

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 951 425**

51 Int. Cl.:

C07D 487/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01N 47/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **26.04.2018 PCT/JP2018/016914**

87 Fecha y número de publicación internacional: **01.11.2018 WO18199210**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **26.04.2018 E 18790298 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **28.06.2023 EP 3617207**

54 Título: **Compuesto heterocíclico condensado o sal del mismo, insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto o la sal, y método para usar el insecticida**

30 Prioridad:

27.04.2017 JP 2017087953

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
20.10.2023

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**MIYASAKA, AKIHIRO;
YONEMURA, IKKI;
SUWA, AKIYUKI;
FUJIE, SHUNPEI y
TANAKA, RYOSUKE**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 951 425 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuesto heterocíclico condensado o sal del mismo, insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto o la sal, y método para usar el insecticida

Campo técnico

La presente invención se refiere a un compuesto heterocíclico condensado o a una sal del mismo, un insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto o la sal como principio activo, y un método para usar el insecticida.

Antecedentes de la técnica

Se han examinado diversos compuestos por su potencial como insecticidas agrícolas y hortícolas y, entre ellos, se ha informado que ciertas clases de compuestos heterocíclicos condensados son útiles como insecticidas (por ejemplo, véase la bibliografía de patentes 1 a 6). Esta Bibliografía, sin embargo, no desvela el compuesto de la presente invención que tiene una estructura única, incluyendo compuestos en los que un anillo heterocíclico condensado está unido a otro anillo heterocíclico condensado. El documento WO 2015/000715 A1 se refiere a insecticidas que tienen un núcleo heterocíclico bi o tricíclico con un sustituyente que contiene azufre. El documento JP 2015 003906 A se refiere a pesticidas que tienen un núcleo heterocíclico condensado y a un sustituyente que contiene azufre. El documento WO 2016/107742 A1 se refiere a pesticidas tetracíclicos que tienen un sustituyente que contiene azufre. Dichos compuestos son diferentes de los compuestos reivindicados de la presente invención, difiriendo, entre otras cosas, en el patrón de sustitución.

Lista de citas

Bibliografía de patentes

Bibliografía de patente 1: JP-A 2009-280574
 Bibliografía de patente 2: JP-A 2010-275301
 Bibliografía de patente 3: JP-A 2011-79774
 Bibliografía de patente 4: JP-A 2012-131780
 Bibliografía de patente 5: Documento WO 2012/086848
 Bibliografía de patente 6: WO 2014/142292

Sumario de la invención

Problema técnico

En la producción de cultivos en los campos de la agricultura, la horticultura y similares, el daño provocado por las plagas de insectos, etc., aún es inmenso y han aparecido plagas de insectos resistentes a los insecticidas existentes. En estas circunstancias, es deseable el desarrollo de nuevos insecticidas agrícolas y hortícolas.

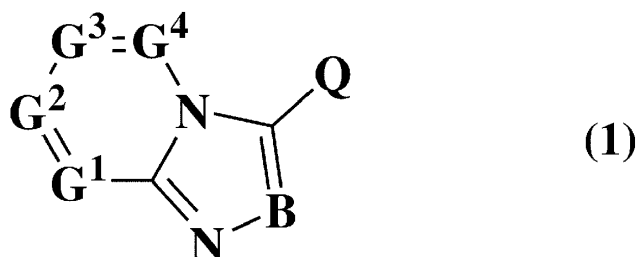
Solución al problema

Los presentes inventores llevaron a cabo una amplia investigación para resolver los problemas descritos anteriormente. Como resultado, los presentes inventores descubrieron que un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) o una sal del mismo es altamente eficaz para el control de plagas agrícolas y hortícolas y completaron la presente invención.

Es decir, la presente invención se refiere a lo siguiente.

[1] Un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1):

[Quím. 1]



{en donde

B representa un átomo de nitrógeno o C-R⁰, en donde R⁰ representa

- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un átomo de halógeno;
- (a3) un grupo nitro;
- (a5) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a6) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
- (a10) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (a11) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
- (a12) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
- (a13) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

G¹ representa un átomo de nitrógeno o C-R¹,

G² representa un átomo de nitrógeno o C-R²,

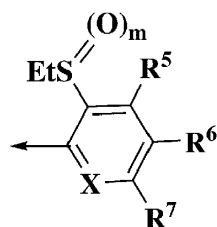
G³ representa un átomo de nitrógeno o C-R³,

G⁴ representa un átomo de nitrógeno o C-R⁴ (en donde R¹, R², R³ y R⁴ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno

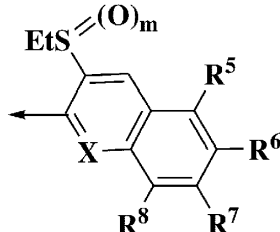
- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un átomo de halógeno;
- (a3) un grupo nitro;
- (a4) N(R²⁰)(R²¹) (en donde R²⁰ y R²¹ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo cicloalquilo (C₃-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆) o un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);
- (a5) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a6) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
- (a10) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (a11) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
- (a12) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
- (a13) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

Q representa un grupo de anillo representado por cualquiera de las siguientes fórmulas estructurales Q-1, Q-2 y Q-3:

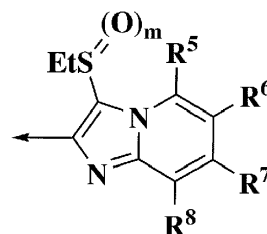
[Quím. 2]



(Q-1)



(Q-2)



(Q-3)

(en donde

m representa 0, 1 o 2,

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno

- (b1) un átomo de hidrógeno;
- (b2) un átomo de halógeno;
- (b3) un grupo formilo;
- (b4) un grupo alquilo (C₁-C₆);

- (b5) un grupo cicloalquilo (C_3-C_6);
 (b6) un grupo cicloalquil (C_3-C_6) alquilo (C_1-C_6);
 (b7) un grupo alcoxi (C_1-C_6);
 (b8) un grupo alquiltio (C_1-C_6);
 (b9) un grupo alquilsulfinilo (C_1-C_6);
 (b10) un grupo alquilsulfonilo (C_1-C_6);
 (b11) un grupo haloalquilo (C_1-C_6);
 (b12) un grupo haloalcoxi (C_1-C_6);
 (b13) un grupo haloalquiltio (C_1-C_6);
 (b14) un grupo haloalquilsulfinilo (C_1-C_6);
 (b15) un grupo haloalquilsulfonilo (C_1-C_6);
 (b16) $N(R^{20})(R^{21})$ (en donde R^{20} y R^{21} son como se han definido anteriormente);
 (b17) $C(R^{20})=NO(R^{21})$ (en donde R^{20} y R^{21} son como se han definido anteriormente);
 (b18) un grupo arilo; o
 (b19) un grupo arilo que tiene, en un anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C_1-C_6), (f) un grupo haloalquilo (C_1-C_6), (g) un grupo alcoxi (C_1-C_6), (h) un grupo haloalcoxi (C_1-C_6), (i) un grupo cicloalquil (C_3-C_6) alcoxi (C_1-C_6), (j) un grupo alquiltio (C_1-C_6), (k) un grupo haloalquiltio (C_1-C_6), (l) un grupo alquilsulfinilo (C_1-C_6), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C_1-C_6), (n) un grupo alquilsulfonilo (C_1-C_6), (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C_1-C_6), (p) un grupo alquilcarbonilo (C_1-C_6), (q) un grupo carboxilo y (r) un grupo alcóxicarbonilo (C_1-C_6), y

X representa un átomo de nitrógeno o CH (cada flecha representa la unión al grupo heterocíclico condensado)))
 y

una sal del mismo.

[2] El compuesto heterocíclico condensado y la sal según el apartado anterior [1], en donde Q es Q-2.

[3] El compuesto heterocíclico condensado y la sal según el apartado anterior [1], en donde Q es Q-1.

[4] Uso del compuesto heterocíclico condensado o la sal según cualquiera de los apartados anteriores [1] a [3] como insecticida agrícola y hortícola.

[5] Un método para usar un insecticida agrícola y hortícola, que comprende tratar plantas o suelo con un principio activo del insecticida agrícola y hortícola especificado en el apartado anterior [4].

