

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 913 985**

51 Int. Cl.:

C07D 233/64	(2006.01)	C07D 401/04	(2006.01)
A01N 25/04	(2006.01)	C07D 401/14	(2006.01)
A01N 43/653	(2006.01)	C07D 403/04	(2006.01)
A01N 43/50	(2006.01)	C07D 403/10	(2006.01)
A01N 43/78	(2006.01)	C07D 403/14	(2006.01)
A01N 43/824	(2006.01)	C07D 413/10	(2006.01)
A01P 7/02	(2006.01)	A61P 33/14	(2006.01)
A01P 7/04	(2006.01)		
A61K 31/4439	(2006.01)		
A61K 31/506	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **13.09.2017 PCT/JP2017/033103**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **22.03.2018 WO18052035**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **13.09.2017 E 17850936 (0)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **16.03.2022 EP 3514146**

54 Título: **Compuesto de diaril-azol y formulación para el control de organismos nocivos**

30 Prioridad:

15.09.2016 JP 2016180467
28.04.2017 JP 2017089266

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
07.06.2022

73 Titular/es:

NIPPON SODA CO., LTD. (100.0%)
2-1, Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku
Tokyo 100-8165, JP

72 Inventor/es:

SAKANISHI, KEITA;
IWASA, TAKAO;
AOYAMA, HIKARU;
SAKIYAMA, NORIFUMI;
USHIJIMA, DAISUKE;
MATSUI, MAKI y
KOBAYASHI, TOMOMI

74 Agente/Representante:

ELZABURU, S.L.P

Observaciones:

Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 913 985 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 de diaril-azol y formulación para el control de organismos nocivos

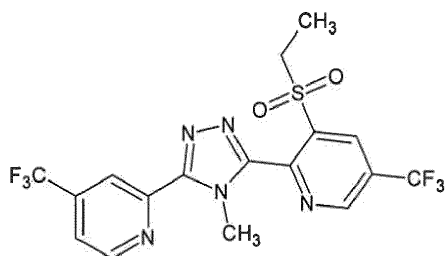
Campo técnico

- 5 La presente invención se refiere a un compuesto de diaril-azol y a una formulación para controlar organismos nocivos. En particular, la presente invención se refiere a un compuesto de diaril-azol que tiene una actividad insecticida y/o actividad acaricida superior, muestra una seguridad superior y puede sintetizarse de manera industrial de forma ventajosa, y también se refiere a una formulación para controlar organismos nocivos que contiene el mismo como principio activo.

Antecedentes de la técnica

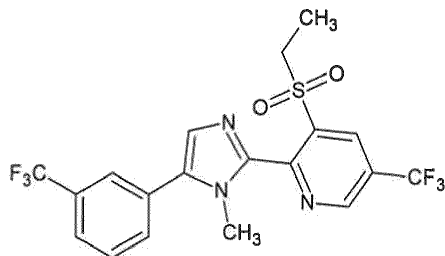
- 10 Se han propuesto diversos compuestos que tienen actividad acaricida y/o insecticida. Con el fin de poder utilizar tales compuestos como agroquímicos en la práctica, se requiere que los compuestos no solo tengan una eficacia suficiente, sino que apenas provoquen resistencia química, eviten la fitotoxicidad frente a plantas o la contaminación del suelo, y tengan un bajo nivel de toxicidad frente al ganado, los peces o similares.

El documento de patente 1 divulga un compuesto representado por la Fórmula (A).

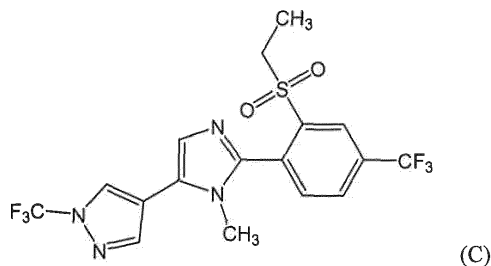


15

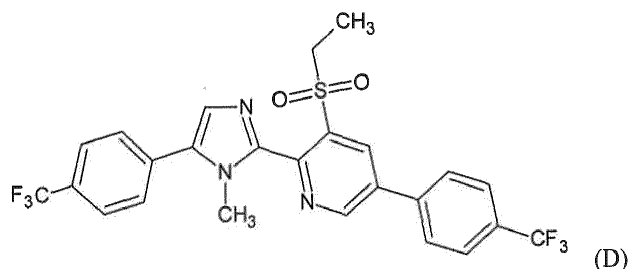
El documento de patente 2 divulga un compuesto representado por la Fórmula (B) y similares.



Además, el documento de patente 3 divulga un compuesto representado por la Fórmula (C) y similares.



- 20 Además, el documento de patente 4 divulga un compuesto representado por la Fórmula (D) y similares.



Bibliografía de la técnica anterior

Documentos de patente

[Documento de patente 1] Publicación internacional PCT N.º WO2015/144826

[Documento de patente 2] Publicación internacional PCT N.º WO2015/144895

5 [Documento de patente 3] Publicación internacional PCT N.º WO2016/024587

[Documento de patente 4] Publicación internacional PCT N.º WO2017/016922

Divulgación de la invención

Problema técnico

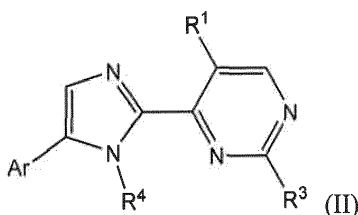
10 Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto de diaril-azol que tenga una actividad superior para controlar organismos nocivos y, en particular, actividad insecticida y/o actividad acaricida superior, muestre una seguridad superior y pueda sintetizarse de manera industrial de forma ventajosa, así como como proporcionar una formulación para controlar organismos nocivos que contengan el mismo como principio activo. Además, un objeto adicional de la invención es proporcionar una formulación para controlar ectoparásitos o una formulación para controlar o expulsar endoparásitos que contenga el mismo como principio activo.

15 **Solución al problema**

Como resultado de estudios concienzudos para lograr los objetos mencionados anteriormente, los inventores de la presente solicitud completaron la presente invención que incluye los siguientes modos.

[1] Un compuesto o una sal del mismo,

representado por la Fórmula (II).



20

en donde

R¹ es un grupo alquiltio C1-6 o un grupo alquilsulfonilo C1-6,

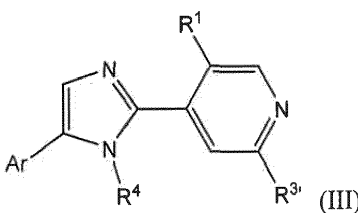
R³ es un átomo de hidrógeno, o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

R⁴ es un grupo alquilo C1-6, y

25 Ar es un grupo fenilo sustituido o no sustituido, o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido.

[2] Un compuesto o una sal del mismo,

representado por la Fórmula (III).



en donde

30 R¹ es un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido,

R^{3'} es un grupo hidroxilo, un grupo alcoxilo C1-6 o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,

R⁴ es un grupo alquilo C1-6, y

Ar es un grupo fenilo sustituido o no sustituido.

[6] Una formulación para controlar organismos nocivos, que contiene al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos enumerados en [1] o [2] mencionados anteriormente y sales de los mismos, como principio activo.

5 [3] Una formulación insecticida o una formulación acaricida, que contiene al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos enumerados en [1] o [2] mencionados anteriormente y sales de los mismos, como principio activo.

10 [4] Una formulación para controlar ectoparásitos, que contiene al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos enumerados en [1] o [2] mencionados anteriormente y sales de los mismos, como principio activo.

[5] Una formulación para controlar endoparásitos o para expulsar endoparásitos, que contiene al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos enumerados en [1] o [2] mencionados anteriormente y sales de los mismos, como principio activo.

Efectos ventajosos de la invención

15 Los compuestos de diaril-azol de la presente invención pueden controlar organismos nocivos que son problemáticos a tenor de productos agrícolas o por razones de higiene. En particular, los compuestos pueden controlar eficazmente plagas agrícolas y ácaros con una concentración reducida. Además, los compuestos de diaril-azol de la presente invención pueden controlar eficazmente ectoparásitos y endoparásitos que dañan a humanos y animales.

Realizaciones de la invención

20 En la presente invención, el término "no sustituido" significa que sólo está presente un grupo que es un núcleo matriz. Cuando solo se describe el nombre de un grupo como núcleo matriz sin el término "sustituido", significa "no sustituido" a menos que se especifique de otro modo.

25 Por otro lado, el término "sustituido (= que tiene un sustituyente)" significa que al menos un átomo de hidrógeno de un grupo como núcleo matriz está sustituido con un grupo que tiene una estructura igual o diferente a la del núcleo matriz. Por lo tanto, un "sustituyente" es otro grupo que está unido al grupo como núcleo matriz. El sustituyente puede ser uno, dos o más. Dos o más sustituyentes pueden ser iguales o diferentes entre sí.

El término "C1-6" representa que el número de átomos de carbono de un grupo como núcleo matriz es de 1 a 6. El número de átomos de carbono no incluye el número de átomos de carbono presentes en un sustituyente. Por ejemplo, un grupo butilo que tiene un grupo etoxilo como sustituyente se clasifica como un grupo alcoxilo C2 alquilo C4.

30 Un "sustituyente" no está particularmente limitado siempre que sea químicamente aceptable y tenga el efecto de la presente invención. A continuación en el presente documento, como ejemplos de un grupo que puede ser un "sustituyente", puede mencionarse,

un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un t-butilo grupo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo;

35 un grupo alquilsulfonilo C1-6 tal como un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo o un grupo t-butilsulfonilo;

Además, cualquiera de los átomos de hidrógeno en estos "sustituyentes" puede estar sustituido con otros sustituyentes que tengan una estructura diferente. En este caso, los ejemplos de los "sustituyentes" incluyen un grupo alquilo C1-6, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo alcoxilo C1-6, un grupo haloalcoxilo C1-6, un grupo halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro y similares.

40 Los ejemplos del "grupo heteroarilo de 5 miembros" incluyen un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo tetrazolilo, y similares.

Los ejemplos del "grupo heteroarilo de 6 miembros" incluyen un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo, un grupo triazinilo y similares.

45 En la Fórmula (I), R¹ representa un grupo alquiltio C1-6 sustituido o no sustituido. Los ejemplos de los sustituyentes en el "grupo alquiltio C1-6", de R¹ preferiblemente incluyen un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alcoxilo C1-6 tal como un grupo metoxilo, un grupo etoxilo, un grupo n-propoxilo, un grupo i-propoxilo, un grupo n-butoxilo, un grupo s-butoxilo, un grupo i-butoxilo o un grupo t-butoxilo; un grupo haloalcoxilo C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxilo, un grupo 2,3-diclorobutoxilo o un grupo trifluorometoxilo; y un grupo ciano.

50 Los ejemplos del "grupo halógeno" de R¹ incluyen un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo, un grupo yodo, y

similares.

Los ejemplos específicos del "grupo alquilo C1-6 sustituido" incluyen

5 un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 1-cloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4-clorobutilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoropropan-2-ilo, un grupo perfluoropropan-2-ilo, un grupo perfluorohexilo, un grupo perclorohexilo o un grupo 2,4,6-triclorohexilo;

un grupo hidroxialquilo C1-6 tal como un grupo hidroximetilo o un grupo hidroxietilo;

10 un grupo alcoxilo C1-6 alquilo C1-6 tal como un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo metoxietilo, un grupo etoxietilo, un grupo metoxi-n-propilo, un grupo n-propoximetilo, un grupo i-propoxietilo, un grupo s-butoximetilo, o un grupo t-butoxietilo;

un grupo arilo C6-10 alquilo C1-6 tal como un grupo bencilo o un grupo fenetilo;

15 un grupo cicloalquilo C3-8 alquilo C1-6 tal como un grupo ciclopropilmetilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, un grupo ciclopentilmetilo, un grupo 2-ciclohexiletilo o un grupo 2-ciclooctiletilo; y similares.

20 Los ejemplos del "grupo heteroarilo de 5 miembros" incluyen un grupo pirrolilo, un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo triazolilo (específicamente, un grupo [1,2,3]triazolilo o un grupo [1,2,4]triazolilo), un grupo oxadiazolilo (específicamente, un grupo [1,2,3]oxadiazolilo, un grupo [1,2,4]oxadiazolilo, un grupo [1,2,5]oxadiazolilo o un grupo [1,3,4]oxadiazolilo), un grupo tiadiazolilo, un grupo tetrazolilo, y similares.

Los ejemplos del "grupo heteroarilo de 6 miembros" incluyen un grupo piridilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo, un grupo triazinilo, y similares.

25 Los ejemplos del "grupo heterociclilo de 5 miembros parcialmente insaturado" incluyen un grupo pirrolinilo, un grupo imidazolinilo (un grupo dihidroimidazolilo), un grupo pirazolinilo, un grupo oxazolinilo, un grupo isoxazolinilo, un grupo tiazolinilo, y similares.

Los ejemplos del "grupo heterociclilo de 6 miembros parcialmente insaturado" incluyen un grupo tiopiranilo, un grupo 2H-piridin-1-ilo, un grupo 4H-piridin-1-ilo, y similares.

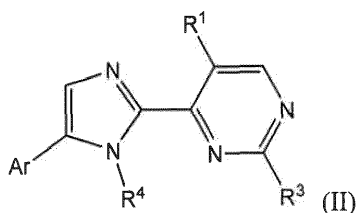
30 Los ejemplos de los sustituyentes en el "grupo cicloalquilo C3-8", "grupo arilo C6-10" y "grupo heterociclilo de 3 a 6 miembros" de R² y R³ incluyen preferiblemente un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un t-butilo grupo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo; un grupo haloalquilo C1-6 tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo o un grupo perfluoro-n-pentilo ; un grupo alcoxilo C1-6 tal como un grupo metoxilo, un grupo etoxilo, un grupo n-propoxilo, un grupo i-propoxilo, un grupo n-butoxilo, un grupo s-butoxilo, un grupo i-butoxilo o un grupo t-butoxilo; un grupo haloalcoxilo C1-6 tal como un grupo 2-cloro-n-propoxilo, un grupo 2,3-diclorobutoxilo o un grupo trifluorometoxilo; un grupo amino, un grupo alquilamino C1-6 tal como un grupo metilamino; un grupo alquil C1-6 carbonil amino tal como un grupo acetilamino; un grupo haloalquil C1-6 carbonil amino tal como un grupo trifluoroacetilamino; un grupo alcoxi C1-6 carbonil amino tal como un grupo terc-butoxicarbonil amino; un grupo N-(alquil C1-6)-N-(alcoxi C1-6 carbonil)amino tal como un grupo N-(metil)-N-(terc-butoxicarbonil)amino; un grupo nitro; y un grupo ciano.

45 Una sal del compuesto (II) o (III) no está particularmente limitada siempre que la sal sea una sal agrícola y hortícolamente aceptable. Los ejemplos de la sal incluyen una sal de un ácido inorgánico tal como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; una sal de un ácido orgánico tal como ácido acético o ácido láctico; una sal de un metal alcalino tal como litio, sodio o potasio; una sal de un metal alcalinotérreo tal como calcio o magnesio; una sal de un metal de transición tal como hierro o cobre; una sal de una base orgánica tal como amoníaco, trietilamina, tributilamina, piridina o hidrazina; y similares.

