraron. El filtrado se concentró al vacío. El producto en bruto se lavó con éter dietílico y se filtró para dar el producto deseado en forma de un polvo blanco (90 mg, 33 %).

Ejemplo de referencia 3

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-vinil-2-piridil)-7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina

[Fórmula química 11]



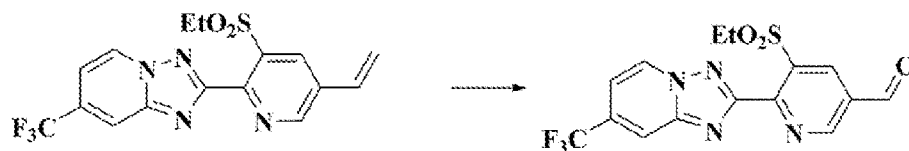
- 5 A una solución de DME (éter dimetílico) (4,0 ml) de 2-(3-etilsulfonil-5-bromo-2-piridil)-7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina (0,28 g) producido como en los Ejemplos de referencia 1 y 2, se le añadió trifluoroborato de vinilo y potasio (0,013 g), PdCl₂ (dppf)-acetona (0,024 g) y solución acuosa 2 M de Na₂CO₃ (1,0 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 1 hora. Tras completarse la reacción, se añadió agua y se realizó la extracción del acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío para dar el producto deseado.

10

Ejemplo de referencia 4

Método de producción de 5-etilsulfonil-2-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinaldehído

[Fórmula química 12]



15

- A una solución tampón de THF (tetrahidrofurano):acuosa (2:1) de pH 7 (30 ml) de 2-(3-etilsulfonil-5-vinil-2-piridil)-7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a] piridina, se le añadió una solución acuosa al 50 % de NMO (N-óxido de N-metilmorfolina) (0,44 g) y solución 0,1 M de OsO₄ en t-BuOH (t-butanol) al 50 % (0,3 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. Se le añadió NaIO₄ (0,20 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Tras completarse la reacción, se le añadió una solución saturada de Na₂S₂O₃ y se realizó la extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice para dar el compuesto deseado (0,20 g, 83 %).

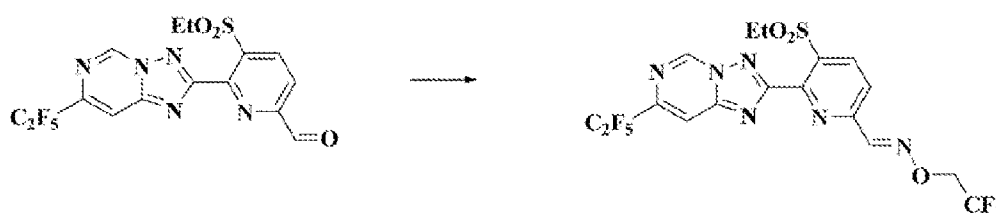
20

25 Ejemplo de producción 1

Método de producción de

- 30 5-etilsulfonil-6-(7-pentafluoroetil-[1,2,4]triazolo[1,5-c]piridin-2-il)picolinaldehído O-(2,2,2-trifluoroetil)oxima (Compuesto n.º 2-42)

[Fórmula química 13]



35

- A una solución en cloroformo (1 ml) de 5-etilsulfonil-6-(7-pentafluoroetil-[1,2,4]triazolo[1,5-c]piridin-2-il)picolinaldehído (0,006 g, 0,013 mmol) producida como en los Ejemplos de Referencia 1 a 4, Se le añadieron clorhidrato de O-(2,2,2-trifluoroetil)hidroxilamina (0,003 g, 0,021 mmol) y piridina (0,002 ml, 0,021 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 1 hora. Tras completarse la reacción, se añadió una solución acuosa 1 N de ácido clorhídrico y se realizó la extracción del acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice para dar el compuesto deseado

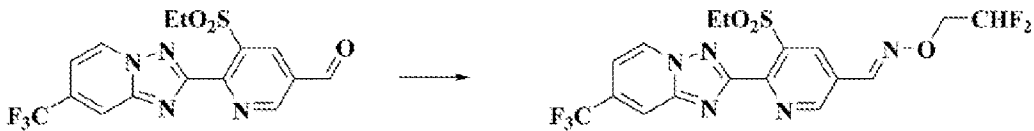
40

(0,006 g, 0,011 mmol, 85 %).