[6] Un método para controlar plagas agrícolas y hortícolas, que comprende tratar plantas o suelo con una cantidad eficaz del insecticida agrícola y hortícola especificado en el apartado anterior [4].

[7] Un agente de control de ectoparásitos de animales no humanos que comprende el compuesto heterocíclico condensado o la sal según cualquiera de los apartados anteriores [1] a [3] como principio activo.

[8] Un agente de control de ectoparásitos de animales no humanos especificado en el apartado anterior [7] para su uso en un método para controlar ectoparásitos de animales no humanos, que comprende tratar ectoparásitos de animales no humanos con una cantidad eficaz del agente de control de ectoparásitos de animales no humanos según el apartado anterior [7].

Efectos ventajosos de la invención

El compuesto heterocíclico condensado de la presente invención o una sal del mismo no solamente es muy eficaz como insecticida agrícola y hortícola, sino también eficaz para la desinfección de plagas que viven en mascotas tales como perros y gatos y animales domésticos tales como vacas y ovejas.

Descripción de las realizaciones

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

El "grupo alquilo (C_1-C_6)" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo *terc*-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo *terc*-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2,3-dimetilpropilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo 1-metilbutilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo n-hexilo, un grupo isohexilo, un grupo 2-hexilo, un grupo 3-hexilo, un grupo 2-metilpentilo, un grupo 3-metilpentilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilo, un grupo 3,3-dimetilbutilo o similar.

El "grupo cicloalquilo (C_3-C_6)" se refiere a un grupo alquilo cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo o similar. El "grupo alcoxi (C_1-C_6)" se refiere a un grupo alcoxi de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo *terc*-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo *terc*-pentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo 2,3-dimetilpropiloxi, un grupo 1-etilpropiloxi, un grupo 1-metilbutiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo isohexiloxi, un grupo 1,1,2-

trimetilpropiloxi o similar. El "grupo alqueniloxi (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alqueniloxi de cadena lineal o cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propeniloxi, un grupo buteniloxi, un grupo penteniloxi, un grupo hexeniloxi o similar. El "grupo alquililoxi (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alquililoxi de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propiniloxi, un grupo butiniloxi, un grupo pentiniloxi, un grupo hexiniloxi o similar.

El "grupo alquiltio (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquiltio de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo n-butiltio, un grupo sec-butiltio, un grupo *terc*-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo isopentiltio, un grupo *terc*-pentiltio, un grupo neopentiltio, un grupo 2,3-dimetilpropiltio, un grupo 1-etilpropiltio, un grupo 1-metilbutiltio, un grupo n-hexiltio, un grupo isohexiltio, un grupo 1,1,2-trimetilpropiltio o similar. El "grupo alquilsulfinito (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfinito de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfinito, un grupo etilsulfinito, un grupo n-propilsulfinito, un grupo isopropilsulfinito, un grupo n-butilsulfinito, un grupo sec-butilsulfinito, un grupo *terc*-butilsulfinito, un grupo n-pentilsulfinito, un grupo isopentilsulfinito, un grupo *terc*-pentilsulfinito, un grupo neopentilsulfinito, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfinito, un grupo 1-etilpropilsulfinito, un grupo 1-metilbutilsulfinito, un grupo n-hexilsulfinito, un grupo isohexilsulfinito, un grupo 1,1,2-trimetilpropilsulfinito o similar. El "grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfonilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo sec-butilsulfonilo, un grupo *terc*-butilsulfonilo, un grupo n-pentilsulfonilo, un grupo isopentilsulfonilo, un grupo *terc*-pentilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfonilo, un grupo 1-etilpropilsulfonilo, un grupo 1-metilbutilsulfonilo, un grupo n-hexilsulfonilo, un grupo isohexilsulfonilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo o similar.

El "grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfonilo de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilcarbonilo, un grupo etilcarbonilo, un grupo n-propilcarbonilo, un grupo isopropilcarbonilo, un grupo n-butilcarbonilo, un grupo *sec*-butilcarbonilo, un grupo *terc*-butilcarbonilo, un grupo n-pentilcarbonilo, un grupo *iso*-pentilcarbonilo, un grupo *terc*-pentilcarbonilo, un grupo *neo*-pentilcarbonilo, un grupo 2,3-dimetilpropilcarbonilo, un grupo 1-etilpropilcarbonilo, un grupo 1-metilbutilcarbonilo, un grupo n-hexilcarbonilo, un grupo isohexilcarbonilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilcarbonilo o similar. El "grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alcóxicarbonilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metoxycarbonilo, un grupo etoxycarbonilo, un grupo n-propoxycarbonilo, un grupo isopropoxycarbonilo, un grupo n-butoxycarbonilo, un grupo *sec*-butoxycarbonilo, un grupo *terc*-butoxycarbonilo, un grupo n-pentoxycarbonilo, un grupo *iso*-pentiloxycarbonilo, un grupo *terc*-pentiloxycarbonilo, un grupo *neo*-pentiloxycarbonilo, un grupo 2,3-dimetilpropiloxycarbonilo, un grupo 1-etilpropiloxycarbonilo, un grupo 1-metilbutiloxycarbonilo, un grupo n-hexiloxycarbonilo, un grupo *iso*-hexiloxycarbonilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropiloxycarbonilo o similar.

El "grupo arilo" es preferentemente un grupo hidrocarbonado aromático monocíclico o policíclico condensado de 6 a 14 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo fenilo, un grupo bencilo, un grupo toloilo, un grupo o-xiloilo, un grupo naftilo, un grupo 2-naftilo, un grupo 1-antrilo, un grupo 2-antrilo, un grupo 9-butenilo o similares.

Los mencionados anteriormente, "grupo alquilo (C₁-C₆)", "grupo alquenoilo C₂-C₆", "grupo alquínilo (C₂-C₆)", "grupo cicloalquilo (C₃-C₆)", "grupo cicloalquiloxi (C₃-C₆)", "grupo alcoxi (C₁-C₆)", "grupo alqueniloxi (C₂-C₆)", "grupo alquililoxi (C₂-C₆)", "grupo alquiltio (C₁-C₆)", "grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆)", "grupo alquéniltio (C₂-C₆)", "grupo alquíniltio (C₂-C₆)", "grupo alquénilsulfonilo (C₂-C₆)", "grupo alquínilsulfonilo (C₂-C₆)", "grupo alquénilsulfonilo (C₂-C₆)", "grupo (alquínilsulfonilo (C₂-C₆))", "grupo cicloalquiltio (C₃-C₆)", "grupo cicloalquilsulfonilo (C₃-C₆)", "grupo cicloalquilsulfonilo (C₃-C₆)", "grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆) y "grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆)" puede estar sustituido con uno o más átomos de halógeno en una posición o posiciones sustituibles en lugar de uno o más átomos de hidrógeno, y, en el caso de que cualquiera de los grupos enumerados anteriormente esté sustituido con dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes.

Los "grupos sustituidos con uno o más átomos de halógeno" mencionados anteriormente se expresan como un "grupo haloalquilo (C_1-C_6)", un "grupo haloalquenilo (C_2-C_6)", un "grupo haloalquinilo (C_2-C_6)", un "grupo halocicloalquilo (C_3-C_6)", un "grupo cicloalquiloxi (C_3-C_6)", un "grupo haloalcoxi (C_1-C_6)", un "grupo haloalqueniloxi (C_2-C_6)", un "grupo haloalquiniloxi (C_2-C_6)", un "grupo haloalquitio (C_1-C_6)", un "grupo haloalquilsulfonilo (C_1-C_6)", un "grupo alquilsulfonilo (C_1-C_6)", un "grupo haloalquenilitio (C_2-C_6)", un "grupo haloalquilnitio (C_2-C_6)", un "grupo haloalquenilsulfonilo (C_2-C_6)", un "grupo haloalquínilsulfonilo (C_2-C_6)", un "grupo haloalquénilsulfonilo (C_2-C_6)", un "grupo haloalquínilsulfonilo (C_2-C_6)", un "grupo haloalcoalcicuiloxi (C_3-C_6)", un "grupo halocicloalquil sulfonilo (C_3-C_6)", un "grupo halocicloalquilsulfonilo (C_3-C_6)", un "grupo haloalquilcarbonilo (C_1-C_6)" y un "grupo haloalcoxycarbonilo (C_1-C_6)".