50 El compuesto (II) o (III) o una sal del mismo no está particularmente limitado por el método de preparación del mismo. Por ejemplo, el compuesto (II) o (III) o la sal del mismo puede obtenerse por medio del método de preparación bien conocido descrito en los ejemplos de trabajo. Además, la sal del compuesto (II) o (III) puede producirse a partir del compuesto (II) o (III) por medio de un método bien conocido.

[Compuesto representado por la Fórmula (II)]

El compuesto de diaril-azol de la presente invención es un compuesto representado por la Fórmula (II).



En la Fórmula (II), R¹ es un grupo alquiltio C1-6 o un grupo alquilsulfonilo C1-6, y es preferiblemente un grupo etilsulfonilo.

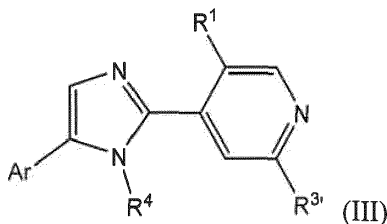
5 En la Fórmula (II), R³ es un átomo de hidrógeno, o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido, preferiblemente un grupo triazol sustituido o no sustituido, o un grupo pirimidilo, y en particular, preferiblemente un grupo pirimidilo.

En la Fórmula (II), R⁴ es un grupo alquilo C1-6, y preferiblemente un grupo metilo.

10 En la Fórmula (II), Ar es un grupo fenilo sustituido o no sustituido, o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido. Es preferible un grupo fenilo sustituido con un grupo haloalquilo C1-6 (preferiblemente un grupo trifluorometilo o un grupo pentafluorometilo), un grupo fenilo sustituido con un grupo haloalcoxilo C1-6 (preferiblemente un grupo trifluorometoxilo), un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido con un grupo haloalquilo C1-6 (preferiblemente un grupo trifluorometilo o un grupo pentafluoroetilo).

[Compuesto representado por la Fórmula (III)]

15 El compuesto de diaril-azol de la presente invención es alternativamente un compuesto representado por la Fórmula (III).



En la Fórmula (III), R¹ es un grupo alquilsulfonilo C1-6, y preferiblemente un grupo etilsulfonilo.

En la Fórmula (III), R^{3'} es un grupo hidroxilo, un grupo alcoxilo C1-6 o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros, sustituido o no sustituido.

20 En la Fórmula (III), R⁴ es un grupo alquilo C1-6, y más preferiblemente un grupo metilo.

En la Fórmula (III), Ar es un grupo fenilo sustituido o no sustituido. Es preferible un grupo fenilo sustituido con un grupo haloalcoxilo C1-6 (preferiblemente un grupo trifluorometoxilo).

El compuesto de diaril-azol de la presente invención tiene un efecto superior para controlar organismos nocivos tales como diversas plagas agrícolas que afectan el crecimiento de las plantas, y ácaros.

25 Además, el compuesto de diaril-azol de la presente invención tiene fitotoxicidad reducida frente a plantas y tiene un bajo nivel de toxicidad frente a peces o animales de sangre caliente, y por esta razón, el compuesto de diaril-azol de la presente invención es un compuesto con alta seguridad. Por lo tanto, el compuesto de la presente invención es útil como principio activo de un pesticida o un acaricida.

30 Además, en los últimos años, muchas plagas tales como palomillas dorso de diamante, fulgomorfos, cicadélidos y pulgones han desarrollado resistencia a diversos tipos de agroquímicos convencionales, y por esta razón, se presenta un problema en el que la eficacia de los agroquímicos convencionales se ha vuelto insuficiente. Por lo tanto, se desean agroquímicos que sean eficaces incluso para las cepas resistentes de plagas. Los compuestos de diaril-azol de la presente invención muestran efectos superiores para controlar no sólo las cepas sensibles de plagas, sino también diversas cepas resistentes de plagas y cepas de ácaros resistentes a los acaricidas.

35 Los compuestos de diaril-azol de la presente invención tienen un efecto superior para controlar los ectoparásitos y endoparásitos nocivos para humanos y animales. Además, los compuestos de diaril-azol de la presente invención tienen un bajo nivel de toxicidad para los peces o animales de sangre caliente y, por esta razón, los compuestos de diaril-azol son compuestos muy seguros. Por lo tanto, los compuestos de diaril-azol de la presente invención son útiles como principio activo de una formulación para controlar ectoparásitos y endoparásitos.

Además, los compuestos de diaril-azol de la presente invención son eficaces para controlar los organismos diana en cualquier fase de desarrollo y muestran efectos superiores para controlar, por ejemplo, ácaros e insectos en las fases de huevos, ninfas, larvas, pupas y adultos.

[Formulación para el control de organismos nocivos, insecticida o acaricida]

5 La formulación para controlar organismos nocivos, insecticida o acaricida de la presente invención contiene al menos un compuesto seleccionado de los compuestos de diaril-azol de la presente invención como principio activo. La cantidad del compuesto de diaril-azol contenido en la formulación para controlar organismos nocivos, insecticida o acaricida de la presente invención no está particularmente limitada siempre que se muestre un efecto de control de organismos nocivos.

10 La formulación para el control de organismos nocivos, insecticida o acaricida de la presente invención se utiliza preferentemente para cultivos; hortalizas; raíces comestibles; cultivos de tubérculos; flores; árboles frutales; árboles de té, café, cacao o plantas de follaje; hierbas para pastos; hierbas para césped; plantas tales como algodón; o similares.

15 En cuanto a la aplicación a las plantas, la formulación para el control de organismos nocivos, insecticida o acaricida de la presente invención puede aplicarse sobre cualquier parte de las plantas, tal como hoja, pedúnculo, tallo, flor, capullo, fruto, semilla, brote, raíz, tubérculo, raíz tuberosa, rama, esqueje y similares.

Además, las variedades de plantas para las que es aplicable la formulación para controlar organismos nocivos, insecticida o acaricida de la presente invención no están particularmente limitadas. Los ejemplos de las variedades vegetales incluyen los originales, variedades, variedades mejoradas, variedades cultivadas, plantas mutantes, plantas híbridas, organismos genéticamente modificados (GMO) y similares.

20 Las formulaciones para controlar organismos nocivos de la presente invención pueden usarse para controlar diversas plagas agrícolas y ácaros mediante tratamiento de semillas, pulverización foliar, aplicación al suelo o aplicación superficial del agua y similares.

A continuación se muestran ejemplos específicos de las diversas plagas agrícolas y ácaros que pueden controlarse mediante las formulaciones para controlar organismos nocivos de la presente invención.

25 (1) Lepidópteros mariposas y polillas

(a) polillas *Arctiidae*, por ejemplo, *Hyphantria cunea* y *Lemyra imparilis*;

(b) polillas *Bucculatricidae*, por ejemplo, *Bucculatrix pyrivorella*;

(c) *Carposinidae*, por ejemplo, *Carposina sasakii*;

30 (d) polillas *Crambidae*, por ejemplo, *Diaphania indica* y *Diaphania nitidalis* de *Diaphania spp.*; *Ostrinia furnacalis*, *Ostrinia nubilalis* y *Ostrinia scapularis* de *Ostrinia spp.*; y otras tales como *Chilo suppressalis*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Conogethes punctiferalis*, *Diatraea grandiosella*, *Glyphodes pyloalis*, *Hellula undalis* y *Parapediasia teterrella*;

(e) polillas *Gelechiidae*, por ejemplo, *Helcystogramma triannutella*, *Pectinophora gossypiella*, *Phthorimaea operculella* y *Sitotroga cerealella*;

35 (f) polillas *Geometridae*, por ejemplo, *Ascotis selenaria*;

(g) polillas *Gracillariidae*, por ejemplo, *Caloptilia theivora*, *Phyllocnistis citrella* y *Phyllonorycter ringoniella*;

(h) mariposas *Hesperiidae*, por ejemplo, *Parnara guttata*;

(i) polillas *Lasiocampidae*, por ejemplo, *Malacosoma neustria*;

40 (j) polillas *Lymantriidae*, por ejemplo, *Lymantria dispar* y *Lymantria monacha* de *Lymantria spp.*; y otras tales como *Euproctis pseudoconspersa* y *Orgyia thyellina*;

(k) polillas *Lyonetiidae*, por ejemplo, *Lyonetia clerkella* y *Lyonetia prunifoliella malinella* de *Lyonetia spp.*;

45 (l) polillas *Noctuidae*, por ejemplo, *Spodoptera depravata*, *Spodoptera eridania*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis* y *Spodoptera litura* de *Spodoptera spp.*; *Autographa gamma* y *Autographa nigrisigna* de *Autographa spp.*; *Agrotis ipsilon* y *Agrotis segetum* de *Agrotis spp.*; *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa assulta* y *Helicoverpa zea* de *Helicoverpa spp.*; *Heliothis armigera* y *Heliothis virescens* de *Heliothis spp.*; y otras tales como *Aedia leucomelas*, *Ctenoplusia agnata*, *Eudocima tyrannus*, *Mamestra brassicae*, *Mythimna separata*, *Naranga aenescens*, *Panolis japonica*, *Peridroma saucia*, *Pseudoplusia includens* y *Trichoplusia ni*;

(m) polillas *Nolidae*, por ejemplo, *Earias insulana*;

- (n) mariposas *Pieridae*, por ejemplo, *Pieris brassicae* y *Pieris rapae crucivora* de *Pieris* spp.;
- (o) polillas *Plutellidae*, por ejemplo, *Acrolepiopsis sapporensis* y *Acrolepiopsis suzukiella* de *Acrolepiopsis* spp.; y otras como *Plutella xylostella*;
- 5 (p) polillas *Pyrallidae*, por ejemplo, *Cadra cautella*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Etiella zinckenella* y *Galleria mellonella*;
- (q) polillas *Sphingidae*, por ejemplo, *Manduca quinquemaculata* y *Manduca sexta* de *Manduca* spp.;
- (r) polillas *Stathmopodidae*, por ejemplo, *Stathmopoda masinissa*;
- (s) polillas *Tineidae*, por ejemplo, *Tinea translucens*;
- 10 (t) polillas *Tortricidae*, por ejemplo, *Adoxophyes honmai* y *Adoxophyes orana* de *Adoxophyes* spp.; *Archips breviplicanus* y *Archips fuscocupreanus* de *Archips* spp.; y otras tales como *Choristoneura fumiferana*, *Cydia pomonella*, *Eupoecilia ambiguella*, *Grapholitha molesta*, *Homona magnanima*, *Leguminivora glicinivorella*, *Lobesia botrana*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Pandemis heparana* y *Sparganothis pilleriana*; y
- (u) Polillas *Yponomeutidae*, por ejemplo, *Argyresthia conjugella*.
- 15 (2) Plagas de insectos tisanópteros
- (a) *Phlaeothripidae*, por ejemplo, *Ponticulothrips diospyrosi*; y
- (b) *Thripidae*, por ejemplo, *Frankliniella intonsa* y *Frankliniella occidentalis* de *Frankliniella* spp.; *Thrips palmi* y *Thrips tabaci* de *Thrips* spp.; y otras tales como *Heliothrips haemorrhoidalis* y *Scirtothrips dorsalis*.
- (3) Plagas de insectos hemípteros
- 20 (A) *Arqueorrhyncha*
- (a) *Delphacidae*, por ejemplo, *Laodelphax striatella*, *Nilaparvata lugens*, *Perkinsiella saccharicida* y *Sogatella furcifera*.
- (B) *Clypeorrhyncha*
- 25 (a) *Cicadellidae*, por ejemplo, *Empoasca fabae*, *Empoasca nipponica*, *Empoasca onukii* y *Empoasca sakaii* de *Empoasca* spp.; y otras tales como *Arboridia apicalis*, *Balclutha saltuella*, *Epiacanthus stramineus*, *Macrosteles striifrons* y *Nephotettix cincticeps*.
- (C) Heterópteros
- (a) *Alydidae*, por ejemplo, *Riptortus clavatus*;
- (b) *Coreidae*, por ejemplo, *Cletus punctiger* y *Leptocorisa chinensis*;
- 30 (c) *Lygaeidae*, por ejemplo, *Blissus leucopterus*, *Cavelerius saccharivorus* y *Togo hemipterus*;
- (d) *Miridae*, por ejemplo, *Halticus insularis*, *Lygus lineolaris*, *Psuedatomoscelis seriatus*, *Stenodema sibiricum*, *Stenotus rubrovittatus* y *Trigonotylus caelestialium*;
- (e) *Pentatomidae*, por ejemplo, *Nezara antennata* y *Nezara viridula* de *Nezara* spp.; *Eysarcoris aeneus*, *Eysarcoris lewisi* y *Eysarcoris ventralis* de *Eysarcoris* spp.; y otras tales como *Dolycoris baccarum*, *Eurydema rugosum*, *Glaucias subpunctatus*, *Halyomorpha halys*, *Piezodorus hybneri*, *Plautia crossota* y *Scotinophora lurida*;
- 35 (f) *Pyrrhocoridae*, por ejemplo, *Dysdercus cingulatus*;
- (g) *Rhopalidae*, por ejemplo, *Rhopalus msculatus*;
- (h) *Scutelleridae*, por ejemplo, *Eurygaster integriceps*; y
- 40 (i) *Tingidae*, por ejemplo, *Stephanitis nashi*.
- (D) *Sternorrhyncha*
- (a) *Adelgidae*, por ejemplo, *Adelges laricis*;
- (b) *Aleyrodidae*, por ejemplo, *Bemisia argentifolii* y *Bemisia tabaci* de *Bemisia* spp.; y otras tales

como *Aleurocanthus spiniferus*, *Dialeurodes citri* y *Trialeurodes vaporariorum*;

(c) *Aphididae*, por ejemplo, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis gossypii*, *Aphis pomi*, *Aphis sambuci* y *Aphis spiraecola* de *Aphis spp.*; *Rhopalosiphum maidis* y *Rhopalosiphum padi* de *Rhopalosiphum spp.*; *Dysaphis plantaginea* y *Dysaphis radicola* de *Dysaphis spp.*; *Macrosiphum avenae* y *Macrosiphum euphorbiae* de *Macrosiphum spp.*; *Myzus cerasi*, *Myzus persicae* y variantes de *Myzus* de *Myzus spp.*; y otros tales como *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brevicoryne brassicae*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Lipaphis erysimi*, *Megoura viciae*, *Metopolophium dirhodum*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Phorodon humuli*, *Schizaphis graminum*, *Sitobion avenae* y *Toxoptera*;

(d) *Coccidae*, por ejemplo, *Ceroplastes ceriferus* y *Ceroplastes rubens* de *Ceroplastes spp.*;

(e) *Diaspididae*, por ejemplo, *Pseudaulacaspis pentagona* y *Pseudaulacaspis prunicola* de *Pseudaulacaspis spp.*; *Unaspis euonymi* y *Unaspis yanonensis* de *Unaspis spp.*; y otros tales como *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis pemiciosa*, *Fiorinia theae* y *Pseudaonidia paeoniae*;

(f) *Margarodidae*, por ejemplo, *Drosicha corpulenta* e *Icerya purchasi*;

(g) *Phylloxeridae*, por ejemplo, *Viteus vitifolii*;

(h) *Pseudococcidae*, por ejemplo, *Planococcus citri* y *Planococcus kuraunhae* de *Planococcus spp.*; y otros tales como *Phenacoccus solani* y *Pseudococcus comstocki*; y

(i) *Psyllidae*, por ejemplo, *Psylla mali* y *Psylla pyrisuga* de *Psylla spp.*; y otros tales como *Diaphorina citri*.