Ejemplo de producción 2

- 5 Método de producción de 5-etilsulfonil-2-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinaldehído O-(2,2-difluoroetil)oxima (Compuesto n.º 1-7)

[Fórmula química 14]



- 10 A una solución en cloroformo (2 ml) de 5-etilsulfonil-2-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinaldehído (0,050 g, 0,13 mmol) producida como en los Ejemplos de Referencia 1 a 4, se le añadieron clorhidrato de O-(2,2-difluoroetil)hidroxilamina (0,026 g, 0,20 mmol) y piridina (0,015 ml, 0,20 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 1 hora. Tras completarse la reacción, se le añadió una solución acuosa 1 N de HCl y se realizó la extracción del acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en gel de sílice para dar el compuesto deseado (0,044 g, 0,095 mmol, 73 %).

Ejemplo de referencia 5

- 20 Método de producción de éster metílico del ácido 5-etilsulfonil-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotínico

[Fórmula química 15]



- 25 2-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)-7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina (5,21 g) producida como en los Ejemplos de referencia 1 y 2, difenilfosfinobutano (102 mg), bistrifenilfosfina, dicloropaladio (84 mg), metanol (60 ml) y trietilamina (1,68 ml) se añadieron a un autoclave de acero inoxidable de 200 ml. El sistema de reacción se purgó con monóxido de carbono y la mezcla se agitó bajo una presión de 3 MPa a 110 °C durante 2 horas. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, la mezcla de reacción se desgasificó y se añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo, y la capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (2,34 mg, rendimiento: 47 %).
- 30 RMN ¹H: 9,54 (d, 1H), 9,10 (d, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,15 (t, 1H), 7,33 (d, 1H), 4,18-4,09 (m, 5H), 1,44 (t, 3H)

- 35 Ejemplo de referencia 6

Método de producción de ácido 5-etilsulfonil-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotínico

[Fórmula química 16]



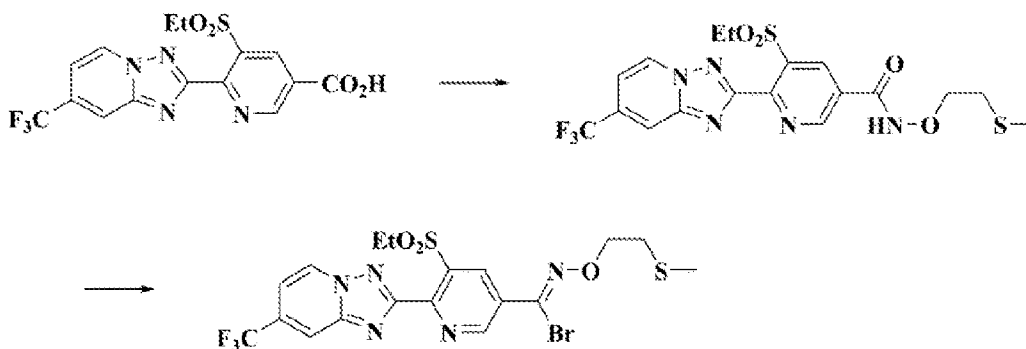
- 40 A una mezcla de éster metílico del ácido 5-etilsulfonil-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotínico (2,34 g), metanol (40 ml), y tetrahidrofurano (40 ml), se le añadió una solución acuosa de hidróxido de litio (4,0 M, 2,11 ml). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y se añadió ácido clorhídrico 2 N hasta que el pH de la mezcla de reacción llegó a ser 4 o menos. El sólido resultante se recogió para dar el producto deseado (1,97 g, rendimiento: 87 %).
- 45

RMN ¹H: 9,58 (d, 1H), 9,14 (d, 1H), 8,82 (d, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,35 (d, 1H), 4,07 (d, 2H), 1,45 (t, 3H)

Ejemplo de producción 3

- 5 Método de producción de bromuro de 5-etilsulfonil-N-(2-metiltoetoxi)-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinimidoilo (Compuesto n.º 3-19)

[Fórmula química 17]



- 10 A una mezcla de ácido 5-etilsulfonil-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotínico (1 g), clorhidrato de metiltioetoxiamina (solución en cloroformo 0,3 M, 12,5 ml), dimetilaminopiridina (916 mg) y piridina (592 µl), se le añadió clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (718 mg). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas, se añadió HCl 2 N y se realizó la extracción del acetato de etilo. La capa orgánica se concentró para dar la 5-etilsulfonil-N-(2-metiltoetoxi)-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinamida deseada (1,76 g).