Las expresiones " (C₁-C₆) ", " (C₂-C₆) ", " (C₃-C₆) ", etc., se refieren cada una al intervalo del número de átomos de carbono en cada grupo. La misma definición es válida para los grupos en los que dos o más de los grupos mencionados anteriormente están enlazados y, por ejemplo, el "grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆)" significa que un grupo alcoxi de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono está unido a un grupo alquilo de cadena lineal o cadena ramificada de 1 a 6 átomos de carbono.

Los ejemplos de la sal del compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente

invención incluyen sales de ácido inorgánico, tales como clorhidratos, sulfatos, nitratos y fosfatos; sales de ácidos orgánicos, tales como acetatos, fumaratos, maleatos, oxalatos, metanosulfonatos, bencenosulfonatos y p-toluenosulfonatos y sales con una base inorgánica u orgánica tal como un ion sodio, un ion potasio, un ion calcio y un ion trimetilamonio.

5 El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención y una sal del mismo pueden tener uno o más centros quirales en la fórmula estructural y pueden existir en forma de dos o más clases de isómeros ópticos o diastereómeros. Todos los isómeros ópticos y mezclas de los isómeros en cualquier proporción están incluidos también en la presente invención. Además, el compuesto representado por la fórmula

10 general (1) de la presente invención y una sal del mismo pueden existir como dos tipos de isómeros geométricos debido a un doble enlace carbono-nitrógeno o un doble enlace carbono-carbono en la fórmula estructural. Todos los isómeros geométricos y mezclas de los isómeros en cualquier proporción están incluidos también en la presente invención.

15 Los grupos sustituyentes representados por los símbolos en la fórmula general (1) de la presente invención pueden ser los que se usan habitualmente.

En el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo,

20 B es preferentemente un átomo de nitrógeno o C-R⁰, en donde R⁰ representa

- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un átomo de halógeno;
- 25 (a3) un grupo nitro;
- (a5) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a6) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
- 30 (a9) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
- (a10) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (a11) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
- (a12) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
- (a13) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
- 35 (a14) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

G¹ es preferentemente un átomo de nitrógeno o C-R¹,
 G² es preferentemente un átomo de nitrógeno o C-R²,
 G³ es preferentemente un átomo de nitrógeno o C-R³,
 40 G⁴ es preferentemente un átomo de nitrógeno o C-R⁴

(en donde R¹, R², R³ y R⁴ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno

- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un átomo de halógeno;
- 45 (a3) un grupo nitro;
- (a4) N(R²⁰)(R²¹) (en donde R²⁰ y R²¹ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo cicloalquilo (C₃-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆) o un grupo alcoxicarbonilo (C₁-C₆);
- (a5) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- 50 (a6) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
- (a10) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- 55 (a11) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
- (a12) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
- (a13) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

60 Q es preferentemente un anillo representado por cualquiera de Q-1, Q-2 y Q-3, en donde m es preferentemente 0, 1 o 2,

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ pueden ser iguales o diferentes, y son cada uno independientemente

- (b1) un átomo de hidrógeno;
- 65 (b2) un átomo de halógeno;
- (b3) un grupo formilo;

(b4) un grupo alquilo (C_1-C_6);
 (b5) un grupo cicloalquilo (C_3-C_6);
 (b6) un grupo cicloalquil (C_3-C_6) alquilo (C_1-C_6);
 (b7) un grupo alcoxi (C_1-C_6);
 (b8) un grupo alquiltio (C_1-C_6);
 (b9) un grupo alquilsulfinilo (C_1-C_6);
 (b10) un grupo alquilsulfonilo (C_1-C_6);
 (b11) un grupo haloalquilo (C_1-C_6);
 (b12) un grupo haloalcoxi (C_1-C_6);
 (b13) un grupo haloalquiltio (C_1-C_6);
 (b14) un grupo haloalquilsulfinilo (C_1-C_6);
 (b15) un grupo haloalquilsulfonilo (C_1-C_6);
 (b16) $N(R^{20})(R^{21})$ (en donde R^{20} y R^{21} son como se han definido anteriormente);
 (b17) $C(R^{20})=NO(R^{21})$ (en donde R^{20} y R^{21} son como se han definido anteriormente);
 (b18) un grupo arilo; o
 (b19) un grupo arilo que tiene, en un anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C_1-C_6), (f) un grupo haloalquilo (C_1-C_6), (g) un grupo alcoxi (C_1-C_6), (h) un grupo haloalcoxi (C_1-C_6), (i) un grupo cicloalquil (C_3-C_6) alcoxi (C_1-C_6), (j) un grupo alquiltio (C_1-C_6), (k) un grupo haloalquiltio (C_1-C_6), (l) un grupo alquilsulfinilo (C_1-C_6), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C_1-C_6), (n) un grupo alquilsulfonilo (C_1-C_6), (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C_1-C_6), (p) un grupo alquilcarbonilo (C_1-C_6), (q) un grupo carboxilo y (r) un grupo alcocarbonilo (C_1-C_6), y

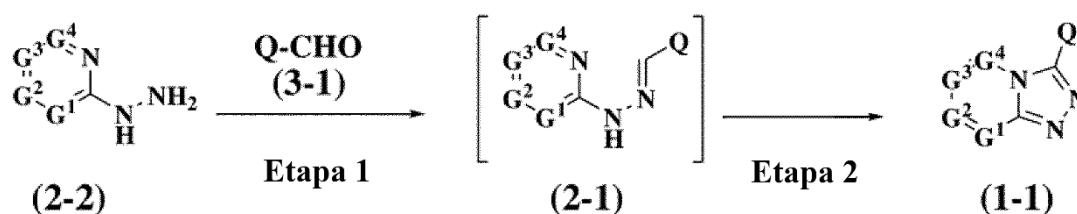
X es preferentemente un átomo de nitrógeno o CH.

Q es más preferentemente un anillo representado por Q-1 o Q-2.

El compuesto heterocíclico condensado de la presente invención o una sal del mismo se puede producir según, por ejemplo, los métodos de producción descritos a continuación, los cuales son ejemplos no limitantes. Los compuestos de partida utilizados en los métodos de producción de la presente invención se pueden producir mediante métodos conocidos o métodos conocidos en sí.

Método de producción 1

[Quím. 3]



En la fórmula, G^1 , G^2 , G^3 , G^4 y Q son como se han definido anteriormente.

Método de producción en la [Etapa 1]

El compuesto representado por la fórmula general (2-1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2-2) con el compuesto representado por la fórmula general (3-1) en presencia de un disolvente inerte.

El disolvente inerte utilizado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano (THF) y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como cloruro de benceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; y otros disolventes polares. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, estos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción suele estar en el intervalo de aproximadamente 0°C al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similar, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado del intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de

interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés. Como alternativa, la mezcla posterior a la reacción se puede someter directamente a la siguiente etapa sin aislamiento ni purificación.

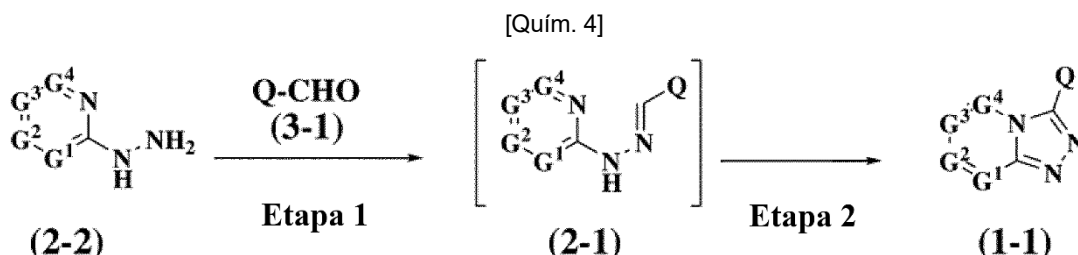
5 Método de producción en la [Etapa 2]

El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1-1) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2-1) según el método descrito en el documento WO 2012/149280.