(4) Plagas de insectos polífagos

(a) *Anobiidae*, por ejemplo, *Lasioderma serricorne*;

(b) *Attelabidae*, por ejemplo, *Byctiscus betulae* y *Rhynchites heros*;

(c) *Bostrichidae*, por ejemplo, *Lyctus brunneus*;

(d) *Brentidae*, por ejemplo, *Cylas formicarius*;

(e) *Buprestidae*, por ejemplo, *Agrilus sinuatus*;

(f) *Cerambycidae*, por ejemplo, *Anoplophora malasiaca*, *Monochamus alternatus*, *Psacothea hilaris* y *Xylotrechus pyrrhoderus*;

(g) *Chrysomelidae*, por ejemplo, *Bruchus pisorum* y *Bruchus rufimanus* de *Bruchus spp.*; *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata* y *Diabrotica virgifera* de *Diabrotica spp.*; *Phyllotreta nemorum* y *Phyllotreta striolata* de *Phyllotreta spp.*; y otros tales como *Aulacophora femoralis*, *Callosobruchus chinensis*, *Cassida nebulosa*, *Chaetocnema concinna*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Oulema oryzae* y *Psylliodes angusticollis*;

(h) *Coccinellidae*, por ejemplo, *Epilachna varivestis* y *Epilachna vigintioctopunctata* de *Epilachna spp.*;

(i) *Curculionidae*, por ejemplo, *Anthonomus grandis* y *Anthonomus pomorum* de *Anthonomus spp.*; *Sitophilus granarius* de *Sitophilus zeamais* de *Sitophilus spp.*; y otros tales como *Echinocnemus squameus*, *Euscepes postfasciatus*, *Hylobius abietis*, *Hypera postica*, *Lissohoptrus oryzaophilus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Sitona lineatus* y *Sphenophorus venatus*;

(j) *Elateridae*, por ejemplo, *Melanotus fortnumi* y *Melanotus tamsuyensis* de *Melanotus spp.*;

(k) *Nitidulidae*, por ejemplo, *Epuraea domina*;

(l) *Scarabaeidae*, por ejemplo, *Anomala cuprea* y *Anomala rufocuprea* de *Anomala spp.*; y otros tales como *Cetonia aurata*, *Gametis jucunda*, *Heptophylla picea*, *Melolontha melolontha* y *Popillia japonica*;

(m) *Scolytidae*, por ejemplo, *Ips typographus*;

(n) *Staphylinidae*, por ejemplo, *Paederus fuscipes*;

(o) *Tenebrionidae*, por ejemplo, *Tenebrio molitor* y *Tribolium castaneum*; y

(p) *Trogossitidae*, por ejemplo, *Tenebroides mauritanicus*.

(5) Plagas de insectos dípteros

(A) Braquíceros

- 5 (a) *Agromyzidae*, por ejemplo, *Liriomyza bryoniae*, *Liriomyza chinensis*, *Liriomyza sativae* y *Liriomyza trifolii* de *Liriomyza spp.*; y otras tales como *Chromatomyia horticola* y *Agromyza oryzae*;
- (b) *Anthomyiidae*, por ejemplo, *Delia platura* y *Delia radicum* de *Delia spp.*; y otras tales como *Pegomya cunicularia*;
- 10 (c) *Drosophilidae*, por ejemplo, *Drosophila melanogaster* y *Drosophila suzukii* de *Drosophila spp.*;
- (d) *Ephydriidae*, por ejemplo, *Hydrellia griseola*;
- (e) *Psilidae*, por ejemplo, *Psila rosae*; y
- (f) *Tephritidae*, por ejemplo, *Bactrocera cucurbitae* y *Bactrocera dorsalis* de *Bactrocera spp.*; *Rhagoletis cerasi* y *Rhagoletis pomonella* de *Rhagoletis spp.*; y otras tales como *Ceratitidis capitata* y *Dacus oleae*.

15 (B) Nematóceros

- (a) *Cecidomyiidae*, por ejemplo, *Asphondylia yushimai*, *Contarinia sorghicola*, *Mayetiola destructor* y *Sitodiplosis mosellana*.

(6) Plagas de insectos ortópteros

- 20 (a) *Acrididae*, por ejemplo, *Schistocerca americana* y *Schistocerca gregaria* de *Schistocerca spp.*; y otras tales como *Chortoicetes terminifera*, *Doclostaurus maroccanus*, *Locusta migratoria*, *Locustana pardalina*, *Nomadacris septemfasciata* y *Oxya yezoensis*;
- (b) *Gryllidae*, por ejemplo, *Acheta domestica* y *Teleogryllus emma*;
- (c) *Gryllotalpidae*, por ejemplo, *Gryllotalpa orientalis*; y
- (d) *Tettigoniidae*, por ejemplo, *Tachycines asynamorus*.

25 (7) Ácaros

(A) Acaridida de *Astigmata*

- (a) ácaros *Acaridae*, por ejemplo, *Rhizoglyphus echinopus* y *Rhizoglyphus robini* de *Rhizoglyphus spp.*; *Tyrophagus neiswanderi*, *Tyrophagus pemiciosus*, *Tyrophagus putrescentiae* y *Tyrophagus similis* de *Tyrophagus spp.*; y otros tales como *Acarus siro*, *Aleuroglyphus ovatus* y *Mycetoglyphus fungivorus*;

30 (B) *Actinedida* de *Prostigmata*

- 35 (a) ácaros *Tetranychidae*, por ejemplo, *Bryobia praetiosa* y *Bryobia rubrioculus* de *Bryobia spp.*; *Eotetranychus asiaticus*, *Eotetranychus boreus*, *Eotetranychus celtis*, *Eotetranychus geniculatus*, *Eotetranychus kankitus*, *Eotetranychus pruni*, *Eotetranychus shii*, *Eotetranychus smithi*, *Eotetranychus suginamensis* y *Eotetranychus uncutus* de *Eotetranychus spp.*; *Oligonychus hondoensis*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus karamatus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus orthius*, *Oligonychus perseae*, *Oligonychus pustulosus*, *Oligonychus shinkajii* y *Oligonychus ununguis* de *Oligonychus spp.*; *Panonychus citri*, *Panonychus mori* y *Panonychus ulmi* de *Panonychus spp.*; *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus ludeni*, *Tetranychus quercivorus*, *Tetranychus phaselus*, *Tetranychus urticae* y *Tetranychus viennensis* de *Tetranychus spp.*; *Aponychus corpuzae* y *Aponychus firmianae* de *Aponychus spp.*; *Sasanychus akitanus* y *Sasanychus pusillus* de *Sasanychus spp.*; *Shizotetranychus celarius*, *Shizotetranychus longus*, *Shizotetranychus miscanthi*, *Shizotetranychus recki* y *Shizotetranychus schizopus* de *Shizotetranychus spp.*; y otros tales como *Tetranychina harti*, *Tuckerella pavoniformis* y *Yezonychus sapporensis*;
- 40 (b) ácaros *Tenuipalpidae*, por ejemplo, *Brevipalpus lewisi*, *Brevipalpus obovatus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Brevipalpus russulus* y *Brevipalpus californicus* de *Brevipalpus spp.*; *Tenuipalpus pacificus* y *Tenuipalpus zhizhilashviliae* de *Tenuipalpus spp.*; y otros tales como *Dolichotetranychus floridanus*;
- 45 (c) ácaros *Eriophyidae*, por ejemplo, *Aceria diospyri*, *Aceria ficus*, *Aceria japonica*, *Aceria kuko*,

Aceria paradianthi, *Aceria tiyingi*, *Aceria tulipae* y *Aceria zoysiea* de *Aceria spp.*; *Eriophyes chibaensis* y *Eriophyes emarginatae* de *Eriophyes spp.*; *Aculops lycopersici* y *Aculops pelekassi* de *Aculops spp.*; *Aculus fockeui* y *Aculus schlechtendali* de *Aculus spp.*; y otros tales como *Acaphylla theavagrans*, *Calacarus carinatus*, *Colomerus vitis*, *Calepitrimerus vitis*, *Epitrimerus pyri*, *Paraphytoptus kikus*, *Paracalacarus podocarpi* y *Phyllocotruta citri*;

(d) ácaros *Tarsonemidae* (ácaros *Transemidae*), por ejemplo, *Tarsonemus bilobatus* y *Tarsonemus waitei* de *Tarsonemus spp.*; y otros tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; y

(e) ácaros *Penthaleidae*, por ejemplo, *Penthaleus erythrocephalus* y *Penthaleus major* de *Penthaleus spp.*

La formulación para el control de organismos nocivos de la presente invención puede mezclarse o usarse en combinación con otros componentes activos tales como fungicidas, insecticidas/acaricidas, nematocidas y pesticidas de suelo; y/o reguladores vegetales, herbicidas, sinergistas, fertilizantes, acondicionadores de suelos y alimentos para animales.

Puede esperarse que las combinaciones del compuesto de la presente invención con otros componentes activos proporcionen efectos sinérgicos en términos de actividad insecticida/acaricida/nematicida. El efecto sinérgico puede confirmarse de acuerdo con un método convencional por medio de una ecuación definida por Colby (Colby, S. R.; Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations; Weeds, 15, páginas 20 - 22, 1967).

A continuación se describen ejemplos de insecticidas/acaricidas, nematocidas, pesticidas de suelo, parasiticidas y similares que pueden mezclarse o usarse junto con la formulación para controlar organismos nocivos según la presente invención.

(1) Inhibidor de la acetilcolinesterasa:

(a) Agentes a base de carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, ethiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocab, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC, xilicarb; fenotiocarb, MIPC, MPMC, MTMC, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, bufencarb, cloetocarb, metam-sodio, promecarb;

(b) Agentes orgánicos a base de fósforo: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrothion, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, isocarbofos, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetanfos, piraclofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirifos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclofón, vamidotion; bromofos-etilo, BRP, carbofenotion, cianofenfos, CYAP, demeton-S-metil sulfona, dialifos, diclofention, dioxabenzofos, etrinfos, fensulfotion, flupirazofos, fonofos, formotion, fosmetilano, isazofos, jodfenfos, metacrifos, pirimifos-etilo, fosfocarb, propafos, protoato, sulfofos.

(2) Antagonista de canal de iones cloruro activado por GABA: acetoprol, clordano, endosulfán, etiprol, fipronil, pirafloprol, pipiprol; canfecloro, heptacloro, dienocloro.

(3) Modulador de canales de sodio: acrinatrina, d-cis-trans-aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopentil isómero, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, β-ciflutrina, cihalotrina, λ-cihalotrina, γ-cihalotrina, cipermetrina, α-cipermetrina, β-cipermetrina, θ-cipermetrina, ξ-cipermetrina, cifenotrina [isómero (1R)-trans], δ-metrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrin, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretro, resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina [isómero (1R)], tralometrina, transflutrina; aletrina, piretrina, piretrina I, piretrina II, proflutrina, dimeflutrina, bioetanometrina, biopermetrina, transpermetrina, fenflutrina, fenpiritrina, flubrocitrinato, flufenprox, metoflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, teraletrina.

(4) Agonista del receptor nicotínico de acetilcolina: acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, nitiazina, tiacloprida, tiametoxam, sulfoxaflor, nicotina, flupiradifurona.

(5) Modulador alostérico del receptor nicotínico de acetilcolina: Spinetoram, spinosad.

(7) Sustancias similares a las hormonas juveniles: hidropreno, kinopreno, metopreno, fenoxicarb, piriproxifeno, diofenolano, epofenonano, tripreno.

(8) Otro inhibidor no específico: bromuro de metilo, cloropicrina, fluoruro de sulfurilo, bórax, tártaro emético.

(9) Antialimentario selectivo de homópteros: flonicamida, pimetrozina, pirifluquinazona.

ES 2 913 985 T3

- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezina, diflovidazina, hexitiazox, etoxazol.
- (11) Agente disruptor de la membrana interna del intestino medio de insectos derivado de microorganismos: *Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*, *Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, proteína de cultivo Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/Cry35Ab1.
- (12) Inhibidor de la enzima de la biosíntesis de ATP mitocondrial: diafentiurón, azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina, propargita, tetradifon.
- (13) Desacoplador de fosforilación oxidativa: clorfenapir, sulfuramida, DNOC; binapacril, dinobuton, dinocap.
- (14) Bloqueador del canal del receptor nicotínico de acetilcolina: bentsultap, clorhidrato de cartap; nereistoxina; tiosultap-sodio, tiociclam.
- (15) Inhibidores de la síntesis de quitina: bistriflurona, clorfluazurona, diflubenzurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona, triflumurona, buprofezina, fluazurona.
- (16) Disruptor de muda de dípteros: ciromazina.
- (17) Agonista del receptor de la hormona de la muda: cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida.
- (18) Agonista del receptor de octopamina: amitraz, demiditraz, clordimeformo.
- (19) Inhibidor de complejo III de la cadena de transferencia de electrones mitocondrial: acequinocilo, fluacripirim, hidrametilnona.
- (20) Inhibidor de complejo I de la cadena de transferencia de electrones mitocondrial: fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad, rotenona.
- (21) Bloqueadores de canales de sodio dependientes de voltaje: indoxacarb, metaflumizona.
- (22) Inhibidor de la acetil CoA carboxilasa: espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat.
- (23) Inhibidor del complejo IV de la cadena de transferencia de electrones mitocondrial: fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina, fosfuro de zinc, cianuro.
- (24) Inhibidor del complejo II de la cadena de transferencia de electrones mitocondrial: cienopirafeno, ciflumetofeno, piflubumida.
- (25) Modulador del receptor de rianodina: clorantraniliprol, cyantraniliprol, flubendiamida, ciclaniliprol, tetraniliprol.
- (26) Compuesto inhibidor de la oxidasa de función mixta: butóxido de piperonilo.
- (27) Agonista del receptor de latrofilina: depsipéptido, ciclodepsipéptido, ciclodepsipéptido de 24 miembros, emodepsida.
- (28) Otros (se desconoce el mecanismo de acción): azadiractina, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, criolita, dicofol, piridililo; benclotiaz, azufre, amidoflomet, 1,3-dicloropropeno, DCIP, fenisobromolato, benzomato, metaldehído, clorobencilato, clortiazoben, diciclanil, fenoxacrim, fentripanilo, flubencimina, flufenazina, gosiplure, japonilure, metoxadiazona, aceite, oleato de potasio, tetrasul; triaraten; afidopiropeno, flometoquina, flufiprol, fluensulfona, meperflutrina, tetrametilflutrina, tralopirilo, dimeflutrina, metilneodecanamida; fluralaner, afoxolaner, fluxametamida, 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (CAS: 943137-49-3), broflanilida, otras meta-diamidas.
- (29) Parasitocida:
- (a) Agentes a base de bencimidazol: fenbendazol, albendazol, triclabendazol, oxibendazol, mebendazol, oxfendazol, parbendazol, flubendazol; febantel, netobimina, tiofanato; tiabendazol, cambendazol;
- (b) Agentes a base de salicilanilida: closantel, oxiclozanida, rafoxanida, niclosamida;
- (c) Agentes a base de fenol sustituido: nitroxinil, nitroscanato;
- (d) Agentes a base de piridina: pirantel, morantel;
- (e) Agentes a base de imidazotiazol: levamisol, tetramisol;
- (f) Agentes a base de tetrahidropirimidina: praziquantel, epsiprantel;
- (g) Otros agentes antiparasitarios: ciclodieno, ryania, clorsulon, metronidazol, demiditraz; piperazina, dietil carbamazina, diclorofeno, monepantel, tribendimidina, amidantel; tiacetarsamida, melarsomina, arsenamida.