- 15 A la mezcla resultante, se le añadieron tetrahidrofurano (50 ml), trifenilfosfina (1,96 g) y tetrabromuro de carbono (2,5 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. El material insoluble se retiró por filtración y el filtrado se concentró. Una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio se añadió al residuo y se realizó la extracción del acetato de etilo. La capa orgánica se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el bromuro de 5-etilsulfonil-N-(2-metiltoetoxi)-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinimidoilo deseado (594 mg, rendimiento: 43 %).

Punto de fusión: del 188 °C al 189 °C

- 25 Ejemplo de producción 4

Método de producción de ciclopropil(5-etilsulfonil)-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)piridin-3-il)metanona O-(2-metiltoetil)oxima (Compuesto n.º 3-28)

[Fórmula química 18]



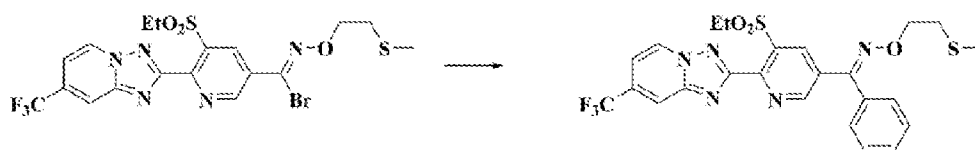
- 30 Una mezcla del bromuro de 5-etilsulfonil-N-(2-metiltoetoxi)-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinimidoilo (91 mg) producido en el Ejemplo de Producción 3, ácido ciclopropilborónico (71 mg), tetraquis(trifenilfosfina)paladio (36 mg), tolueno (2 ml) y una solución acuosa de carbonato de sodio 2 M (0,8 ml) se calentó a 100 °C con agitación en una atmósfera de argón durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriara hasta temperatura ambiente y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (49 mg, rendimiento: 59 %).

Punto de fusión: del 167 °C al 168 °C

- 40 Ejemplo de producción 5

Método de producción de (5-etilsulfonil-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)piridin-3-il)fenilmetanona O-(2-metiltoetil) oxima (Compuesto n.º 3-46)

[Fórmula química 19]



- Una mezcla de bromuro de 5-etilsulfonil-N-(2-metilthioetoxi)-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinimidato (77 mg), ácido fenilborónico (51 mg), tetraquis(trifenilfosfina)paladio (36 mg), tolueno (2 ml) y una solución acuosa de carbonato de sodio 2 M (0,4 ml) se calentó a 100 °C con agitación en una atmósfera de argón durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriara hasta temperatura ambiente y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (64 mg, rendimiento: 84 %). Punto de fusión: del 157 °C al 158 °C

10 Ejemplo de producción 6

Método de producción de 5-etilsulfonil-N-(2-metilthioetoxi)-6-(7-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinimidato de metilo (compuesto n.º 3-1)

[Fórmula química 20]



- Una mezcla de bromuro de 5-etilsulfonil-N-(2-metilthioetoxi)-6-(7-trifluorometil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-il)nicotinimidato (107 mg), carbonato de cesio (189 mg), Pd Rockphos G3 (5 mg, Sigma-Aldrich), tolueno (1 ml) y metanol (1 ml) se calentó a 60 °C con agitación en una atmósfera de argón durante 1 hora. Se dejó que la mezcla de reacción se enfriara hasta temperatura ambiente y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (36 mg, rendimiento: 38 %). Punto de fusión: del 165 °C al 166 °C

Ejemplo de referencia 7

25 Método de producción de N-metilthioetoxifalimida

[Fórmula química 21]

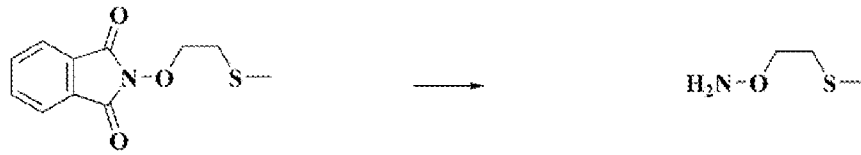


- A una mezcla de N-hidroxifalimida (10 g), trifenilfosfina (19,3 g), metilthioetanol (6,4 ml) y tetrahidrofurano (120 ml), se le añadió azodicarboxilato de dietilo (solución de tolueno 2,2 M, 33,4 ml). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 horas, y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar la N-metilthioetoxifalimida deseada (15 g, rendimiento: 100 %).