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

15 Método de producción 2

15



En la fórmula, G¹, G², G³, G⁴ y Q son como se han definido anteriormente, y X representa un átomo de halógeno.

20

Método de producción en la [Etapa 1a]

El compuesto representado por la fórmula general (2-1a) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2-3) con el compuesto representado por la fórmula general (3-1a) en presencia de una base y un disolvente inerte.

25

Los ejemplos de la base que se puede usar en esta reacción incluyen bases orgánicas tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, diisopropilamina y piridina; sales de metales orgánicos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio y *tert*-butoxido de potasio; bases inorgánicas, tales como bicarbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato de sodio, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; e hidruros de metales tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio.

30

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

40

Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, estos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción suele estar en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similar, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado del intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés. Como alternativa, la mezcla posterior a la reacción se puede someter directamente a la siguiente etapa sin aislamiento ni purificación.

45

50 Método de producción en la [Etapa 2a]

El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1-1) se puede producir tratando el compuesto representado por la fórmula general (2-1a) con un anhídrido de ácido, un agente deshidratante o un cloruro de ácido en un disolvente inerte.

55

El disolvente inerte utilizado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno,

cloroformo, dicloroetano y tetracloruro de carbono; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como tetrahidrofurano, dioxano, dimetoxietano, etilenglicol dimetil éter, siloxano y éter dietílico; ésteres, tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y disolventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

Los ejemplos del anhídrido de ácido que se puede usar en esta reacción incluyen anhídridos de ácidos orgánicos tales como anhídrido acético y anhídrido trifluoroacético; y anhídridos de ácido sulfónico tales como anhídrido metanosulfónico, anhídrido bencenosulfónico y anhídrido trifluorometanosulfónico.

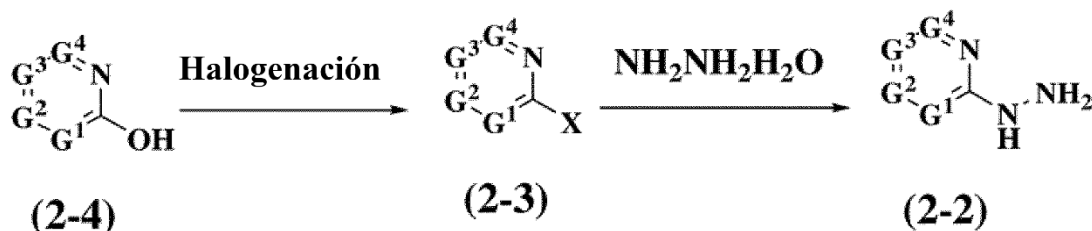
Los ejemplos del agente deshidratante que se puede usar en esta reacción incluyen pentóxido de difósforo, ácido polifosfórico, éster trimetilsilílico del ácido polifosfórico y éster etílico del ácido polifosfórico.

Los ejemplos del cloruro de ácido que se puede usar en esta reacción incluyen cloruro de dietilfosforilo, cloruro de bencenosulfonilo, cloruro de p-toluenosulfonilo y cloruro de metanosulfonilo. Los ejemplos de bases que pueden usarse en ciertas condiciones incluyen bases orgánicas tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, diisopropilamina, DBU, piridina y N-metilmorfolina; bases inorgánicas, tales como bicarbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato de sodio, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; e hidruros de metales tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio.

En esta reacción, los reactivos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción suele estar en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similar, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado del intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción del intermedio

[Quím. 5]



En la fórmula, G¹, G², G³ y G⁴ son como se han definido anteriormente, y X representa un átomo de halógeno.

El compuesto representado por la fórmula general (2-3), que se usa para la producción del compuesto de la presente invención, se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2-4), que se produce según el método descrito en el documento WO 2010/134478, con un agente halogenante en presencia o ausencia de un disolvente inerte.

Los ejemplos del agente halogenante que se puede usar en esta reacción incluyen oxiclورو de fósforo, tribromuro de fósforo y cloruro de tionilo.

El disolvente inerte utilizado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos alifáticos tales como pentano, hexano y ciclohexano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; e hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, dicloroetano y tetracloruro de carbono. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

En esta reacción, los reactivos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero el agente halogenante se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción suele estar en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similar, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado del intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

El compuesto representado por la fórmula general (2-2) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2-3) con hidrato de hidrazina en un disolvente inerte.

El disolvente inerte utilizado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; y disolventes polares tales como agua. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, estos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero el hidrato de hidrazina se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción en esta reacción suele estar en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similar, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado del intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

El compuesto de aldehído representado por la fórmula general (3-1), que se puede usar para la producción del compuesto de la presente invención, se puede producir haciendo reaccionar un compuesto de éster de ácido carboxílico que tiene un grupo cíclico representado por Q-1, Q-2 o Q-3, concretamente, un compuesto de éster de ácido carboxílico representado por R-OCO-(Q-1), R-OCO-(Q-2) o R-OCO-(Q-3) (en donde R representa un residuo de éster tal como un grupo metilo o un grupo etilo), con un agente reductor en un disolvente inerte. El compuesto de éster de ácido carboxílico se produce según el método descrito en el documento WO 2016/091731, WO 2016/129684 o WO 2012/086842.

Los ejemplos del agente reductor que se puede usar en la presente reacción incluyen hidruro de litio y aluminio (LAH), hidruro de diisobutilaluminio (DIBAL) e hidruro de bis(2-metoxietoxi)aluminio de sodio (Red-Al).

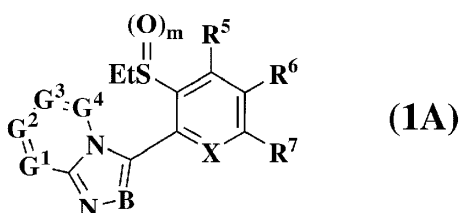
El disolvente inerte utilizado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; y éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano, tetrahidrofurano y 2-metiltetrahidrofurano. Se puede usar uno de estos disolventes inertes solo y también se pueden usar dos o más de ellos en forma de una mezcla.

En esta reacción, el agente reductor se usa básicamente en una cantidad equimolar con respecto al compuesto de éster de ácido carboxílico, pero se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de 0 °C al punto de ebullición del disolvente inerte utilizado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero básicamente está en el intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

El compuesto representado por la fórmula general (3-1a), que se puede usar para la producción del compuesto de la presente invención, se puede producir de la misma manera que se describe en el método de producción del compuesto representado por la fórmula general (2-2) a partir del compuesto de éster de ácido carboxílico mencionado anteriormente (un compuesto de éster de ácido carboxílico que tiene un grupo cíclico representado por Q-1, Q-2 o Q-3). El compuesto de éster de ácido carboxílico se produce según el método descrito en el documento WO 2016/091731, WO 2016/129684 o WO 2012/086842.

Los ejemplos específicos del compuesto de la presente invención se muestran a continuación. En las tablas que se proporcionan a continuación, Me representa un grupo metilo, Et representa un grupo etilo y *c*-Pr representa un grupo ciclopropilo. En la columna de "Propiedad física" se muestra un punto de fusión (°C) o la presencia de datos de RMN ¹H. Los datos de la RMN ¹H se muestran en la tabla 14.