A continuación se describen ejemplos específicos de los fungicidas que pueden mezclarse o usarse junto con la formulación para controlar organismos nocivos según la presente invención.

- (1) Inhibidor de la biosíntesis de ácidos nucleicos:
- 5 (a) inhibidor de la ARN polimerasa I: benalaxil, benalaxil-M, furalaxil, metalaxil, metalaxil-M, oxadixil; clozilacon, ofurace;
- (b) inhibidor de la adenosina desaminasa: bupirimato, dimetirimol, etirimol;
- (c) inhibidor de la síntesis de ADN/ARN: himexazol, octilinona;
- (d) inhibidor de la ADN topoisomerasa II: ácido oxolínico;
- (2) Inhibidor de la cariocinesis e inhibidor de la división celular:
- 10 (a) Inhibidor de la polimerización de β -tubulina: benomilo, carbendazima, clorfenazol, fuberidazol, tiabendazol; tiofanato, tiofanato-metilo; dietofencarb; zoxamida; etaboxam;
- (b) Inhibidor de la división celular: pencicuron;
- (c) Inhibidor de la deslocalización de proteína similar a espectrina: fluopicolida;
- (3) Inhibidores de la respiración:
- 15 (a) inhibidores de la NADH oxidorreductasa del complejo I: diflumetorim y tolfenpirad;
- (b) inhibidores de la deshidrogenasa del ácido succínico del complejo II: benodanil, flutolanil, mepronil; isofetamida, fluopiram; fenfuram, furmeciclo; carboxina, oxicarboxina; tifulzamida; benzovindiflupir, bixafeno, fluxaproxad, furametpir, isopirazam, penflufeno, pentiopirad, sedaxano; y boscalida;
- 20 (c) inhibidores Qo de la ubiquinol oxidasa del complejo III: azoxistrobina, coumoxistrobina, cumetoxistrobina, enoxastrobina, flufenoxistrobina, picoxistrobina, piraoxistrobina; piraclostrobina, pirametostrobina, triclopiricarb; kresoxim-metilo, trifloxistrobina; dimoxistrobina, fenaministrobina, metominostrobin, orisastrobina; famoxadona; fluoxastrobina; fenamidona; y piribencarb;
- (d) inhibidores de Qi de la ubiquinol reductasa del complejo III: ciazofamida y amisulbrom;
- 25 (e) agentes de desacoplamiento de la fosforilación oxidativa: binapacril, meptildinocap, dinocap; fluazinam; y ferimzona;
- (f) inhibidores de la fosforilación oxidativa (inhibidores de la ATP sintasa): acetato de fentina, cloruro de fentina e hidróxido de fentina;
- (g) inhibidor de la producción de ATP: siltiofam; y
- (h) inhibidor Qx (desconocido) del citocromo bcl (ubiquinona reductasa) del complejo III: ametotradina;
- 30 (4) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas
- (a) Inhibidores de la biosíntesis de metionina: andoprim, ciprodinil, mepanipirim y pirimetanil; y
- (b) Inhibidores de la síntesis de proteínas: blasticidina S; kasugamicina; clorhidrato de kasugamicina; estreptomycin; y oxitetraciclina.
- (5) Inhibidores de la transducción de señales:
- 35 (a) inhibidores de la transducción de señales: quinoxifeno y proquinazida; y
- (b) inhibidores de MAP/histidina quinasa en la transducción de señales de presión osmótica: fenpiclonil, fludioxonil; clozolinato, iprodiona, procimidona y vinclozolina.
- (6) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana celular:
- 40 (a) inhibidores de metiltransferasa y biosíntesis de fosfolípidos: edifenfos, iprobenfos, pirazofos; e isoprotiolano;
- (b) agentes de peroxidación de lípidos: bifenilo, cloroneb, diclorano, quintoceno, tecnaceno, tolclofos-metilo; y etridiazol;
- (c) agentes que actúan sobre membranas celulares: yodocarb, propamocarb, clorhidrato de

propamocarb, fosetilato de propamocarb y protiocarb;

(d) Microorganismos que alteran las membranas celulares de patógenos: *Bacillus subtilis*, cepa de *Bacillus subtilis* QST713, cepa de *Bacillus subtilis* FZB24, cepa de *Bacillus subtilis* MBI600 y cepa de *Bacillus subtilis* D747; y

5 (e) agentes que alteran las membranas celulares: extracto de *Melaleuca alternifolia* (árbol del té).

(7) Inhibidores de la biosíntesis de esteroides de la membrana celular:

(a) inhibidores de la desmetilación de la posición C14 en la biosíntesis de esteroides: triforina; pirifenox, pirisoxazol; fenarimol, flurprimidol, nuarimol; imazalilo, sulfato de imazalilo, oxpoconazol, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol;

10 azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol; protioconazol y voriconazol;

15 (b) inhibidores de $\Delta 14$ reductasa y $\Delta 8 \rightarrow \Delta 7$ isomerasa en la biosíntesis de esteroides: aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf; fenpropidina, piperalina; y espiroxamina;

(c) inhibidores de la 3-ceto reductasa en la desmetilación de la posición C4 en sistemas de biosíntesis de esteroides: fenhexamida y fenpirazamina; y

20 (d) inhibidores de la escualeno epoxidasa en sistemas de biosíntesis de esteroides: piributicarb; naftifeno y terbinafina.

(8) Inhibidores de la síntesis de la pared celular:

(a) Inhibidor de trehalasa: validamicina;

(b) Inhibidores de la quitina sintasa: polioxinas y polioxorim; y

25 (c) Inhibidores de la celulosa sintasa: dimetomorf, flumorf, pirimorf; bentiavalicarb, iprovalicarb, tolprocarb, valifenalato; y mandipropamida.

(9) Inhibidores de la biosíntesis de melanina:

(a) Inhibidores de la reductasa en la biosíntesis de melanina: ftalida; piroquilon; y triciclazol; y

(b) Inhibidores de la anhidrasa en la biosíntesis de melanina: carpropamida; diclocimet; y fenoxanilo.

(10) Agentes inductores de resistencia de plantas huésped:

30 (a) Agente que actúa sobre la ruta biosintética del ácido salicílico: acibenzolar-S-metilo; y

(b) Otros: probenazol; tiadinilo; isotianilo; laminarina; y extracto de *Reynoutria sachalinensis*.

(11) Fármacos cuyo modo de actividad no está claro: cimoxanilo, fosetil-aluminio, ácido fosfórico (fosfato), tecloftalam, triazóxido, flusulfamida, diclomezina, metasulfocarb, ciflufenamida, metrafenona, pirofenona, dodina, base libre de dodina y flutianilo.

35 (12) Agentes que tienen múltiples actividades: cobre (sales de cobre), caldo bordelés, hidróxido de cobre, naftalato de cobre, óxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, azufre, productos de azufre, polisulfuro de calcio; ferbam, mancozeb, maneb, mancopper, metiram, policarbamato, propineb, tiram, zineb, ziram; captan, captafol, folpet; clorotalonilo; diclofluanida, tolilfluanida; guazatina, triacetato de iminoctadina, trialbesilato de iminoctadina; anilazina; ditianon; quinometionato; y fluoroimida.

40 (13) Otros agentes: DBEDC, fluor-folpet, acetato de guazatina, bis(8-quinolinolato) de cobre (II), propamidina, cloropicrina, ciprofuram, *Agrobacterium*, betoxazina, difenilamina, isotiocianato de metilo (MITC), mildiomicina, capsaicina, curfraneb, ciprosulfamida, dazomet, debacarb, diclorofeno, difenzoquat, sulfonato de metilo de difenzoquat, flumetover, fosetil-calcio, fosetil-sodio, irumamicina, natamicina, nitrotal-isopropilo, oxamocarb, pupromocina sódica, pirrolnitrina, tebufloquina, tolmanifanida, zarilamida, Algophase, amicartiazol, oxatiapiprolina, metiram-zinc, bentiazol, triclamida, uniconazol, mildiomicina, oxifentina y picarbutrazox.

45

A continuación se enumeran ejemplos específicos de reguladores del crecimiento de las plantas que pueden mezclarse o usarse en combinación con el agente de control de plagas de la presente invención.

5 Ácido abscísico, cinetina, bencilaminopurina, 1,3-difenilurea, forclorfenuron, tidiazuron, clorfenuron, dihidrozeatina, giberelina A, giberelina A4, giberelina A7, giberelina A3, 1-metilciclopropano, N-acetilaminoetoxivinilglicina (nombre alternativo: aviglicina), aminooxiacetato, nitrato de plata, cloruro de cobalto, IAA, 4-CPA, cloprop, 2,4-D, MCPB, ácido indol-3-butírico, diclorprop, fenotiol, 1-naftilacetamida, etilozato, cloxifonac, hidrazida del ácido maleico, ácido 2,3,5-triyodobenzoico, ácido salicílico, salicilato de metilo, ácido (-)-jasmónico, jasmonato de metilo, (+)-estrigol, (+)-desoxistrigol, (+)-orobanchol, (+)-sorgolactona, ácido 4-oxo-4-(2-feniletil)aminobutírico; etefon, clormecuat, cloruro de mepicuat, bencil adenina y ácido 5-aminolevulínico.

[Formulación para el control de ectoparásitos]

10 La formulación para el control de ectoparásitos según la presente invención contiene al menos un compuesto seleccionado de los compuestos de diaril-azol de la presente invención como principio activo. Los compuestos de diaril-azol de la presente invención muestran efectos superiores de control de ectoparásitos que son nocivos con respecto a animales y seres humanos.

Los ejemplos de ectoparásitos incluyen ácaros, piojos, pulgas, mosquitos, moscas de los establos, moscas de la carne, y similares.

15 Los ejemplos de animales huésped para los que la formulación para controlar ectoparásitos de la presente invención incluyen animales de sangre caliente tales como mascotas tales como un perro o un gato; un pájaro mascota; un animal de granja tal como vacas, caballos, cerdos u ovejas; un ave doméstica; y similares. Además, pueden mencionarse abejas de la miel, ciervos voladores, escarabajos unicornio.

20 Los ectoparásitos viven sobre los animales huésped, viven especialmente dentro o sobre animales de sangre caliente. Más específicamente, los ectoparásitos parasitan la espalda, la axila, la parte inferior del vientre, la parte interna del muslo y similares de los animales huésped y obtienen fuentes nutricionales tales como sangre, caspa de los animales para vivir.

25 La formulación para el control de ectoparásitos de la presente invención puede aplicarse mediante un método veterinario conocido (administración tópica, oral, parenteral o subcutánea). Los ejemplos del método incluyen un método para administrar por vía oral comprimidos, cápsulas y bebidas mezcladas con la formulación para controlar ectoparásitos a los animales; un método para administrar a los animales usando un líquido de inmersión, supositorio o inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraabdominal o similar); un método para administrar por vía tópica una preparación líquida a base de aceite o acuosa mediante pulverización, vertido, manchado o similar; un método para administrar por vía tópica mediante la fijación de un collar, una marca auricular o similar hecha por moldeo de una mezcla obtenida por amasado de la formulación para el control de ectoparásitos con una resina a los animales; y similares.

30 A continuación se describen ejemplos específicos de los ectoparásitos que pueden prevenirse mediante la formulación para controlar ectoparásitos según la presente invención.

(1) Ácaros

35 Ácaros pertenecientes a la familia *Dermanyssidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Macronyssidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Laelapidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Varroidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Argasidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Ixodidae*, ácaros perteneciente a la familia *Psoroptidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Sarcoptidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Knemidokoptidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Demodixidae*, ácaros pertenecientes a la familia *Trombiculidae*, ácaros parásitos de insectos tales como *Coleopterophagus berlesei*, o similares.

(2) Orden de los ftirápteros

40 Piojos pertenecientes a la familia *Haematopinidae*, piojos pertenecientes a la familia *Linognathidae*, piojos mordedores pertenecientes a la familia *Menoponidae*, piojos mordedores pertenecientes a la familia *Philopteridae*, piojos mordedores pertenecientes a la familia *Trichodectidae*.

(3) Orden de los sifonápteros

45 Pulgas pertenecientes a la familia *Pulicidae*, por ejemplo, *Ctenocephalides canis* y *Ctenocephalides felis* de *Ctenocephalides spp.*;

Pulgas pertenecientes a la familia *Tungidae*, pulgas pertenecientes a la familia *Ceratophyllidae*, pulgas pertenecientes a la familia *Leptopsyllidae*.

(4) Orden de los hemípteros.

(5) Organismo nocivo del orden de los dípteros

50 Mosquitos pertenecientes a la familia *Culicidae*, moscas negras pertenecientes a la familia *Simuliidae*, mosquito perteneciente a la familia *Ceratopogonidae*, moscas pertenecientes a la familia *Tabanidae*, moscas pertenecientes a la familia *Muscidae*, moscas tse-tsé pertenecientes a la familia *Glossinidae*; moscas de la carne pertenecientes a la

familia *Sarcophagidae*, moscas pertenecientes a la familia *Hippoboscidae*, moscas pertenecientes a la familia *Calliphoridae*, moscas pertenecientes a la familia *Oestridae*;

[Formulación para el control de endoparásitos o parasiticida]

5 Una formulación para el control de endoparásitos o parasiticida de la presente invención contiene al menos un compuesto seleccionado de los compuestos de diaril-azol de la presente invención como principio activo.

Los parásitos a los que se dirige la formulación de control de endoparásitos o el parasiticida de la presente invención viven dentro de los cuerpos de los animales huésped, y particularmente dentro de los cuerpos de los animales de sangre caliente y los peces (es decir, endoparásitos). Los ejemplos de animales huésped para los que el agente de control de endoparásitos o parasiticida de la presente invención es eficaz incluyen animales de sangre caliente tales como seres humanos, mamíferos domésticos (por ejemplo, vacas, caballos, cerdos, ovejas y cabras y similares), animales de experimentación (por ejemplo, ratones, ratas y jerbos y similares), animales de compañía (por ejemplo, hámsteres, cobayas, perros, gatos, caballos, ardillas, conejos y hurones y similares), mamíferos salvajes y mamíferos de zoológico (por ejemplo, por ejemplo, monos, zorros, ciervos y búfalos y similares), aves domésticas (por ejemplo, pavos, patos, pollos y codornices y similares), aves de compañía (por ejemplo, palomas, loros, aves miná, pinzones de Java, periquitos, pinzones de Bengala, canarios y similares); y peces tales como salmón, trucha y carpa koi y similares. Mediante el control o exterminación de los parásitos, las enfermedades parasitarias transmitidas por los parásitos pueden prevenirse o tratarse.

Los ejemplos de parásitos que pueden controlarse o exterminarse incluyen los que se enumeran a continuación.