Ejemplo de referencia 8

35 Método de producción de metilthioetoxiamina

[Fórmula química 22]



5 A una mezcla de N-etiltioetoxifalimida (15 g) y cloroformo (60 ml), se le añadió monohidrato de hidrazina (3 ml). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas, y el material insoluble se retiró por filtración a través de Celite. El filtrado se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se filtró nuevamente. El filtrado resultante se usó como una solución 0,3 M de metiltioetoxiamina para la reacción.

10 A continuación se muestran ejemplos de formulación, pero la presente invención no se limita a ellos. En los ejemplos de formulación, "partes" significa partes en peso.

Ejemplo de formulación 1

Compuesto de la presente invención	10 partes
Xileno	70 partes
N-metilpirrolidona	10 partes
Mezcla de nonilfenil éter de polioxietileno y alquilbenceno sulfonato de calcio (relación en peso de 1:1)	10 partes

15 Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme hasta su disolución para dar una formulación concentrada emulsionable.

Ejemplo de formulación 2

Compuesto de la presente invención	3 partes
Polvo de arcilla	82 partes
Polvo de diatomita	15 partes

20 Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme y después se pulverizan para dar una formulación en polvo.

Ejemplo de formulación 3

Compuesto de la presente invención	5 partes
Mezcla de polvo de bentonita y polvo de arcilla	90 partes
Lignosulfonato de calcio	5 partes

25 Los ingredientes se mezclan de manera uniforme. Después de la adición de un volumen de agua apropiado, la mezcla se amasa, se granula y se seca para dar una formulación granulada.

Ejemplo de formulación 4

Compuesto de la presente invención	20 partes
Caolín y ácido silícico de alta dispersión sintético	75 partes
Mezcla de nonilfenil éter de polioxietileno y alquilbenceno sulfonato de calcio (relación en peso de 1:1)	5 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme y después se pulverizan para dar una formulación en polvo humectable.

35 Ejemplo de formulación 5

ES 2 969 738 T3

Compuesto de la presente invención	20 partes
Polioxietilen lauril éter	3 partes
Dioctilsulfosuccinato de sodio	3,5 partes
Dimetilsulfóxido	37 partes
2-Propanol	36,5 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme hasta su disolución para dar una preparación concentrada soluble en agua.

5 Ejemplo de formulación 6

Compuesto de la presente invención	2 partes
Dimetilsulfóxido	10 partes
2-Propanol	35 partes
Acetona	53 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme hasta su disolución para dar una solución para pulverizar.

10 Ejemplo de formulación 7

Compuesto de la presente invención	5 partes
Hexilenglicol	50 partes
Isopropanol	45 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme hasta su disolución para dar una solución para administración transdérmica.

15 Ejemplo de formulación 8

Compuesto de la presente invención	5 partes
Monometil éter de propilenglicol	50 partes
Dipropilenglicol	45 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme hasta su disolución para dar una solución para administración transdérmica.

Ejemplo de formulación 9

Compuesto de la presente invención	2 partes
Parafina líquida ligera	98 partes

25 Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme hasta su disolución para dar una solución para administración transdérmica (de vertido).

Ejemplo de formulación 10

Compuesto de la presente invención	2 partes
Parafina líquida ligera	58 partes
Aceite de oliva	30 partes
ODO-H	9 partes
Silicona Shin-etsu (fabricada por Shin-Etsu Chemical Co., Ltd.)	1 parte

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme hasta su disolución para dar una solución para administración transdérmica (de vertido).

- 5 En lo sucesivo en el presente documento, se muestran ejemplos de ensayo en relación con la presente invención, pero la presente invención no se limita a ellos.