[Quím. 6]



[Tabla 1]

Tabla 1

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	m	Propiedad física
1-1	CCF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	CH	2	193-195
1-2	CCF ₂ CF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-3	CSCF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-4	CSOCF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-5	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-6	CCF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-7	CCF ₂ CF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-8	CSCF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-9	CSOCF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-10	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-11	CH	CCF ₃	CH	CH	CF ₃	CH	2	RMN
1-12	CH	CCF ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-13	CH	CSCF ₃	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-14	CH	CSOCF ₃	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-15	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	CH	2	
1-16	CH	CCF ₃	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-17	CH	CCF ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-18	CH	CSCF ₃	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-19	CH	CSOCF ₃	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-20	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	N	2	
1-21	CH	CH	CCF ₃	CH	CF ₃	CH	2	RMN
1-22	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	CH	CF ₃	CH	2	
1-23	CH	CH	CSCF ₃	CH	CF ₃	CH	2	
1-24	CH	CH	CSOCF ₃	CH	CF ₃	CH	2	
1-25	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CF ₃	CH	2	

5 B representa N, y R⁵ y R⁷ representan cada uno un átomo de hidrógeno.

[Tabla 2]

Tabla 2

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	m	Propiedad física
1-26	CH	CH	CCF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-27	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-28	CH	CH	CSCF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-29	CH	CH	CSOCF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-30	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-31	CH	CH	CH	CCF ₃	CF ₃	CH	2	
1-32	CH	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	CF ₃	CH	2	
1-33	CH	CH	CH	CSCF ₃	CF ₃	CH	2	
1-34	CH	CH	CH	CSOCF ₃	CF ₃	CH	2	
1-35	CH	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CF ₃	CH	2	
1-36	CH	CH	CH	CCF ₃	CF ₃	N	2	
1-37	CH	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	CF ₃	N	2	
1-38	CH	CH	CH	CSCF ₃	CF ₃	N	2	

(continuación)

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	m	Propiedad física
1-39	CH	CH	CH	CSOCF ₃	CF ₃	N	2	
1-40	CH	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CF ₃	N	2	
1-41	CCl	CH	CF ₃	CH	CF ₃	CH	2	RMN
1-42	CMe	CH	CF ₃	CH	CF ₃	CH	2	
1-43	COMe	CH	CF ₃	CH	CF ₃	CH	2	
1-44	CNO ₂	CH	CF ₃	CH	CF ₃	CH	0	125-127
1-45	CNH ₂	CH	CF ₃	CH	CF ₃	CH	2	
1-46	CCl	CH	CF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-47	CMe	CH	CF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-48	COMe	CH	CF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-49	CNO ₂	CH	CF ₃	CH	CF ₃	N	2	
1-50	CNH ₂	CH	CF ₃	CH	CF ₃	N	2	

B representa N, y R⁵ y R⁷ representan cada uno un átomo de hidrógeno.

5 [Tabla 3]

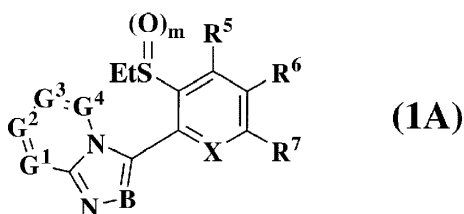
Tabla 3

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	m	Propiedad física
1-51	CH	CH	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	2	213-215
1-52	CSCF ₃	CH	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	2	37-39
1-53	Cl	CH	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	2	228-231
1-54	COCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH	CH	CH	c-Pr	N	2	
1-55	COCH ₂ CF ₂ CF ₃	CH	CH	CH	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	2	
1-56	CH	CCF ₃	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	2	95-97

B representa N, y R⁵ y R⁷ representan cada uno un átomo de hidrógeno.

10

[Quím. 7]



[Tabla 4]

15

Tabla 4

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	Propiedad física
2-1	N	CCF ₃	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	RMN
2-2	N	CCF ₂ CF ₃	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-3	N	CSCF ₃	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-4	N	CSOCF ₃	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-5	N	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-6	N	CH	CCF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-7	N	CH	CCF ₂ CF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-8	N	CH	CSCF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	

(continuación)

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	Propiedad física
2-9	N	CH	CSOCF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-10	N	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-11	N	COMe	CCF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-12	N	COMe	CCF ₂ CF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-13	N	COMe	CSCF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-14	N	COMe	CSOCF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-15	N	COMe	CSO ₂ CF ₃	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-16	N	CH	CH	CCF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	RMN
2-17	N	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	
2-18	N	CH	CH	CSCF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	
2-19	N	CH	CH	CSOCF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	
2-20	N	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	
2-21	CCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	CH	165-167
2-22	CCF ₂ CF ₃	N	CH	CH	CF ₃	CH	
2-23	CSCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	CH	
2-24	CSOCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	CH	
2-25	CSO ₂ CF ₃	N	CH	CH	CF ₃	CH	

B representa N, R⁵ y R⁷ representan cada uno un átomo de hidrógeno y m representa 2.

5 [Tabla 5]

Tabla 5

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	Propiedad física
2-26	CH	CCF ₃	N	CH	CF ₃	CH	224-225
2-27	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	CF ₃	CH	
2-28	CH	CSCF ₃	N	CH	CF ₃	CH	
2-29	CH	CSOCF ₃	N	CH	CF ₃	CH	
2-30	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	CF ₃	CH	
2-31	CH	CCF ₃	N	CH	I	N	236-238
2-32	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	I	N	
2-33	CH	CSCF ₃	N	CH	I	N	
2-34	CH	CSOCF ₃	N	CH	I	N	
2-35	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	I	N	
2-36	CH	CCF ₃	N	CH	3-CF ₃ -Ph	N	214-216
2-37	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	3-CF ₃ -Ph	N	199-201
2-38	CH	CSCF ₃	N	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-39	CH	CSOCF ₃	N	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-40	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	3-CF ₃ -Ph	N	
2-41	CH	CCF ₃	N	CH	4-F-Ph	N	RMN
2-42	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	4-F-Ph	N	
2-43	CH	CSCF ₃	N	CH	4-F-Ph	N	
2-44	CH	CSOCF ₃	N	CH	4-F-Ph	N	
2-45	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	4-F-Ph	N	
2-46	CH	CCF ₃	N	CH	c-Pr	N	187-189
2-47	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	c-Pr	N	

(continuación)

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	Propiedad física
2-48	CH	CSCF ₃	N	CH	c-Pr	N	
2-49	CH	CSOCF ₃	N	CH	c-Pr	N	
2-50	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	c-Pr	N	

B representa N, R⁵ y R⁷ representan cada uno un átomo de hidrógeno y m representa 2.

5 [Tabla 6]

Tabla 6

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	Propiedad física
2-51	CH	CCF ₃	N	CH	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	
2-52	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	
2-53	CH	CSCF ₃	N	CH	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	
2-54	CH	CSOCF ₃	N	CH	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	
2-55	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	
2-56	CH	CCF ₃	N	CMe	3-CF ₃ -Ph	N	190-192
2-57	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CMe	3-CF ₃ -Ph	N	
2-58	CH	CSCF ₃	N	CMe	3-CF ₃ -Ph	N	
2-59	CH	CSOCF ₃	N	CMe	3-CF ₃ -Ph	N	
2-60	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CMe	3-CF ₃ -Ph	N	
2-61	CH	CH	CCF ₃	N	CF ₃	CH	
2-62	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CF ₃	CH	
2-63	CH	CH	CSCF ₃	N	CF ₃	CH	
2-64	CH	CH	CSOCF ₃	N	CF ₃	CH	
2-65	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CF ₃	CH	

B representa N, R⁵ y R⁷ representan cada uno un átomo de hidrógeno y m representa 2.

10

[Tabla 7]

Tabla 7

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁶	X	Propiedad física
2-66	CH	CCF ₃	N	CH	4-Cl-Ph	N	RMN
2-67	CH	CCF ₃	N	CH	CF ₃	N	RMN
2-68	CH	CCF ₃	N	CH	3,4-F ₂ -Ph	N	211-213
2-69	N	CCF ₃	CH	CMe	3-CF ₃ -Ph	N	105-107
2-70	N	CMe	CH	CCF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	111-113
2-71	N	CCF ₃	CH	CMe	CF ₃	CH	256-258
2-72	N	CMe	CH	CCF ₃	CF ₃	CH	255-257
2-73	CH	CCF ₃	N	CMe	CF ₃	CH	253-255
2-74	CH	CCF ₃	N	CEt	3-CF ₃ -Ph	N	161-163
2-75	CH	CCF ₃	N	CMe	3-CF ₃ -Ph	N	87-89
2-76	COCH ₂ CF ₂ CF ₃	N	CH	CH	CF ₃	CH	197-199
2-77	COCH ₂ CF ₂ CF ₃	N	CH	CH	c-Pr	CH	
2-78	COCH ₂ CF ₂ CF ₃	N	CH	CH	CH=NOCH ₂ CF ₃	CH	