(1) Nematodos *Dioctophymatida*

20 (a) gusanos renales de la familia *Dioctophymatidae*, por ejemplo, *Dioctophyma renale* de *Dioctophyma spp.*; y

(b) gusanos renales de la familia *Soboliphymatidae*, por ejemplo, *Soboliphyme abei* y *Soboliphyme baturini* de *Soboliphyme spp.*

(2) Nematodos *Trichocephalida*

25 (a) gusanos *Trichina* de la familia *Trichinellidae*, por ejemplo, *Trichinella spiralis* de *Trichinella spp.*; y

(b) tricocéfalos de la familia *Trichuridae*, por ejemplo, *Capillaria annulata*, *Capillaria contorta*, *Capillaria hepatica*, *Capillaria perforans*, *Capillaria plica* y *Capillaria suis* de *Capillaria spp.*; y *Trichuris vulpis*, *Trichuris discolor*, *Trichuris ovis*, *Trichuris skrjabini* y *Trichuris suis* de *Trichuris spp.*

(3) Nematodos *Rhabditida*

30 Oxiuros de la familia *Strongyloididae*, por ejemplo, *Strongyloides papillosus*, *Strongyloides planiceps*, *Strongyloides ransomi*, *Strongyloides suis*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides tumefaciens* y *Strongyloides ratti* de *Strongyloides spp.*

(4) Nematodos *Strongylida*

35 Anquilostomas de la familia *Ancylostomatidae*, por ejemplo, *Ancylostoma braziliense*, *Ancylostoma caninum*, *Ancylostoma duodenale* y *Ancylostoma tubaeforme* de *Ancylostoma spp.*; *Uncinaria stenocephala* de *Uncinaria stenocephala*; y *Bunostomum phlebotomum* y *Bunostomum trigonocephalum* de *Bunostomum spp.*

(5) Nematodos *Strongylida*

(a) Nematodos de la familia *Angiostrongylidae*, por ejemplo, *Aelurostrongylus abstrusus* de *Aelurostrongylus spp.*; y *Angiostrongylus vasorum* y *Angiostrongylus cantonesis* de *Angiostrongylus spp.*;

40 (b) Nematodos de la familia *Crenosomatidae*, por ejemplo, *Crenosoma aerophila* y *Crenosoma vulpis* de *Crenosoma spp.*;

(c) Nematodos de la familia *Filaroididae*, por ejemplo, *Filaroides hirthei* y *Filaroides osleri* de *Filaroides spp.*;

(d) Gusanos pulmonares de la familia *Metastrongylidae*, por ejemplo, *Metastrongylus apri*, *Metastrongylus asimetricus*, *Metastrongylus pudendotectus* y *Metastrongylus salmi* de *Metastrongylus spp.*; y

45 (e) Gusanos bifurcados de la familia *Syngamidae*, por ejemplo, *Cyathostoma bronchialis* de *Cyathostoma spp.*; y *Syngamus skrjabinomorpha* y *Syngamus trachea* de *Syngamus spp.*

(6) Nematodos *Strongylida*

(a) Nematodos de la familia *Molineidae*, por ejemplo, *Nematodirus filicollis* y *Nematodirus spathiger* de

Nematodirus spp.;

(b) Nematodos de la familia *Dictyocaulidae*, por ejemplo, *Dictyocaulus filarial* y *Dictyocaulus viviparus* de *Dictyocaulus* spp.;

5 (c) Nematodos de la familia *Haemonchidae*, por ejemplo, *Haemonchus contortus* de *Haemonchus* spp.; y *Mecistocirrus digitatus* de *Mecistocirrus* spp.;

(d) Nematodos de la familia *Haemonchidae*, por ejemplo, *Ostertagia ostertagi* de *Ostertagia* spp.;

(e) Nematodos de la familia *Heligmonellidae*, por ejemplo, *Nippostrongylus braziliensis* de *Nippostrongylus* spp.; y

10 (f) Nematodos de la familia *Trichostrongylidae*, por ejemplo, *Trichostrongylus axei*, *Trichostrongylus colubriformis* y *Trichostrongylus tenuis* de *Trichostrongylus* spp.; *Hyostrongylus rubidus* de *Hyostrongylus* spp.; y *Obeliscoides cuniculi* de *Obeliscoides* spp.

(7) Nematodos *Strongylida*

15 (a) Nematodos de la familia *Chabertiidae*, por ejemplo, *Chabertia ovina* de *Chabertia* spp.; y *Oesophagostomum brevicaudatum*, *Oesophagostomum columbianum*, *Oesophagostomum dentatum*, *Oesophagostomum georgianum*, *Oesophagostomum maplestonei*, *Oesophagostomum quadrispinulatum*, *Oesophagostomum radiatum*, *Oesophagostomum venulosum* y *Oesophagostomum watanabei* de *Oesophagostomum* spp.;

(b) Nematodos de la familia *Stephanuridae*, por ejemplo, *Stephanurus dentatus* de *Stephanurus* spp.; y

20 (c) Nematodos de la familia *Strongylidae*, por ejemplo, *Strongylus asini*, *Strongylus edentatus*, *Strongylus equinus* y *Strongylus vulgaris* de *Strongylus* spp.

(8) Nematodos *Oxyurida*

Nematodos de la familia *Oxyuridae*, por ejemplo, *Enterobius antropopitheci* y *Enterobius vermicularis* de *Enterobius* spp.; *Oxyuris equi* de *Oxyuris* spp.; y *Passalurus ambiguus* de *Passalurus* spp.

(9) Nematodos *Ascaridida*

25 (a) Nematodos de la familia *Ascaridiidae*, por ejemplo, *Ascaridia galli* de *Ascaridia* spp.;

(b) Nematodos de la familia *Heterakidae*, por ejemplo, *Heterakis beramporia*, *Heterakis brevispiculum*, *Heterakis gallinarum*, *Heterakis pusilla* y *Heterakis putaustralis* de *Heterakis* spp.;

(c) Nematodos de la familia *Anisakidae*, por ejemplo, *Anisakis simplex* de *Anisakis* spp.;

30 (d) Nematodos de la familia *Ascarididae*, por ejemplo, *Ascaris lumbricoides* y *Ascaris suum* de *Ascaris* spp.; y *Parascaris equorum* de *Parascaris* spp.; y

(e) Nematodos de la familia *Toxocaridae*, por ejemplo, *Toxocara canis*, *Toxocara leonina*, *Toxocarasuum*, *Toxocara vitulorum* y *Toxocara cati* de *Toxocara* spp.

(10) Nematodos *Spirurida*

35 (a) Nematodos de la familia *Onchocercidae*, por ejemplo, *Brugia malayi*, *Brugia pahangi* y *Brugia patei* de *Brugia* spp.; *Dipetalonema reconditum* de *Dipetalonema* spp.; *Dirofilaria immitis* de *Dirofilaria* spp.; *Filaria oculi* de *Filaria* spp.; y *Onchocerca cervicalis*, *Onchocerca gibsoni* y *Onchocerca gutturosa* de *Onchocerca* spp.

(b) Nematodos de la familia *Setariidae*, por ejemplo, *Setaria digitata*, *Setaria equina*, *Setaria labiatopapillosa* y *Setaria marshalli* de *Setaria* spp.; y *Wuchereria bancrofti* de *Wuchereria* spp.; y

40 (c) Nematodos de la familia *Filariidae*, por ejemplo, *Parafilaria multipapillosa* de *Parafilaria* spp.; y *Stephanofilaria assamensis*, *Stephanofilaria dedoesi*, *Stephanofilaria kaeli*, *Stephanofilaria okinawaensis* y *Stephanofilaria stilesi* de *Stephanofilaria* spp.

(11) Nematodos *Spirurida*

45 (a) Nematodos de la familia *Gnathostomatidae*, por ejemplo, *Gnathostoma doloresi* y *Gnathostoma spinigerum* de *Gnathostoma* spp.;

(b) Nematodos de la familia *Habronematidae*, por ejemplo, *Habronema majus*, *Habronema microstoma*

y *Habronema muscae* de *Habronema spp.*; y *Draschia megastoma* de *Draschia spp.*;

(c) Nematodos de la familia *Physalopteridae*, por ejemplo, *Physaloptera canis*, *Physaloptera cesticillata*, *Physaloptera erdocyona*, *Physaloptera felidis*, *Physaloptera gemina*, *Physaloptera papilloradiata*, *Physaloptera praeputialis*, *Physaloptera pseudopraerutialis*, *Physaloptera rara*, *Physaloptera sibirica* y *Physaloptera vulpineus* de *Physaloptera spp.*;

(d) Nematodos de la familia *Gongylonematidae*, por ejemplo, *Gongylonema pulchrum* de *Gongylonema spp.*;

(e) Nematodos de la familia *Spirocercidae*, por ejemplo, *Ascarops strongylina* de *Ascarops spp.*; y

(f) Nematodos de la familia *Thelaziidae*, por ejemplo, *Thelazia callipaeda*, *Thelazia gulosa*, *Thelazia lacrymalis*, *Thelazia rhodesi* y *Thelazia skrjabini* de *Thelazia spp.*

[Formulación para el control de otros organismos nocivos]

Además, las formulaciones para controlar organismos nocivos de la presente invención muestran un efecto superior para controlar otras plagas que tienen un aguijón o veneno que puede dañar a seres humanos y animales, plagas que portan diversos patógenos/bacterias patógenas, y plagas que imparten una sensación de incomodidad a seres humanos (tales como plagas tóxicas, plagas de insectos sanitarios, plagas de insectos desagradables).

Los ejemplos específicos de los mismos se enumeran a continuación.

(1) Plagas de insectos himenópteros

Moscas de sierra de la familia *Argidae*, avispas de la familia *Cynipidae*, moscas de sierra de la familia *Diprionidae*, hormigas de la familia *Formicidae*, avispas de la familia *Mutillidae* y avispas de la familia *Vespidae*.

(2) Otras plagas de insectos

Blattodea, termitas, *Araneae*, ciempiés, milpiés, crustáceos y *Cimex lectularius*.

Ejemplos

[Ejemplos de formulación]

A continuación se describen algunos ejemplos de las formulaciones para controlar organismos nocivos, insecticidas, acaricidas, formulaciones para controlar ectoparásitos o formulaciones para controlar o expulsar endoparásitos de la presente invención. Los aditivos y las relaciones de adición no se limitan a los de los ejemplos y pueden modificarse en un amplio intervalo. El término "parte" en los ejemplos de formulación indica "parte en peso".

Los ejemplos de formulación para su uso agrícola y hortícola y para arroz con cáscara se describen a continuación.

(Formulación 1: Polvo humectable)

Se mezclaron uniformemente 40 partes de un compuesto de diaril-azol de la presente invención, 53 partes de tierra de diatomeas, 4 partes de un éster sulfúrico de alcohol superior y 3 partes de una sal de ácido sulfónico de alquilnaftaleno y se pulverizaron finamente para obtener un polvo humectable que incluía el 40% de un principio activo.

(Formulación 2: Emulsión)

Se mezclaron y disolvieron 30 partes del compuesto de diaril-azol de la presente invención, 33 partes de xileno, 30 partes de dimetilformamida y 7 partes de polioxietilen alquil aril éter para obtener una emulsión que incluía el 30% de un principio activo.

(Formulación 3: Gránulos)

Se mezclaron uniformemente 5 partes del compuesto de diaril-azol de la presente invención, 40 partes de talco, 38 partes de arcilla, 10 partes de bentonita y 7 partes de alquilsulfato de sodio y se pulverizaron finamente, seguido de granulación en una forma granular que tenía un diámetro de 0,5 a 1,0 mm para obtener gránulos que contienen el 5% de un principio activo.

(Formulación 4: Gránulos)

Se pulverizaron y mezclaron completamente 5 partes del compuesto de diaril-azol de la presente invención, 73 partes de arcilla, 20 partes de bentonita, 1 parte de dioctilsulfosuccinato sódico y 1 parte de fosfato potásico. Se le añadió agua y la mezcla se amasó bien, seguido de granulación y secado para obtener gránulos que contenían el 5% de un principio activo.

(Formulación 5: Suspensión)

5 Se mezclaron 10 partes del compuesto de diaril-azol según la presente invención, 4 partes de polioxietilen alquil alil éter, 2 partes de policarboxilato de sodio, 10 partes de glicerol, 0,2 partes de goma xantana y 73,8 partes de agua y se pulverizaron en húmedo de modo que tuvieran un tamaño de grano de 3 micrómetros o menos. De ese modo, se obtuvo una suspensión que contenía el 10% de un principio activo.

Los ejemplos de formulación de la formulación para controlar ectoparásitos, o la formulación para controlar o expulsar endoparásitos se describen a continuación.

(Formulación 6: Polvo granulado)

10 Se disolvieron 5 partes del compuesto de diaril-azol de la presente invención en un disolvente orgánico para obtener una solución. La solución mencionada anteriormente se pulverizó sobre 94 partes de caolín y 1 parte de carbón blanco, seguido de evaporación del disolvente a presión reducida. Este tipo de polvo granulado puede mezclarse con alimentos para animales.

(Formulación 7: Formulación de impregnación)

15 Se mezclaron uniformemente de 0,1 a 1 partes del compuesto de diaril-azol de la presente invención y de 99 a 99,9 partes de aceite de cacahuete, y luego se esterilizaron por filtración por medio de un filtro esterilizador.

(Formulación 8: Formulación de vertido)

Se mezclaron uniformemente 5 partes del compuesto de diaril-azol de la presente invención, 10 partes de un éster mirístico y 85 partes de isopropanol para obtener una formulación de vertido.

(Formulación 9: Formulación de aplicación puntual)

20 Se mezclaron uniformemente de 10 a 15 partes del compuesto de diaril-azol de la presente invención, 10 partes de un éster palmítico y de 75 a 80 partes de isopropanol para obtener una formulación de aplicación puntual.

(Formulación 10: Formulación de pulverización)

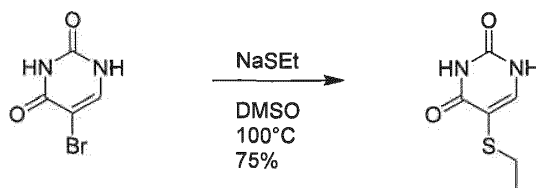
Se mezclaron uniformemente 1 parte del compuesto de diaril-azol de la presente invención, 10 partes de propilenglicol y 89 partes de isopropanol para obtener una formulación de pulverización.

25 A continuación, se describen ejemplos de compuestos para explicar la presente invención más específicamente. Debe entenderse que la presente invención no se limita a los siguientes ejemplos.

[Ejemplo 1]

Síntesis de 5-(etilsulfonil)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)-2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)pirimidina (Compuesto N.º 3)

30 (Etapa 1) Síntesis de 5-(etiltio)uracilo

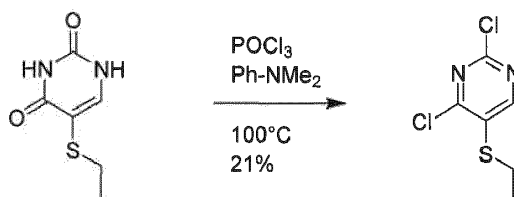


35 Se disolvió 5-bromouracilo (10 g) en dimetilsulfóxido (100 ml) y luego se agitó a temperatura ambiente. Se le añadió sal sódica de etilmercaptano (80%, 10 g) y luego se agitó durante 2 horas a 100°C. El líquido obtenido se vertió en agua a aproximadamente 5°C y se neutralizó con ácido clorhídrico diluido. Se obtuvieron cristales brutos precipitados por filtración, y el residuo obtenido se concentró a presión reducida. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 6,7 g (rendimiento 75%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 11,20 (s a, 1H), 10,47 (s a, 1H), 5,24 (s, 1H), 2,91 (q, 2H), 1,20 (t, 3H).