Ejemplo de ensayo 1

- 10 Ensayo de eficacia de control sobre *Myzus persicae*

Se plantaron plantas de col china en macetas de plástico (diámetro: 8 cm, altura: 8 cm), se propagaron pulgones verdes del melocotonero (*M. persicae*) en las plantas y se contó el número de pulgones verdes del melocotonero supervivientes en cada maceta. Los compuestos heterocíclicos condensados representados por la fórmula general (1) de la presente invención o sales de los mismos se dispersaron por separado en agua y se diluyeron hasta 500 ppm. Las dispersiones agroquímicas se aplicaron al follaje de las plantas de col china en macetas. Después de secar las plantas al aire, las macetas se mantuvieron en un invernadero. A los 6 días de la aplicación foliar, se contó el número de pulgones verdes del melocotonero supervivientes en la planta de col china en cada maceta, la tasa de control se calculó de acuerdo con la fórmula mostrada a continuación y la eficacia de control se evaluó de acuerdo con los criterios mostrados a continuación.

[Fórmula matemática 1]

$$\text{Tasa de control} = 100 - \left\{ \frac{T \times Ca}{Ta \times C} \right\} \times 100$$

25

Ta: el número de supervivientes antes de la aplicación foliar en una parcela con tratamiento
 T: el número de supervivientes después de la aplicación foliar en una parcela con tratamiento
 Ca: el número de supervivientes antes de la aplicación foliar en una parcela sin tratamiento
 C: el número de supervivientes después de la aplicación foliar en una parcela sin tratamiento

30

Criterios

- A: la tasa de control es del 100 %.
 B: la tasa de control es del 90 al 99 %.
 35 C: la tasa de control es del 80 al 89 %.
 D: la tasa de control es del 50 al 79 %.

Como resultado, los compuestos 1-3, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-15, 1-16, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 2-6, 2-7, 2-8, 2-15, 2-16, 2-17, 2-20, 2-24, 2-25, 2-42, 2-43, 2-48, 2-51, 2-52, 3-1, 3-19, 3-28, 3-46, 3-52 y 3-82 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

40

Ejemplo de ensayo 2

Ensayo insecticida sobre *Laodelphax striatellus*

45

Los compuestos heterocíclicos condensados representados por la fórmula general (1) de la presente invención o sales de los mismos se dispersaron por separado en agua y se diluyeron hasta 500 ppm. Plántulas de plantas de arroz (variedad: Nihonbare) se sumergieron en las dispersiones agroquímicas durante 30 segundos. Después de secar al aire, cada plántula se puso en un tubo de ensayo de vidrio separado y se inoculó con diez larvas de tercer estadio de *L. striatellus*, y después se taparon los tubos de ensayo de vidrio con tapones de algodón. A los 8 días después de la inoculación, se contó el número de larvas supervivientes y larvas muertas de *L. striatellus*, la tasa de mortalidad corregida se calculó de acuerdo con la fórmula mostrada a continuación y la eficacia insecticida se evaluó de acuerdo con los criterios del Ejemplo de ensayo 1.

50

55

[Fórmula matemática 2]

$$\text{Tasa de mortalidad corregida (\%)} = 100 \times \left(\frac{\text{Tasa de supervivencia en una parcela sin tratamiento} - \text{Tasa de supervivencia en una parcela con tratamiento}}{\text{Tasa de supervivencia en una parcela sin tratamiento}} \right)$$

60

Como resultado, los compuestos 1-3, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-15, 1-16, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 2-6, 2-7, 2-8, 2-15, 2-16, 2-17, 2-20, 2-24, 2-25, 2-42, 2-43, 2-48, 2-51, 2-52, 3-1, 3-19, 3-28, 3-46, 3-52 y 3-82 mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

65

Ejemplo de ensayo 3

Ensayo insecticida sobre *Plutella xylostella*

Se liberaron adultos de *P. xylostella* sobre plántulas de col china y se les permitió poner huevos sobre ellas. A los 2 días después de la liberación de los adultos, las plántulas de col china con huevos puestos se sumergieron durante aproximadamente 30 segundos en formulaciones agroquímicas diluidas a 500 ppm, cada una de las cuales contenía un tipo diferente de compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención como principio activo. Después de secar al aire, las plántulas se mantuvieron en una cámara termostática a 25 °C. A los 6 días después del tratamiento por inmersión, se contó el número de larvas eclosionadas por parcela, se calculó la tasa de mortalidad de *P. xylostella* de acuerdo con la fórmula mostrada a continuación y se evaluó la eficacia insecticida de acuerdo con los criterios del Ejemplo de ensayo 1. Este ensayo se realizó por triplicado usando 10 adultos de *P. xylostella* por parcela.