15 B representa N, R⁵ y R⁷ representan cada uno un átomo de hidrógeno y m representa 2.

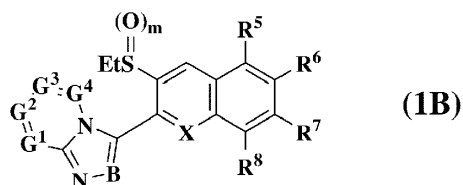
(continuación)

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁷	Propiedad física
3-33	CH	CH	CH	CSCF ₃	Br	
3-34	CH	CH	CH	CSOCF ₃	Br	
3-35	CH	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	Br	
3-36	CH	CH	CH	CCF ₃	CF ₃	
3-37	CH	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	CF ₃	
3-38	CH	CH	CH	CSCF ₃	CF ₃	
3-39	CH	CH	CH	CSOCF ₃	CF ₃	
3-40	CH	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CF ₃	
3-41	CH	CH	CF ₃	CH	Br	
3-42	CMe	CH	CF ₃	CH	Br	
3-43	COMe	CH	CF ₃	CH	Br	
3-44	CNO ₂	CH	CF ₃	CH	Br	
3-45	CNH ₂	CH	CF ₃	CH	Br	
3-46	CCl	CH	CF ₃	CH	CF ₃	
3-47	CMe	CH	CF ₃	CH	CF ₃	
3-48	COMe	CH	CF ₃	CH	CF ₃	
3-49	CNO ₂	CH	CF ₃	CH	CF ₃	
3-50	CNH ₂	CH	CF ₃	CH	CF ₃	

B y X representan cada uno N, R⁵, R⁶ y R⁸ representan cada uno un átomo de hidrógeno, y m representa 2.

5

[Quím. 9]



10 [Tabla 10]

Tabla 10

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁷	Propiedad física
4-1	N	CCF ₃	CH	CH	CF ₃	
4-2	N	CCF ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	
4-3	N	CSCF ₃	CH	CH	CF ₃	
4-4	N	CSOCF ₃	CH	CH	CF ₃	
4-5	N	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	
4-6	N	CH	CCF ₃	CH	CF ₃	
4-7	N	CH	CCF ₂ CF ₃	CH	CF ₃	
4-8	N	CH	CSCF ₃	CH	CF ₃	
4-9	N	CH	CSOCF ₃	CH	CF ₃	
4-10	N	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CF ₃	
4-11	N	COMe	CCF ₃	CH	CF ₃	
4-12	N	COMe	CCF ₂ CF ₃	CH	CF ₃	
4-13	N	COMe	CSCF ₃	CH	CF ₃	
4-14	N	COMe	CSOCF ₃	CH	CF ₃	

(continuación)

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁷	Propiedad física
4-15	N	COMe	CSO ₂ CF ₃	CH	CF ₃	
4-16	N	CH	CH	CCF ₃	CF ₃	
4-17	N	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	CF ₃	
4-18	N	CH	CH	CSCF ₃	CF ₃	
4-19	N	CH	CH	CSOCF ₃	CF ₃	
4-20	N	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CF ₃	
4-21	CCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	
4-22	CCF ₂ CF ₃	N	CH	CH	CF ₃	
4-23	CSCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	
4-24	CSOCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	
4-25	CSO ₂ CF ₃	N	CH	CH	CF ₃	

B y X representan cada uno N, R⁵, R⁶ y R⁸ representan cada uno un átomo de hidrógeno, y m representa 2.

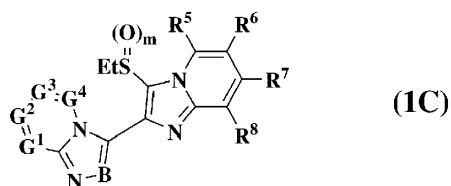
5 [Tabla 11]

Tabla 11

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁷	m	Propiedad física
4-26	CH	CCF ₃	N	CH	CF ₃	2	
4-27	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	CF ₃	2	212-214
4-28	CH	CSCF ₃	N	CH	CF ₃	2	
4-29	CH	CSOCF ₃	N	CH	CF ₃	2	
4-30	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	CF ₃	2	
4-31	CH	CCF ₃	N	CH	Br	0	RMN
4-32	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	Br	2	
4-33	CH	CSCF ₃	N	CH	Br	2	
4-34	CH	CSOCF ₃	N	CH	Br	2	
4-35	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	Br	2	
4-36	CH	CCF ₃	N	CH	Cl	2	
4-37	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	Cl	2	
4-38	CH	CSCF ₃	N	CH	Cl	2	
4-39	CH	CSOCF ₃	N	CH	Cl	2	
4-40	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	Cl	2	
4-41	CH	CCF ₃	N	CMe	Br	2	101-103
4-42	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CMe	Br	2	
4-43	CH	CSCF ₃	N	CMe	Br	2	
4-44	CH	CSOCF ₃	N	CMe	Br	2	
4-45	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CMe	Br	2	

B y X representan cada uno N, y R⁵, R⁶ y R⁸ representan cada uno un átomo de hidrógeno.

[Quím. 10]



[Tabla 12]

5

Tabla 12

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁷	m	Propiedad física
5-1	N	CCF ₃	CH	CH	CF ₃	2	
5-2	N	CCF ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	2	
5-3	N	CSCF ₃	CH	CH	CF ₃	2	
5-4	N	CSOCF ₃	CH	CH	CF ₃	2	
5-5	N	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	CF ₃	2	
5-6	N	CH	CCF ₃	CH	CF ₃	2	
5-7	N	CH	CCF ₂ CF ₃	CH	CF ₃	2	
5-8	N	CH	CSCF ₃	CH	CF ₃	2	
5-9	N	CH	CSOCF ₃	CH	CF ₃	2	
5-10	N	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CF ₃	2	
5-11	N	COMe	CCF ₃	CH	CF ₃	2	
5-12	N	COMe	CCF ₂ CF ₃	CH	CF ₃	2	
5-13	N	COMe	CSCF ₃	CH	CF ₃	2	
5-14	N	COMe	CSOCF ₃	CH	CF ₃	2	
5-15	N	COMe	CSO ₂ CF ₃	CH	CF ₃	2	
5-16	N	CH	CH	CCF ₃	CF ₃	2	
5-17	N	CH	CH	CCF ₂ CF ₃	CF ₃	2	
5-18	N	CH	CH	CSCF ₃	CF ₃	2	
5-19	N	CH	CH	CSOCF ₃	CF ₃	2	
5-20	N	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CF ₃	2	
5-21	CCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	2	
5-22	CCF ₂ CF ₃	N	CH	CH	CF ₃	2	
5-23	CSCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	2	
5-24	CSOCF ₃	N	CH	CH	CF ₃	2	
5-25	CSO ₂ CF ₃	N	CH	CH	CF ₃	2	

B representa N, y R⁵, R⁶ y R⁸ representan cada uno un átomo de hidrógeno.

[Tabla 13]

10

Tabla 13

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁷	m	Propiedad física
5-26	CH	CCF ₃	N	CH	CF ₃	0	186-188
5-27	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	CF ₃	2	
5-28	CH	CSCF ₃	N	CH	CF ₃	2	
5-29	CH	CSOCF ₃	N	CH	CF ₃	2	
5-30	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	CF ₃	2	
5-31	CH	CCF ₃	N	CH	Br	2	
5-32	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	Br	2	

(continuación)

N.º de compuesto	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	R ⁷	m	Propiedad física
5-33	CH	CSCF ₃	N	CH	Br	2	
5-34	CH	CSOCF ₃	N	CH	Br	2	
5-35	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	Br	2	
5-36	CH	CCF ₃	N	CH	Cl	2	
5-37	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CH	Cl	2	
5-38	CH	CSCF ₃	N	CH	Cl	2	
5-39	CH	CSOCF ₃	N	CH	Cl	2	
5-40	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CH	Cl	2	
5-41	CH	CCF ₃	N	CMe	Br	2	
5-42	CH	CCF ₂ CF ₃	N	CMe	Br	2	
5-43	CH	CSCF ₃	N	CMe	Br	2	
5-44	CH	CSOCF ₃	N	CMe	Br	2	
5-45	CH	CSO ₂ CF ₃	N	CMe	Br	2	
5-46	CH	CCF ₃	N	CH	CF ₃	2	RMN

B representa N, y R⁵, R⁶ y R⁸ representan cada uno un átomo de hidrógeno.