(Etapa 2) Síntesis de 2,4-dicloro-5-(etiltio)pirimidina

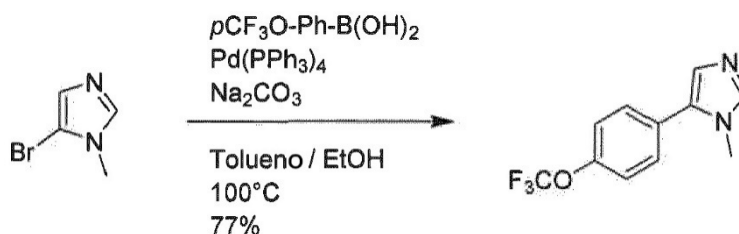


5 Se suspendió 5-(etilthio)uracilo (6,7 g) en oxiclorigeno de fósforo (20 ml) y se agitó a 0°C. Se le añadió *N,N*-dimetilanimilina (7,9 ml) y luego se agitó durante 3 horas a 100°C. El líquido obtenido se vertió en agua a aproximadamente 60°C y se agitó durante 2 horas. Posteriormente, la mezcla de reacción se sometió a extracción con diclorometano. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 1,7 g (rendimiento 21%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 8,37 (s, 1H), 3,03 (q, 2H), 1,40 (t, 3H).

10 (Etapa 3) Síntesis de 1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol

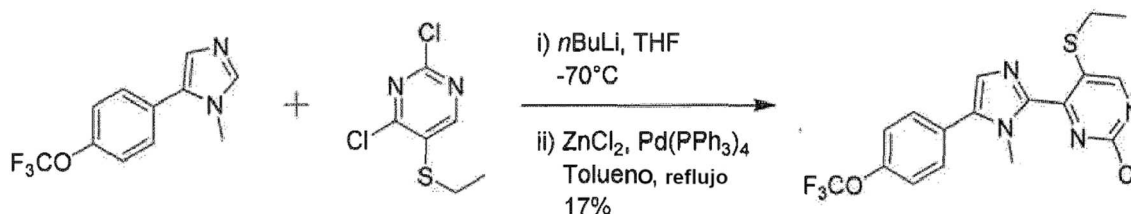


15 Se disolvió 5-bromoimidazol (5 g) en una mezcla de disolventes de tolueno (150 ml) y etanol (50 ml). Se le añadieron ácido 4-(trifluorometoxi)fenilborónico (9,6 g), tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) (3,6 g) y carbonato sódico (6,6 g). La mezcla se agitó en atmósfera de argón durante 3 horas a 100°C. El líquido resultante se añadió al agua y, posteriormente, la mezcla se sometió a extracción con acetato de etilo. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De este modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 5,8 g (rendimiento 77%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

20 ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7,54 (s, 1H), 7,42 (m, 2H), 7,30 (m, 2H), 7,16 (s, 1H), 3,68 (s, 3H).

(Etapa 4) Síntesis de 2-cloro-5-(etilthio)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)pirimidina



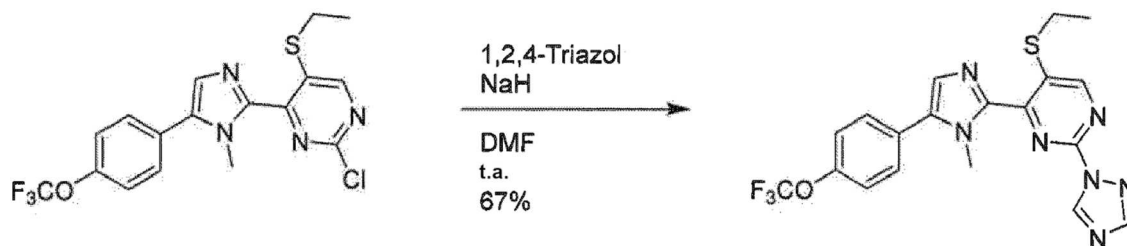
25 Se colocó tetrahidrofurano (44 ml) en un reactor y, posteriormente, se le añadió 1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol (2,0 g) y se disolvió en él. El interior del reactor de reacción se reemplazó con argón. Posteriormente, la solución se enfrió hasta -70°C. Se le añadió *n*-butillitio (2,69 M, solución de *n*-hexanal, 3,3 ml) gota a gota y luego se agitó durante 30 minutos a -70°C. Se le añadió cloruro de zinc (II) (2,2 g), y la mezcla se calentó hasta temperatura ambiente, y se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Posteriormente, se le añadieron 2,4-dicloro-5-(etilthio)pirimidina (1,7 g), tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) (0,96 g) y tolueno (44 ml), y la mezcla se agitó durante la noche con calentamiento y reflujo. Se añadió agua al líquido obtenido y la mezcla se sometió a extracción con acetato de etilo. La fase orgánica obtenida se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 0,6 g (rendimiento 17%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

35 ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ: 8,52 (1H, s), 7,50 (2H, m), 7,38 (s, 1H), 7,35 (2H, m), 3,95 (3H, s), 3,05 (2H, q), 1,44

(3H, t)

(Etapa 5) Síntesis de 5-(etiltio)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pirimidina



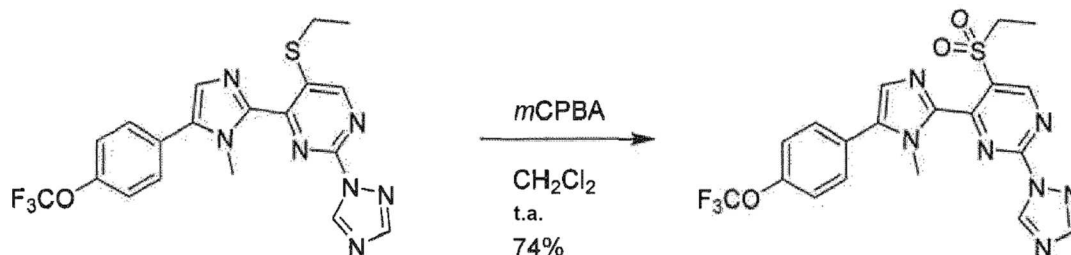
5 Se suspendió hidruro de sodio (60%, 0,044 g) en *N,N*-dimetilformamida (10 ml), y luego se agitó a 0°C. Se le añadió 1,2,4-triazol y luego se agitó durante 30 minutos a 0°C. Posteriormente, se le añadió 2-cloro-5-(etiltio)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)pirimidina (0,35 g) y luego se agitó toda la noche a temperatura ambiente. Al líquido obtenido se le añadió agua y posteriormente se realizó extracción con acetato de etilo. La fase orgánica obtenida se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante

10 cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 0,25 g (rendimiento 67%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃) δ: 9,19 (1H, s), 8,71 (1H, s), 8,19 (1H, s), 7,53 (2H, m), 7,42 (s, 1H), 7,37 (m, 2H), 4,05 (s, 3H), 3,12 (q, 2H), 1,47 (3H, t).

15 (Etapa 6) Síntesis de 5-(etilsulfonil)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pirimidina



20 Se disolvió 5-(etiltio)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pirimidina (0,20 g) en diclorometano (5 ml) y luego se agitó a 0°C. Se le añadió ácido meta-cloroperbenzoico (70%, 0,24 g) y luego se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El líquido obtenido se añadió a una mezcla líquida de una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y una solución acuosa saturada de tiosulfato de sodio, y luego se sometió a extracción con diclorometano. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el

25 producto objetivo en una cantidad de 0,16 g (rendimiento 74%).

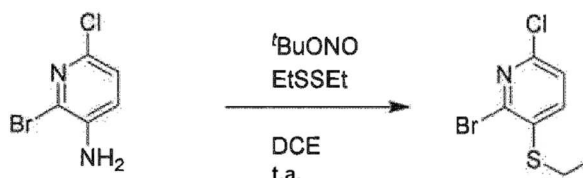
A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 9,44 (s, 1H), 9,33 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,54 (m, 2H), 7,37 (m, 2H), 7,35 (s, 1H), 4,24 (q, 2H), 3,96 (s, 3H), 1,46 (t, 3H).

[Ejemplo 2; no dentro del alcance de las reivindicaciones]

30 Síntesis de 3-(etilsulfonil)-6-(3-metil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-2-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)piridina (Compuesto N.º a-8)

(Etapa 1) Síntesis de 2-bromo-6-cloro-3-(etiltio)piridina

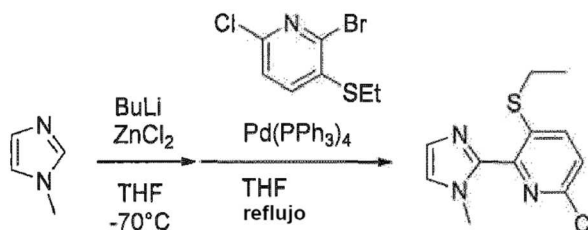


Se añadió nitrito de *t*-butilo (5,15 g, 45 mmol, 1,5 eq) a una solución de disulfuro de dietilo (7,3 g, 60 mmol, 2 eq) disuelta en dicloroetano (100 ml) y luego se calentó hasta 40°C. Se le añadió gota a gota 3-amino-2-bromo-6-cloropiridina (6,18 g, 30 mmol, 1,0 equiv.) y luego se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Se añadió agua a la solución de reacción mencionada anteriormente y luego se llevó a cabo extracción con cloroformo. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 4,02 g (rendimiento 53%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃) δ: 7,42 (1H, d), 7,26 (1H, d), 2,95 (2H, q), 1,39 (3H, t).

(Etapa 2) Síntesis de 6-cloro-3-(etiltilio)-2-(1-metil-1*H*-imidazol-2-il)piridina

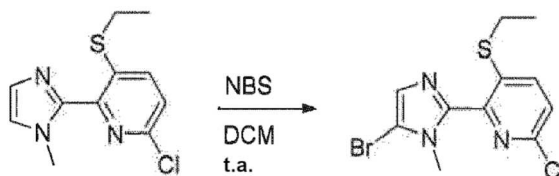


Se disolvió 1-metil-1*H*-imidazol (1,19 g, 14,5 mmol, 1,0 eq) en tetrahidrofurano (50 ml) y el interior del reactor se reemplazó con nitrógeno. Posteriormente, la solución se enfrió hasta -70°C. Se le añadió gota a gota una solución de *n*-butillitio disuelta en *n*-hexano (2,67 M) (6 ml, 16 mmol, 1,1 equiv.) y luego se agitó durante 30 minutos a -70°C. Se le añadió cloruro de zinc (II) (5,92 g, 43,5 mmol, 3 eq), luego se calentó hasta temperatura ambiente y se agitó durante 1 hora. Posteriormente, se le añadió una solución de 2-bromo-6-cloro-3-(etiltilio)piridina (4,02 g, 16 mmol, 1,1 eq) disuelta en tetrahidrofurano (50 ml) y tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) (335 mg, 0,29 mmol, 0,02 eq). El interior del reactor se reemplazó con nitrógeno y, posteriormente, la mezcla de reacción se agitó durante la noche con calentamiento y reflujo. Se añadió agua a la solución de reacción antes mencionada y luego la mezcla se sometió a extracción con acetato de etilo. La fase orgánica obtenida se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 2,04 g (rendimiento 55%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃) δ: 7,61 (1H, d), 7,27-7,20 (2H, m), 6,99 (1H, m), 3,90 (3H, s), 2,91 (2H, q), 1,35 (3H, t).

(Etapa 3) Síntesis de 2-(5-bromo-1-metil-1*H*-imidazol-2-il)-6-cloro-3-(etiltilio)piridina

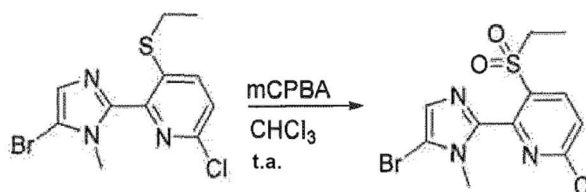


Se disolvió 6-cloro-3-(etiltilio)-2-(1-metil-1*H*-imidazol-2-il)piridina (2,04 g, 8,06 mmol, 1,0 eq) en 50 ml de diclorometano y luego se enfrió hasta 0°C. Se le añadió N-bromosuccinimida (1,36 g, 7,66 mmol, 0,95 eq), y la mezcla se agitó durante 3 horas a temperatura ambiente. Se añadió agua a la solución de reacción antes mencionada y luego se llevó a cabo extracción con diclorometano. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 1,43 g (rendimiento 53%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃) δ: 7,63 (1H, d), 7,26 (1H, d), 7,22 (1H, s), 3,82 (3H, s), 2,92 (2H, q), 1,34 (3H, t).

(Etapa 4) Síntesis de 2-(5-bromo-1-metil-1*H*-imidazol-2-il)-6-cloro-3-(etilsulfonyl)piridina

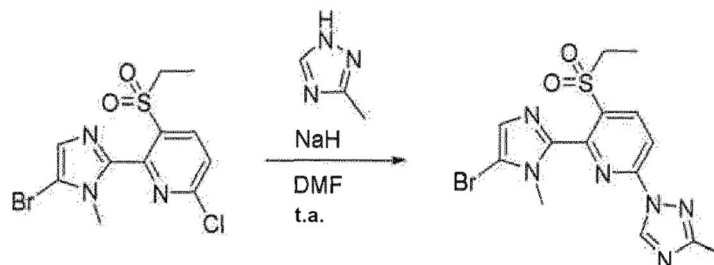


Se disolvió 2-(5-bromo-1-metil-1*H*-imidazol-2-il)-6-cloro-3-(etilitio)piridina (1,41 g, 4,25 mmol, 1,0 eq) en cloroformo (20 ml) y luego se enfrió hasta 0°C. Se le añadió ácido metacloroperbenzoico al 70% (9,34 mmol, 2,2 eq), y la mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La solución de reacción antes mencionada se añadió a una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y se llevó a cabo extracción con cloroformo. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 1,16 g (rendimiento 75%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃) δ: 8,41 (1H, d), 7,57 (1H, d), 7,14 (1H, s), 3,86 (2H, q), 3,66 (3H, s), 1,33 (3H, t).

(Etapa 5) Síntesis de 2-(5-bromo-1-metil-1*H*-imidazol-2-il)-3-(etilsulfonyl)-6-(3-metil-1*H*-1,2,4-triazol-1-il)piridina

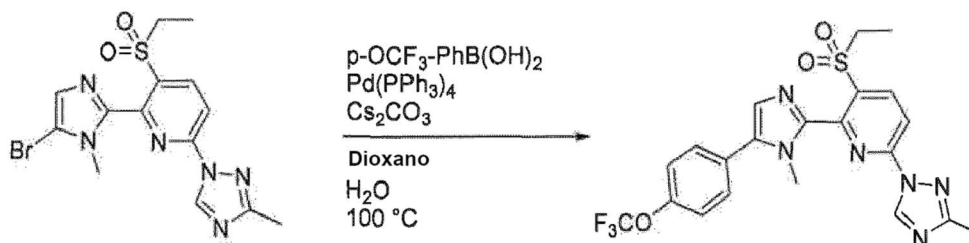


Se disolvió 2-(5-bromo-1-metil-1*H*-imidazol-2-il)-6-cloro-3-(etilsulfonyl)piridina (200 mg, 0,55 mmol, 1,0 eq) en dimetilformamida (5 ml) y se le añadió hidruro de sodio al 50% (32 mg, 0,66 mmol, 1,1 eq). Posteriormente, la mezcla se enfrió hasta 0°C. Se le añadió 3-metil-1*H*-1,2,4-triazol (50 mg, 0,61 mmol, 1,1 equiv.) y luego se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La solución de reacción antes mencionada se añadió a una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y se llevó a cabo extracción con acetato de etilo. La fase orgánica obtenida se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 91 mg (rendimiento 40%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃) δ: 9,04 (1H, s), 8,61 (1H, d), 8,07 (1H, d), 7,17 (1H, s), 3,84 (2H, q), 3,65 (3H, s), 2,53 (3H, s), 1,35 (3H, t).