[Fórmula matemática 3]

Tasa de mortalidad corregida (%) = $100 \times (\text{número de larvas eclosionadas en una parcela sin tratamiento} - \text{Número de larvas eclosionadas en una parcela con tratamiento}) / \text{Número de larvas eclosionadas en una parcela sin tratamiento}$

Como resultado, los compuestos 1-3, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-15, 1-16, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-52, 2-6, 2-7, 2-8, 2-15, 2-16, 2-17, 2-20, 2-24, 2-25, 2-42, 2-43, 2-48, 2-51, 2-52, 3-1, 3-19, 3-28, 3-46, 3-52 y 3-82 mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Ejemplo de ensayo 4

Ensayo de motilidad de las larvas sobre *Haemonchus contortus*

Se añadieron soluciones diluidas en dimetilsulfóxido (DMSO) de diversos compuestos de la presente invención a una concentración final de 50 ppm a los pocillos de una placa de 96 pocillos que contenía un medio acondicionado predeterminado. Se introdujeron veinte larvas en estadio L1 de *H. contortus* en cada pocillo de la placa de 96 pocillos. La placa se dejó reposar durante 4 días y luego se examinó la motilidad de las larvas. El porcentaje de inhibición de la motilidad en los pocillos de cada tratamiento se calculó en relación con los pocillos del tratamiento solo con DMSO.

Como resultado, los compuestos 1-7 y 1-50 de la presente invención mostraron un porcentaje de inhibición de la motilidad del 50 % o más.

Ejemplo de ensayo 5

Ensayo de motilidad de las larvas sobre *Dirofilaria immitis*

Quinientas larvas en estadio L1 de *D. immitis* se diluyeron en un medio acondicionado predeterminado y se introdujeron en cada pocillo de una placa de 96 pocillos. Se añadieron soluciones diluidas en DMSO de diversos compuestos de la presente invención a una concentración final de 50 ppm a los pocillos de la placa de 96 pocillos. La placa se dejó reposar durante 3 días y luego se examinó la motilidad de las larvas. El porcentaje de inhibición de la motilidad en los pocillos de cada tratamiento se calculó en relación con los pocillos del tratamiento solo con DMSO.

Como resultado, los compuestos 1-7, 1-49 y 1-50 de la presente invención mostraron eficacia inhibidora contra larvas de *D. immitis* con un porcentaje de inhibición de la motilidad del 50 % o más.

Ejemplo de ensayo 6

Ensayo de actividad parasiticida oral contra adultos de *Ctenocephalides felis*

Los adultos recién emergidos de *C. felis* se pusieron en jaulas de ensayo (10 adultos por jaula de ensayo). Se añadieron soluciones diluidas en DMSO de diversos compuestos de la presente invención a alícuotas de sangre bovina a una concentración final de 50 ppm y se administraron por vía oral a los adultos de *C. felis* usando un comedero. La tasa de mortalidad se examinó al día siguiente. Los adultos anómalos se consideraron muertos.

Como resultado, los compuestos 1-7, 1-8, 1-15, 1-26, 1-47, 1-49 y 1-50 de la presente invención mostraron actividad parasiticida contra adultos de *C. felis* con una tasa de mortalidad del 50 % o más.

Ejemplo de ensayo 7

Ensayo de actividad parasiticida transdérmica contra ninfas de *Rhipicephalus sanguineus*

Se diluyeron individualmente soluciones diluidas en DMSO de diversos compuestos de la presente invención hasta la concentración final de 100 ppm con una solución de acetona/tritón y se aplicaron al interior de frascos de muestra ventiladas. Después del secado durante la noche, se introdujeron diez ninfas de *R. sanguineus* en cada frasco, y dos

días después se examinó la tasa de mortalidad. Los adultos anómalos se consideraron muertos.

Como resultado, los compuestos 1-47 y 1-50 de la presente invención mostraron actividad parasiticida contra ninfas de *R. sanguíneo* con una tasa de mortalidad del 50 % o más.