5 [Tabla 14]

Tabla 14 Datos de RMN ¹H

N.º de compuesto	Datos de RMN ¹ H (CDCl ₃)
1-11	8,56 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,02 (d, 1H), 3,36 (c, 2H), 1,27 (t, 3H)
1-21	8,57 (s, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 3,36 (c, 2H), 1,27 (t, 3H)
1-41	8,51 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,02 (t, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 3,32 (dd, 2H), 1,24 (t, 3H)
2-16	9,22 (s, 1H), 8,93 (d, 1H), 8,68 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,75 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 3,53 (c, 2H), 1,33 (t, 3H)
2-41	9,71 (s, 1H), 9,18 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,77-7,71 (m, 2H), 7,30 (t, 2H), 4,19 (c, 2H), 1,49 (t, 3H)
2-66	9,71 (s, 1H), 9,19 (s, 1H), 8,82 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,71 (d, 2H), 7,58 (d, 2H), 4,20 (c, 2H), 1,49 (t, 3H)
2-67	9,75 (s, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,93 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 4,23 (c, 2H), 1,51 (t, 3H)
4-31	10,68 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,04 (s, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,81 (dd, 1H), 3,15 (c, 2H), 1,51 (t, 3H)
4-41	10,67 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,04 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,81 (d, 1H), 3,16 (c, 2H), 1,51 (t, 3H)
5-46	10,21 (s, 1H), 9,53 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,37 (d, 1H), 4,18 (c, 2H), 1,48 (t, 3H)

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

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

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

Tineola bisselliella, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *Cydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Sesamia calamistis*, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella zinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia includens*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliiothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston muraes phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, *Bambalina* sp., *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon* sp., *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera flavescent*, las especies de la familia *Pieridae* tales como *Pieris rapae crucivora* y *Pieris rapae*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phtheochroides clandestina*, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips brevipicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogate*, *Diaphania indica*, *Heliiothis virescens* y *Earias cupreoviridis*;
 las especies del orden *Hemiptera* tales como *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynoteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptosaltria nigrofuscata*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwasakii*, *Aspidiotus destructor*, *Taylorilygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*, *Anacanthocoris stricornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *Triaeurodes vaporariorum*, *Aguriahana quercus*, *Lygus* spp., *Euceraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavalerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciatarina*, *Trioza camphorae*, *Leptocoris chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhlirites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidiotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*, *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagonus*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geocica lucifuga*, *Numata mui*, *Comstockaspis perniciososa*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederiae*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigridorsalis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis glycines*, *Leptocoris oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroeueon formosanum*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudoaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stall*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*, *Eurydema rugosum*, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lopholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nymphaeae*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhlirites debile*, *Laodelphax striatellus*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovina punctata*, *Empoasca* spp., *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocoris acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Aphrophora costalis*, *Lygus disponi*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissimum*, *Eysarcoris guttiger*, *Lepidosaphes beekii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginella citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudoaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopteris pruni*, *Aphis farinosa*, *yanagigicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonuguis mali*, *Orientus ishida*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* y *Aphis gossypii*;
 las especies del orden *Coleoptera* tales como *Xystrocerus globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosts*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tunebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotheta hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*,

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

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

- 60 Además, también se incluyen ácaros y garrapatas parásitos de animales en las plagas diana, y los ejemplos incluyen las especies de la familia *Ixodidae* tales como *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinoza*, *Dermacentor reticulatus* y *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; las especies del género *Ornithonyssus* tales como *Ornithonyssus sylvairum* y *Ornithonyssus bursa*; las especies de la familia *Trombiculidae* tales como *Eutrombicula wickhami*, *Leptotrombidium akamushi*,
- 65

Leptotrombidium pallidum, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* y *Helenicula miyagawai*; las especies de la familia *Cheyletidae* tales como *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* y *Cheyletiella blakei*; las especies de la superfamilia *Sarcoptoidea* tales como *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* y *Notoedres cati*; y las especies de la familia *Demodicidae* tales como *Demodex canis*.

Otras plagas diana incluyen pulgas, incluyendo insectos sin alas ectoparasitarios que pertenecen al orden *Siphonaptera*, más específicamente, las especies pertenecientes a las familias *Pulicidae* y *Ceratophyllidae*. Los ejemplos de las especies que pertenecen a la familia *Pulicidae* incluyen *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* y *Monopsyllus anisus*.

Otras plagas diana incluyen ectoparásitos, por ejemplo, las especies del suborden *Anoplura* tales como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* y *Pediculus capitis*; las especies del suborden *Mallophaga* tales como *Trichodectes canis*; y plagas de insectos dípteros hematófagos tales como *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* y *Simulium ornatum*. Además, los ejemplos de endoparásitos incluyen nematodos tales como lombrices pulmonares, tricuros, *Oesophagostomum*, lombrices parasitarias endogástricas, ascárides y filarias; cestodos tales como *Spirometra erinacei*, *Diphyllbothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* y *Echinococcus multilocularis*; trematodos tales como *Schistosoma japonicum* y *Fasciola hepatica*; y protozoos tales como coccidios, *Plasmodium*, *Sarcocystis* intestinal, *Toxoplasma* y *Cryptosporidium*.

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

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

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

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

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

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

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

Se describen ejemplos de las toxinas anteriores y de plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar estas toxinas en los documentos EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878, WO 03/052073, etc.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

En el caso de cultivos de campo, sus semillas, los medios de cultivo en las proximidades de sus plantas, o similares, pueden tratarse en el período de cultivo de siembra a plántulas. En el caso de plantas cuyas semillas se siembran directamente en el campo, además del tratamiento directo de semillas, es preferible el tratamiento del pie de las plantas durante el cultivo. Específicamente, el tratamiento puede realizarse, por ejemplo, aplicando un gránulo sobre el suelo o empapando el suelo con una formulación en forma líquida diluida en agua o sin diluir. Otro tratamiento preferible es la incorporación de un gránulo al medio de cultivo antes de la siembra.

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

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

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

La composición (insecticida agrícola u hortícola o agente de control parasitario animal (no humano)) de la presente

invención opcionalmente puede contener un aditivo utilizado para formulaciones agroquímicas o agentes de control parasitario animal junto con el principio activo. Los ejemplos de aditivos incluyen vehículos tales como vehículos sólidos o líquidos, tensioactivos, dispersantes, agentes humectantes, aglutinantes, adherentes, espesantes, colorantes, esparcidores, agentes de adhesión/esparcidores, agentes anticongelantes, agentes antiaglomerantes, agentes disgregantes y estabilizantes. Si fuera necesario, también se pueden usar conservantes, fragmentos de plantas, etc., como aditivo. Se puede usar uno de estos aditivos solo y también se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

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

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

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

Los ejemplos de aglutinantes o de adherentes incluyen carboximetilcelulosa o sales de la misma, dextrina, almidón soluble, goma de xantano, goma guar, sacarosa, polivinilpirrolidona, goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, poliácridato de sodio, polietilenglicoles con un peso molecular medio de 6.000 a 20.000, óxidos de polietileno con un peso molecular medio de 100.000 a 5.000.000, fosfolípidos (por ejemplo, cefalina, lecitina, etc.), polvo de celulosa, dextrina, almidón modificado, compuestos quelantes de ácido poliaminocarboxílico, polivinilpirrolidona reticulada, copolímeros de ácido maleico-estireno, copolímeros de ácido (met)acrílico, semiésteres de polímero de alcohol polihídrico y anhídrido dicarboxílico, poliestiren sulfonatos solubles en agua, parafina, terpeno, resinas de poliamida, poliácridatos, polioxietileno, ceras, polivinil alquil éter, condensados de alquilfenol-formaldehído y emulsiones de resinas sintéticas.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

35 Además, para la expansión de la variedad de plagas objetivo y el tiempo apropiado para el control de la plaga o para la reducción de la dosis, el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se puede usar después de mezclar con otros insecticidas agrícolas y hortícolas, acaricidas, parasitoides, microbicidas, parasitoides y/o similares. Además, el insecticida agrícola y hortícola se puede usar después de mezclar con herbicidas, reguladores del crecimiento de la planta, fertilizantes y/o similares, dependiendo de la situación.