(Etapa 6) Síntesis de 3-(etilsulfonyl)-6-(3-metil-1*H*-1,2,4-triazol-1-il)-2-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)piridina



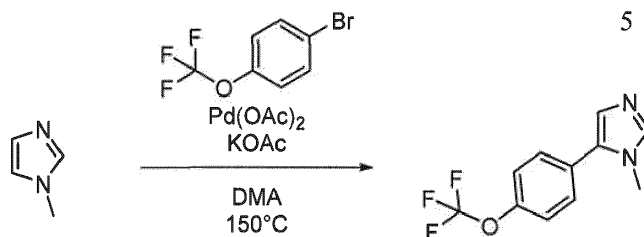
Se disolvió 2-(5-bromo-1-metil-1*H*-imidazol-2-il)-3-(etilsulfonyl)-6-(3-metil-1*H*-1,2,4-triazol-1-il)piridina (90 mg, 0,22 mmol, 1,0 eq) en 10 ml de dioxano y luego se agitó a temperatura ambiente. Se le añadieron agua (1 ml), ácido 4-(trifluorometoxi)fenilborónico (50 mg, 0,24 mmol, 1,1 eq), tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) (13 mg, 0,05 mmol, 0,05 eq) y carbonato de cesio (110 mg, 0,33 mmol, 1,5 eq) y el interior del reactor se reemplazó con nitrógeno. La mezcla se agitó durante la noche a 100°C. La solución de reacción antes mencionada se añadió al agua y se llevó a cabo extracción con acetato de etilo. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 108 mg (rendimiento cuantitativo).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃) δ: 9,09 (1H, s), 8,64 (1H, d), 8,08 (1H, d), 7,55 (2H, d), 7,35 (2H, d), 7,23 (1H, s), 3,90 (2H, q), 3,64 (3H, s), 2,54 (3H, s), 1,37 (3H, t).

[Ejemplo 3]

- 5 Síntesis de 5-(etilsulfonyl)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)-2,2'-bipirimidina (Compuesto N.º 7)
(Etapa 1) Síntesis de 1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol

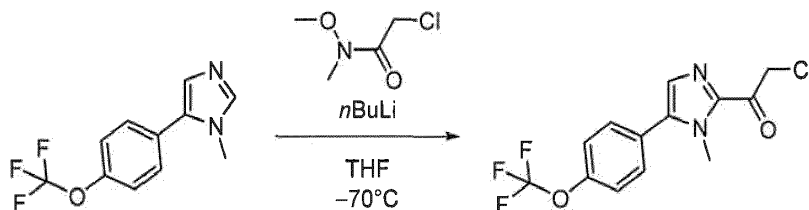


- Se disolvió 1-metil-1H-imidazol (0,681 g, 8,30 mmol, 2,0 eq) en *N,N*-dimetilacetamida (21 ml), y el interior del reactor se reemplazó con argón. Posteriormente, la mezcla se agitó a temperatura ambiente. Se le añadieron 1-bromo-4-(trifluorometoxi)benzeno (1,0 g, 4,15 mmol, 1,0 eq), acetato de paladio (II) (4,7 mg, 0,021 mmol, 0,005 eq), acetato de potasio (0,814 g, 8,30 mmol, 2,0 eq) y luego se agitó durante 64 horas a 150°C. El líquido obtenido se enfrió de forma natural hasta temperatura ambiente y el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida. Se añadió agua al residuo obtenido y se llevó a cabo extracción con cloroformo. La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 0,51 g (rendimiento 51%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7,54 (s, 1H), 7,41 (m, 2H), 7,29 (m, 2H), 7,10 (s, 1H), 3,67 (s, 3H).

(Etapa 2) Síntesis de 2-cloro-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)etan-1-ona

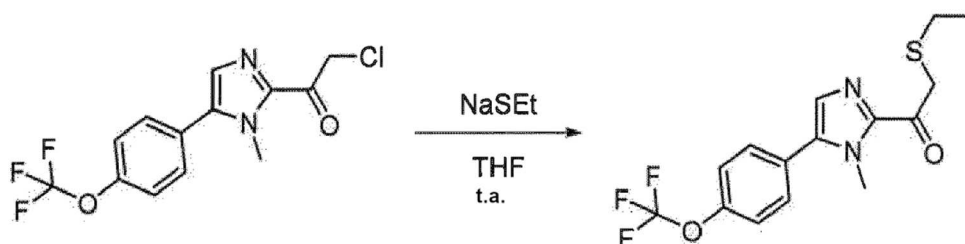


- Se disolvió 1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol (0,50 g, 2,06 mmol, 1,0 eq) en tetrahidrofurano (10 ml) y el interior del reactor se reemplazó con nitrógeno. Posteriormente, la mezcla se enfrió hasta -70°C. Se le añadió *n*-butillitio (2,65 M, solución de *n*-hexano) (0,95 ml) gota a gota, y la mezcla se agitó durante 30 minutos a -70°C. Se le añadió 2-cloro-*N*-metoxi-*N*-metilacetamida (0,34 g, 2,48 mmol, 1,2 eq), y luego se agitó durante 1 hora a -70°C. Se añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio al líquido resultante y se llevó a cabo extracción con cloroformo. La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 0,38 g (rendimiento 58%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

- 30 ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7,45 (m, 2H), 7,36 (m, 2H), 7,12 (s, 1H), 4,98 (s, 2H), 3,97 (s, 3H).

(Etapa 3) Síntesis de 2-(etilthio)-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)etan-1-ona

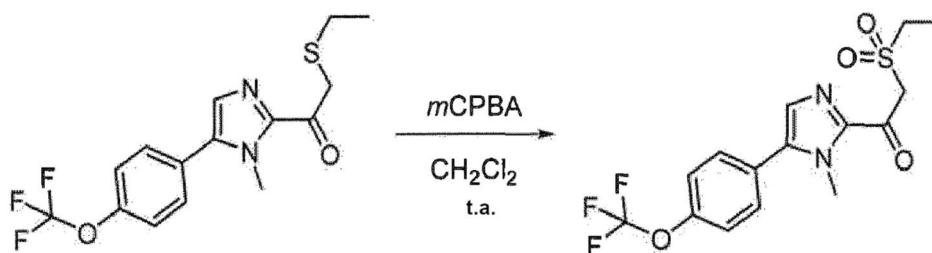


Se disolvió 2-cloro-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)etan-1-ona (0,187 g, 0,59 mmol, 1,0 eq) en tetrahidrofurano (5,9 ml) y luego se agitó a temperatura ambiente. Se le añadió sal sódica de etilmercaptano (80%) (0,068 g, 0,65 mmol, 1,1 equiv.) y luego se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Se añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio al líquido resultante y se llevó a cabo extracción con acetato de etilo. La fase orgánica obtenida se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 0,138 g (rendimiento 68%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7,44 (m, 2H), 7,35 (m, 2H), 7,23 (s, 1H), 4,00 (s, 2H), 3,95 (s, 3H), 2,69 (q, 2H), 1,31 (t, 3H).

10 (Etapa 4) Síntesis de 2-(etilsulfonil)-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)etan-1-ona

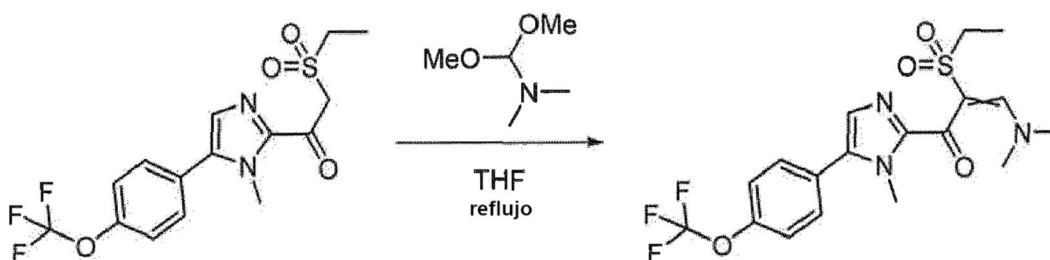


Se disolvió 2-(etiltio)-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)etan-1-ona (0,138 g, 0,40 mmol, 1,0 eq) en diclorometano (2 ml) y luego se agitó a 0°C. Se le añadió ácido meta-cloroperbenzoico (70%) (0,217 g, 0,88 mmol, 2,2 eq), y luego se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Se añadió una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio al líquido resultante y se llevó a cabo extracción con cloroformo. La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De ese modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 0,113 g (rendimiento 75%).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

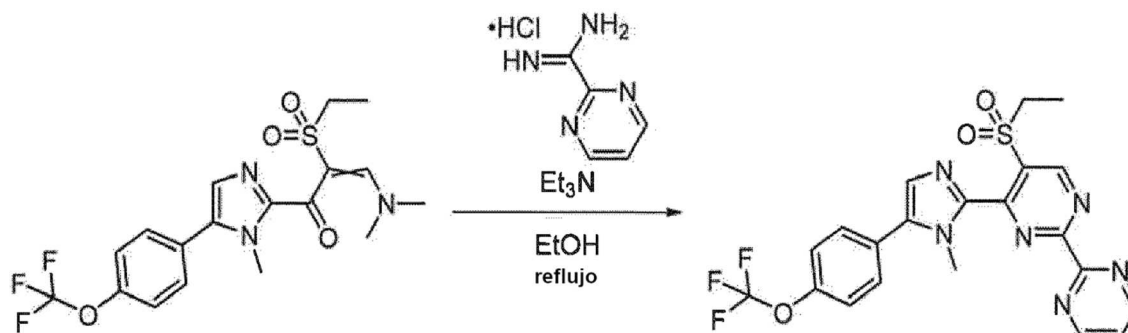
20 ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 7,45 (m, 2H), 7,36 (m, 2H), 7,30 (s, 1H), 4,87 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 3,33 (q, 2H), 1,49 (t, 3H).

(Etapa 5) Síntesis de 3-(dimetilamino)-2-(etilsulfonil)-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)prop-2-en-1-ona



Se disolvió 2-(etilsulfonil)-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)etan-1-ona (0,374 g, 0,99 mmol, 1,0 eq) en tetrahidrofurano (5 ml) y luego se agitó a temperatura ambiente. Se le añadió *N,N*-dimetilformamida dimetilacetal (0,592 g, 4,97 mmol, 5,0 eq), y la mezcla se agitó durante 3 horas con calentamiento y reflujo. El líquido resultante se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se utilizó en la siguiente etapa, sin llevar a cabo purificación.

(Etapa 6) Síntesis de 5-(etilsulfonil)-4-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-imidazol-2-il)-2,2'-bipirimidina

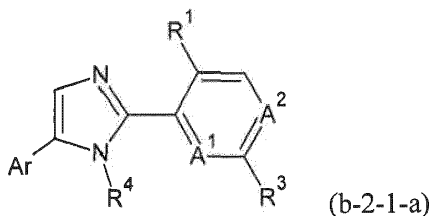


5 Se disolvió la 3-(dimetilamino)-2-(etilsulfonyl)-1-(1-metil-5-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1H-imidazol-2-il)prop-2-en-1-ona mencionada anteriormente obtenida en la etapa 5 en etanol (5 ml) y luego se agitó a temperatura ambiente. Se le añadieron trietilamina (0,453 g, 4,47 mmol, 4,5 eq) y clorhidrato de 2-amidinopiridina (0,36 g, 1,49 mmol, 1,5 eq), y luego se agitó durante 1 hora con calentamiento y reflujo. El líquido resultante se enfrió de forma natural y el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida. Se añadió agua al residuo obtenido y se llevó a cabo extracción con cloroformo. La fase orgánica obtenida se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice. De este modo, se obtuvo el producto objetivo en una cantidad de 0,53 g (rendimiento 92%, 2 etapas).

A continuación se muestra el ¹H-RMN del producto objetivo obtenido.

10 ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 9,65 (s, 1H), 9,09 (d, 2H), 7,54 (m, 3H), 7,36 (m, 2H), 7,31 (s, 1H), 4,23 (q, 2H), 3,93 (s, 3H), 1,46 (t, 3H).

15 Los compuestos según la presente invención preparados por los mismos métodos que los descritos en los Ejemplos antes mencionados se muestran en de la Tabla 1 a la Tabla 3. La Tabla 1 y la Tabla 2 muestran los compuestos representados por la Fórmula (b-2-1-a) en donde R⁵ en la Fórmula (b-2-1) es un átomo de hidrógeno, que tiene diversos sustituyentes. Los datos físicos de los compuestos se describen en las columnas de "Propiedad física". Como datos de propiedades físicas, se describen la propiedad o el punto de fusión (p.f.). En las Tablas, Me representa un grupo metilo, Et representa un grupo etilo, Bn representa un grupo bencilo, ^tBu representa un grupo butilo terciario y Ac representa un grupo acetilo.



20

Tabla 2

Compuesto N.º	R ¹	R ³	R ⁴	A ¹	A ²	Ar	Propiedad física
1	SO ₂ Et	H	Me	N	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 107-109°C
3	SO ₂ Et	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	N	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 153-156°C
4	SO ₂ Et	3-Cl-1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	N	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 190-192°C
5	SO ₂ Et	3-NHCOO ^t Bu-1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	N	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 235-238°C
6	SO ₂ Et	3-NH ₂ -1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	N	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 194-197°C
7	SO ₂ Et	pirimidin-2-ilo	Me	N	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 186-188°C
8	SO ₂ Et	pirimidin-2-ilo	Me	N	N	4-CF ₂ CF ₃ -fenilo	p.f. 207-209°C
9	SO ₂ Et	pirimidin-2-ilo	Me	N	N	6-CF ₃ -piridin-3-ilo	p.f. 234-236°C

Tabla 2 (continuación)

Compuesto N.º	R ¹	R ³	R ⁴	A ¹	A ²	Ar	Propiedad física
28	SO ₂ Et	1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	CH	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 207-209°C
29	SO ₂ Et	OMe	Me	CH	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 133-135°C
30	SO ₂ Et	OH	Me	CH	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 208-212°C
31	SO ₂ Et	pirimidin-2-ilo	Me	CH	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 185-187°C
32	SO ₂ Et	3-NH ₂ - 1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	CH	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 262-266°C
33	SO ₂ Et	3-NHAc- 1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	CH	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 253-255°C
34	SO ₂ Et	3-NHCOCF ₃ - 1H-1,2,4-triazol-1-ilo	Me	CH	N	4-OCF ₃ -fenilo	p.f. 159-163°C

Tabla 2 (continuación)

Compuesto N.º	R ¹	R ³	R ⁴	A ¹	A ²	Ar	Propiedad física
56	SO ₂ Et	pirimidin-2-ilo	Me	N	N	1-CHF ₂ - 1H-pirazol-4-ilo	p.f. 126-128°C

[Pruebas biológicas]

- 5 Los siguientes ejemplos de prueba demuestran que los compuestos de diaril-azol de la presente invención (en lo sucesivo en el presente documento, denominados "compuestos de la presente invención") son útiles como principios activos de las formulaciones para controlar organismos nocivos y de las formulaciones para controlar ectoparásitos. El término "parte" se basa en el peso.