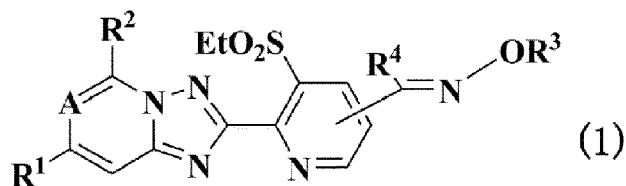
5

Aplicabilidad industrial

El compuesto de la presente invención es muy eficaz para controlar una amplia gama de plagas agrícolas u hortícolas y endoparásitos y ectoparásitos animales y, por tanto, es útil.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico condensado representado por la siguiente fórmula:



5

en donde

R¹ representa

10

- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
- (a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

15

R² representa

20

- (b1) un átomo de hidrógeno;
- (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (b3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (b4) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
- (b5) un grupo halocicloalquilo (C₃-C₆),

25

R³ representa

30

- (c1) un átomo de hidrógeno;
- (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (c4) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (c5) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c7) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
- (c8) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

35

R⁴ representa

40

- (d1) un átomo de hidrógeno;
- (d2) un átomo de halógeno;
- (d3) un grupo ciano;
- (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (d5) un grupo alqueno (C₂-C₆);
- (d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (d7) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alqueno (C₂-C₆);
- (d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (d9) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (d10) un grupo R⁶(R)⁷N en donde R⁶ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alcocarbonilo (C₁-C₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆) o un grupo cicloalquilcarbonilo (C₃-C₆);
- (d11) un grupo NR⁶CON(R)⁶R⁷ grupo en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
- (d12) un grupo arilo;
- (d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonyl (C₁-C₆);
- (d14) un grupo heterocíclico; o
- (d15) un grupo heterocíclico que tiene, en el anillo, de 1 a 3 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo

60

haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

A representa un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno, (e2) un grupo alquilo (C₁-C₆) o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), o una sal del mismo.

2. El compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R¹ representa

(a1) un átomo de hidrógeno; o
(a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno; o
(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ representa

(c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
(c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
(c7) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
(c8) un grupo alquilsulfonil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

(d1) un átomo de hidrógeno;
(d2) un átomo de halógeno;
(d3) un grupo ciano;
(d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(d5) un grupo alqueno (C₂-C₆);
(d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
(d7) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquino (C₂-C₆);
(d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
(d9) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
(d10) un grupo R⁶(R⁷)N en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
(d11) un grupo NR⁶CON(R⁶)R⁷ grupo en donde R⁶ y R⁷ son los mismos que los anteriores;
(d12) un grupo arilo;
(d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
(d14) un grupo heterocíclico; o
(d15) un grupo heterocíclico que tiene, en el anillo, de 1 a 3 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

A representa un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno, (e2) un grupo alquilo (C₁-C₆) o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

3. El compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R¹ representa

(a1) un átomo de hidrógeno; o
(a4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno; o
(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ representa

- 5 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (c6) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
 (c8) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

- 10 (d1) un átomo de hidrógeno;
 (d2) un átomo de halógeno;
 (d6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (d8) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
 15 (d12) un grupo arilo; o
 (d13) un grupo arilo que tiene, en el anillo, de 1 a 4 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo alquilo (C₁-C₆), (e) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (f) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (g) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (i) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (j) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquilsulfonyl (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonyl (C₁-C₆) y (m) un grupo haloalquilsulfonyl (C₁-C₆), y
- 20

A representa un átomo de nitrógeno o C-R⁵ en donde R⁵ representa (e1) un átomo de hidrógeno o (e3) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

- 25 4. Un insecticida agrícola u hortícola que comprende, como principio activo, el compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.
5. Un método para usar un insecticida agrícola u hortícola, que comprende tratar las plantas o el suelo con una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.
- 30 6. Un agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales que comprende, como principio activo, una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado o la sal del mismo de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.
- 35 7. El agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales de acuerdo con la reivindicación 6, para su uso en el tratamiento o prevención de infecciones parasitarias en un animal.
- 40 8. El agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales para su uso de acuerdo con la reivindicación 7, en donde el animal es un mamífero doméstico o un ave.
9. El agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales para uso de acuerdo con la reivindicación 7 u 8, en donde el agente de control de ectoparásitos o endoparásitos animales se administra por vía transdérmica u oral al animal.