(Preparación de emulsión para prueba)

- 10 Se mezclaron y disolvieron 5 partes del compuesto de la presente invención, 93,6 partes de dimetilformamida y 1,4 partes de polioxietilén alquil aril éter para preparar la Emulsión (I) que incluía el 5% de un principio activo.

Se calcularon una tasa de mortalidad de insectos y una tasa de control mediante las ecuaciones numéricas que se muestran a continuación.

$$\text{Tasa de mortalidad de insectos (\%)} = (\text{Número de insectos muertos}) / (\text{Número de insectos de muestra}) \times 100$$

$$\text{Tasa de control} = \{1 - (\text{Nt})/(\text{Nc})\} \times 100$$

- 15 en donde Nt: número de parásitos en el área tratada por pulverización; y

Nc: número de parásitos en el área no tratada

(Ejemplo de prueba 1) Prueba de eficacia frente a *Mythimna separata*

- 20 Se mezclaron completamente 0,8 g de un alimento artificial comercialmente disponible (Insecta LFS, fabricado por Nosan Corporation) y 1 µl de Emulsión (I) y se colocaron 0,2 g de la mezcla resultante en cada una de las áreas de tratamiento de un recipiente de prueba de plástico (volumen: 1,4 ml) para completar la preparación de un alimento de prueba.

- 25 Dos larvas de segundo estadio de *Mythimna separata* se inocularon en cada área de tratamiento y se selló el recipiente de prueba con una tapa de plástico. El recipiente sellado se colocó en una cámara termostática a 25°C y al quinto día se determinó la tasa de mortalidad y la cantidad de alimento consumido. La prueba se realizó dos veces. Además, se utilizó como control una prueba realizada en las mismas condiciones, pero con la excepción de excluir el compuesto de la presente invención de la Emulsión (I) antes mencionada.

Se realizaron pruebas de eficacia frente a *Mythimna separata* para los compuestos que tienen los números de compuesto que se muestran en la Tabla 5. Para todos los compuestos, la tasa de mortalidad frente a *Mythimna separata* fue del 100%, o la cantidad de alimento consumido fue del 10% o menos de la cantidad de alimento consumido en el control.

		6			33		
		7			34		
		8					
		9					
				28			
				29			
	1			31			
	5			32			

5

(Ejemplo de prueba 2) Prueba de eficacia frente a *Spodoptera litura*

La emulsión (1) se diluyó con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención fue de 125 ppm. Se sumergieron hojas de col en el líquido diluido durante 30 segundos. Posteriormente, las hojas de col se colocaron en placas de Petri, seguido de la inoculación de 5 larvas de segundo estadio de *Spodoptera litura*. Las placas de Petri se colocaron en una cámara termostática a una temperatura de 25°C y una humedad del 60%. Se investigó la mortalidad 6 días después de la inoculación y se calculó la tasa de mortalidad de los insectos. La prueba se realizó dos veces.

10

La prueba de eficacia frente a *Spodoptera litura* se llevó a cabo para los compuestos de acuerdo con los números de compuestos que se muestran en la Tabla 6. Todos los compuestos demostraron una tasa de mortalidad de insectos del 80% o más frente a *Spodoptera litura*.

15

		28
8		

(Ejemplo de prueba 3) Prueba de eficacia frente a *Plutella xylostella*

La emulsión (1) se diluyó con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención fue de 125 ppm. Se sumergieron hojas de col en el líquido diluido durante 30 segundos. Posteriormente, las hojas de col se colocaron en placas de Petri, seguido de la inoculación de 5 larvas de segundo estadio de *Plutella xylostella*. Las placas de Petri se colocaron en una cámara termostática a una temperatura de 25°C y una humedad del 60%. Se investigó la mortalidad 3 días después de la inoculación y se calculó la tasa de mortalidad de los insectos. La prueba se realizó dos veces.

20

La prueba de eficacia frente a *Plutella xylostella* se llevó a cabo para los compuestos de acuerdo con los números de compuestos que se muestran en la Tabla 7. Todos los compuestos demostraron una tasa de mortalidad del 80% o más frente a *Plutella xylostella*.

25

	7			31		
	8			32		
				33		
		28		34		
		29				

(Ejemplo de prueba 4) Prueba de eficacia frente a *Aphis craccivora*

5 Se cultivaron plantas de alubia carilla macetas N.º 3 y las hojas primarias se inocularon con ninfas de *Aphis craccivora*. La emulsión (1) se diluyó con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención fuera de 125 ppm. Posteriormente, se pulverizó el líquido diluido antes mencionado sobre las plantas de alubia carilla sobre las que las ninfas de *Aphis craccivora* eran parásitos. Las plantas de alubias carilla antes mencionadas se colocaron luego en una cámara termostática con una temperatura de 25°C y una humedad del 60%. Se investigó la mortalidad 4 días después de la pulverización, y se calculó la tasa de mortalidad de insectos de *Aphis craccivora*. La prueba se realizó dos veces.

10 La prueba de eficacia frente a *Aphis craccivora* se llevó a cabo para los compuestos según los números de compuestos que se muestran en la Tabla 8. Todos los compuestos demostraron una tasa de mortalidad del 80% o más frente a *Aphis craccivora*.

Tabla 8				
	1			
	7			56
	8			

(Ejemplo de prueba 5) Prueba de eficacia frente a *Nilaparvata lugens*

15 La emulsión (1) se diluyó con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención fuera de 125 ppm. Las plántulas de arroz se empaparon en el líquido diluido durante 30 segundos y se sometieron a secado al aire. Posteriormente, las plántulas de arroz se colocaron en cajas de plástico, seguido de la inoculación de 5 larvas de segundo estadio de *Nilaparvata lugens*. Las cajas de plástico se colocaron en una cámara termostática a una temperatura de 25°C y una humedad del 65%. Se investigó la mortalidad 7 días después de la inoculación y se calculó la tasa de mortalidad de los insectos. La prueba se realizó dos veces.

20 La prueba de eficacia frente a *Nilaparvata lugens* se llevó a cabo para los compuestos según los números de compuestos que se muestran en la Tabla 9. Todos los compuestos mostraron una tasa de mortalidad del 80% o más frente a *Nilaparvata lugens*.

Tabla 9				
	1			
	7			
	8		56	
	9			

(Ejemplo de prueba 6) Prueba de eficacia frente a *Phyllotreta striolata*

25 La emulsión (1) se diluyó con agua para que la concentración del compuesto de la presente invención fuera de 125 ppm, para preparar un líquido diluido para someter a prueba. El líquido diluido antes mencionado se pulverizó sobre plántulas de bok-choi (7º período principal de desarrollo de la hoja) plantadas en macetas N.º 3. Después de que las plántulas de bok-choi se sometieron a secado al aire, las plántulas se colocaron en vasos de plástico y luego se inocularon 10 *Phyllotreta striolata* adultos. Los vasos de plástico se almacenaron en una cámara termostática a una temperatura de 25°C y una humedad del 65%. Se investigó la mortalidad 7 días después de la inoculación y se calculó la tasa de mortalidad de los insectos. La prueba se realizó dos veces.

30 La prueba de eficacia frente a *Phyllotreta striolata* adultos se llevó a cabo para los compuestos según los números de compuestos que se muestran en la Tabla 10. Todos los compuestos mostraron una tasa de mortalidad del 80% o más frente a *Phyllotreta striolata* adultos.

Tabla 10					
		8			
	6		28		
	7		31		

(Ejemplo de prueba 7) Prueba de eficacia frente a *Trips palmi* (125 ppm)

5 Inoculación de 10 *Trips palmi* adultos en plántulas de pepino. La emulsión (1) se diluyó con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención fue de 125 ppm. El líquido diluido antes mencionado se pulverizó sobre las plántulas de pepino, seguido de secado al aire. El número de larvas parasitarias se calculó 7 días después de la pulverización y se calculó la tasa de control (prevención). La prueba se realizó dos veces.

La prueba de eficacia frente a *Trips palmi* se llevó a cabo para los compuestos de los números de compuesto que se muestran en la Tabla 11. Todos los compuestos mostraron una tasa de control de próxima generación del 80% o más.

Tabla 11		
7		
8	31	
9		

10 (Ejemplo de prueba 8) Prueba de eficacia frente a *Trips palmi* (31 ppm)

Se llevó a cabo la inoculación de 10 *Trips palmi* adultos en plántulas de pepino. La emulsión (1) se diluyó con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención fuera de 31 ppm. El líquido diluido antes mencionado se pulverizó sobre las plántulas de pepino, seguido de secado al aire. El número de larvas parasitarias se calculó 7 días después de la pulverización y se calculó la tasa de control (prevención). La prueba se realizó dos veces.

15 La prueba de eficacia frente a *Trips palmi* se llevó a cabo para los compuestos de los números de compuesto que se muestran en la Tabla 12. Todos los compuestos mostraron una tasa de control de próxima generación del 80% o más.

Tabla 12		
7		
8	31	
9		

(Ejemplo de prueba 9) Prueba de eficacia frente a *Culex pipiens molestus*

20 La emulsión (1) se diluyó con agua para que la concentración del compuesto de la presente invención fuera de 10 ppm, para preparar un líquido químico para someter a prueba. Se liberaron 20 larvas de primer estadio de *Culex pipiens molestus* en 100 ml del líquido químico. Después de un día, se contó el número de insectos muertos y se calculó la tasa de mortalidad de insectos. La prueba se realizó dos veces.

25 La prueba de eficacia frente a larvas de primer estadio de *Culex pipiens molestus* se llevó a cabo para los compuestos según los números de compuestos que se muestran en la Tabla 13. Todos los compuestos mostraron una tasa de mortalidad del 100% frente a las larvas de primer estadio de *Culex pipiens molestus*.

Tabla 13					
		6		32	
				34	
	1				
	3		28		
	4		29		
	5		30		

(Ejemplo de prueba 10) Prueba de eficacia frente a *Nilaparvata lugens*

30 La emulsión (1) se diluyó con agua para que la concentración del compuesto de la presente invención fuera de 8 ppm. Las plántulas de arroz se empaparon en el líquido diluido durante 30 segundos y se sometieron a secado al aire. Posteriormente, las plántulas de arroz se colocaron en cajas de plástico, seguido de la inoculación de 5 larvas de

segundo estadio de *Nilaparvata lugens*. Las cajas de plástico se colocaron en una cámara termostática a una temperatura de 25°C y una humedad del 65%. Se investigó la mortalidad 7 días después de la inoculación y se calculó la tasa de mortalidad de los insectos. La prueba se realizó dos veces.

5 La prueba de eficacia frente a *Nilaparvata lugens* se llevó a cabo para los compuestos según los números de compuestos que se muestran en la Tabla 14. Todos los compuestos demostraron una tasa de mortalidad del 80% o más contra *Nilaparvata lugens*.

Tabla 14			
7			56
8			
9			

(Ejemplo de prueba 11) Prueba de eficacia frente a *Phyllotreta striolata*

10 La emulsión (1) se diluyó con agua para que la concentración del compuesto de la presente invención fuera de 8 ppm, para preparar un líquido diluido para someter a prueba. El líquido diluido antes mencionado se pulverizó sobre plántulas de bok-choi (7º período principal de desarrollo de la hoja) plantadas en macetas N.º 3. Después de que las plántulas de bok-choi se sometieron a secado al aire, las plántulas se colocaron en vasos de plástico y luego se inocularon 10 *Phyllotreta striolata* adultas. Los vasos de plástico se almacenaron en una cámara termostática a una temperatura de 25°C y una humedad del 65%. Se investigó la mortalidad 7 días después de la inoculación y se calculó la tasa de mortalidad de los insectos. La prueba se realizó dos veces.

15 La prueba de eficacia frente a *Phyllotreta striolata* adultos se llevó a cabo para los compuestos según los números de compuestos que se muestran en la Tabla 15. Todos los compuestos mostraron una tasa de mortalidad del 80% o más frente a *Phyllotreta striolata* adultos.

Tabla 15			
6			
7			
8			
	28		

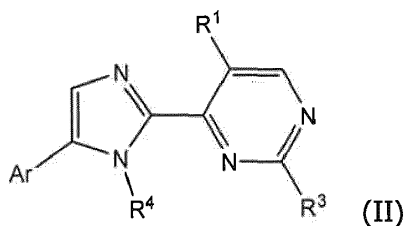
20 Los compuestos seleccionados aleatoriamente entre los compuestos según la presente invención muestran los efectos descritos anteriormente. Por esta razón, puede entenderse que los compuestos de la presente invención, incluidos aquellos que no pueden demostrarse anteriormente, tienen efectos de control de organismos nocivos y, en particular, efectos acaricidas, efectos insecticidas y similares. Además, también puede entenderse que los compuestos de la presente invención tienen efectos sobre ectoparásitos y similares que dañan a seres humanos y animales.

25 **Aplicabilidad industrial**

30 Puede proporcionarse un compuesto de diaril-azol que tiene una actividad superior para controlar organismos nocivos y, en particular, una actividad insecticida y/o acaricida superior, que muestra una seguridad superior y puede sintetizarse de manera industrial de manera ventajosa, y también una formulación para controlar organismos nocivos que contenga el mismo como principio activo. Además, puede proporcionarse una formulación para controlar ectoparásitos o una formulación para controlar o expulsar endoparásitos que contiene el mismo como principio activo.

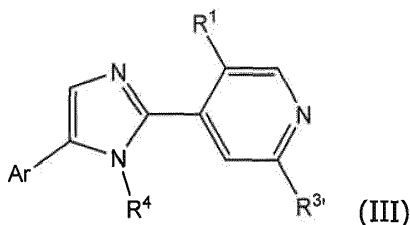
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la fórmula (II) o la fórmula (III), o una sal del mismo,



en donde

- 5 R¹ es un grupo alquiltio C1-6 o un grupo alquilsulfonilo C1-6,
 R³ es un átomo de hidrógeno, o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,
 R⁴ es un grupo alquilo C1-6, y
 Ar es un grupo fenilo sustituido o no sustituido, o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido;



10 en donde

- R¹ es un grupo alquilsulfonilo C1-6 sustituido o no sustituido,
 R³ es un grupo hidroxilo, un grupo alcoxilo C1-6 o un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros sustituido o no sustituido,
 R⁴ es un grupo alquilo C1-6, y
 Ar es un grupo fenilo sustituido o no sustituido.

15 2. Una formulación para controlar organismos nocivos, que comprende al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos mencionados en la reivindicación 1, y sales de los mismos, como principio activo.

3. Una formulación insecticida o una formulación acaricida, que comprende al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos mencionados en la reivindicación 1, y sales de los mismos, como principio activo.

20 4. Una formulación para el control de ectoparásitos, que comprende al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos mencionados en la reivindicación 1, y sales de los mismos, como principio activo.

5. Una formulación para controlar endoparásitos o para expulsar endoparásitos, que comprende al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos mencionados en la reivindicación 1, y sales de los mismos, como principio activo.