45 Los ejemplos de dichos otros insecticidas agrícolas y hortícolas, acaricidas y nematocidas usados para los fines mencionados anteriormente incluyen metilcarbamato de 3,5-xililo (XMC), toxinas proteicas cristalinas producidas por *Bacillus thuringiensis* tal como *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* y *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, compuestos insecticidas derivados de la toxina Bt, CPCBS (clorfenson), DCIP (éter diclorodiisopropílico), D-D (1,3-dicloropropeno), DDT, NAC, O-4-dimetilsulfamioilfenil O,O-dietil fosforotioato (DSP), O-etil O-4-nitrofenil fenilfosfonotioato (EPN), tripipilisocianurato (TPIC), acrinatrina, azadiractina, azinfolos-metilo, acequinocilo, acetamiprid, acetoprol, acefato, abamectina, avermectina-B, amido-flumet, amitraz, alancarb, aldicarb, aldoxcarb, aldrina, alfa-endosulfán, alfa-cipermetrina, albendazol, aletrina, isazofós, isamidofós, isoamidofós isoxatión, isofenofós, isoprocarb (MIPC), ivermectina, imiciafós, imidacloprid, imiprotrina, indoxcarb, esfenvalerato, etiofencarb, etión, etiprol, etoxazol, etofenprox, etoprofós, etrimfós, emamectina, emamectina-benzoato, endosulfán, empentrina, oxamilo, oxidemetón-metilo, oxideprofós (ESP), oxibendazol, oxfendazol, oleato de potasio, oleato de sodio, cadusafós, cartap, carbarilo, carbosulfano, carbofurano, gamma-cihalotrina, xilicarb, quinalfós, kinopreno, cinometionat, cloetocarb, clotianidina, clorfentazina, cromafenozida, clorantraniliprol, cloretóxifós, clordimeform, clordano, clorpirifós, clorpirifós-metilo, clorfenapir, clorfensón, clorfenvinfós, clorfluazurón, clorobencilato, clorobenzoato, kelthane (dicofol), salitión, cianofós (CYAP), diafenturiór, diamidafós, ciantraniliprol, theta-cipermetrina, dienocloro, cienopirafeno, dioxabenzofós, diofenolán, sigma-cipermetrina, diclofentión (ECP), cicoprotrina, diclorvos (DDVP), disulfotón, dinotefurano, cihalotrina, cifenotrina, ciflutrina, diflubenzurón, ciflometofeno, diflovidazina, cihexatina, cipermetrina, dimetilvinfós, dimetoato, dimeflutrina, silafluofeno, ciromacina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espirotetramat, espiromesifeno, sulfluramida, sulprofós, sulfoxaflor, zeta-cipermetrina, diacín, tau-fluvalinato, dazomet, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiociclam, tiosultap, tiosultap-sodio, tionazina, tiometón, deet, dieldrina, tetraclorvinfós, tetradifón, tetrametilflutrina, tetrametrina, tebufupirifós, tebufenozida, tebufenpirad, teflutrina, teflubenzurón, demetón-S-metilo, temefós, deltametrina, terbufós, tralopirilo, tralometrina, transflutrina, triazamato, triazurón, triclamida,

- triclórón (DEP), triflumurón, tolfenpirad, naled (BRP), nitiazina, nitenpiram, novalurón, noviflumurón, hidropreno, vaniliprol, vamidotión, paratión, paratión-metilo, halfenprox, halofenozida, bistriflurón, bisultap, hidrametilnona, almidón de hidroxipropilo, binapacril, bifenazato, bifentrina, pimetrocina, piraclófós, pirafluprol, piridafentión, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazón, piriprol, piriproxifeno, pirimicarb, pirimidifeno, pirimifós-metilo, piretrinas, fipronil, fenazaquina, fenamifós, bromopropilato, fenitrotión (MEP), fenoxicarb, fenotiocarb, fenotrina, fenobucarb, fensulfotión, fentión (MPP), fentoato (PAP), fenvalerato, fenpiroximato, fenpropatrina, fenbendazol, fostiazato, formetanato, butatiofós, buprofezina, furatiocarb, praletrina, fluacripirim, fluazinam, fluazurón, fluensulfona, flucicloxurón, flucirinato, fluvalinato, flupirazofós, flufenimer, flufenoxurón, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, flubrocitrinato, flubendiamida, flumetrina, flurimfeno, protiofós, protrifenbuto, flonicamid, propafós, propargita (BPPS), profenofós, proflutrina, propoxur (PHC), bromopropilato, beta-ciflutrina, hexaflumurón, hexitiazox, heptenofós, permetrina, benclotiaz, bendiocarb, bensultap, benzoximato, benfuracarb, foxim, fosadona, fostiazato, fostietano, fosfamidón, fosfocarb, fosmet (PMP), polinactinas, formetanato, formotión, forato, aceite para máquinas, malatión, milbemicina, milbemicina-A, milbemectina, mecarbam, mesulfenofós, metomilo, metaldehído, metaflumizona, metamidofós, metam-amonio, metam-sodio, metiocarb, metidatión (DMTP), metil isotiocianato, metilneodecanamida, metilparatión, metoxadiazona, metoxicloro, metoxifenozida, metoflutrina, metopreno, metolcarb, meperflutrina, mevinfós, monocrotofós, monosultap, lambdacihalotrina, rianodina, lufenurón, resmetrina, lepimectina, rotenona, clorhidrato de levamisol, óxido de fenbutatina, tartarato de morantel, bromuro de metilo, hidróxido de triciclohexilestaño (cihexatina), cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, azufre y nicotina-sulfato.
- Los microbicidas agrícolas y hortícolas ilustrativos utilizados para los mismos propósitos que los anteriores incluyen aureofungina, azaconazol, azitiram, acipetacs, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, azoxistrobina, anilacina, amisulbrom, amprolifós, ametocradina, alcohol alílico, aldimorf, amobam, isotianilo, isovallediona, isopirazam, isoprothiolano, ipconazol, iprodiona, iprovalicarb, iprobenfós, imazalilo, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, eclomezol, edifenfós, etaconazol, etaboxam, etirimol, etem, etoxiquina, etridiazol, enestroburina, epoxiconazol, oxadixilo, oxicarboxina, quinolinolato de cobre-8, oxitetraciclina, oxinato de cobre, oxpoconazol, fumarato de oxpoconazol, ácido oxolínico, octilnona, ofurace, orisastrobina, metam-sodio, kasugamicina, carbamorf, carpropamid, carbendazim, carboxina, carvona, quinazamida, quinacetol, quinoxifeno, quinometionato, captafol, captán, kiralaxilo, quinconazol, quintoceno, guazatina, cufraneb, cuprobam, gliodina, griseofulvina, climbazol, cresol, kresoxim-metilo, clozolinato, clotrimazol, clobentiazona, cloraniformetano, cloranilo, clorquinox, cloropicrina, clorfenazol, clorodinitronaftaleno, clorotalonilo, cloroneb, zarilamida, salicilanilida, ciazofamid, pirocarbonato de dietilo, dietofencarb, ciclafuramida, diclocimet, diclozolina, diclobutrazol, diclofluanida, cicloheximida, diclomezina, diclorán, diclorofeno, diclona, disulfiram, ditalimfós, ditianona, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinocón, dinosulfón, dinoterbón, dinobutón, dinopentón, dipiritiona, difenilamina, difenoconazol, ciflufenamid, diflumetorim, ciproconazol, ciprodinilo, ciprofuram, cipendazol, simeconazol, dimetirimol, dimetomorf, cimoxanilo, dimoxistrobina, bromuro de metilo, ziram, siltiofam, estreptomycin, espiroamina, sultrapeno, sedaxano, zoxamida, dazomet, tiadiazina, tiadinilo, tiadiflur, tiabendazol, tioximida, tioclorfenfim, tiofanato, tiofanato-metilo, ticiofeno, tioquinox, cinometionat, tifulazamida, tiram, decafentina, tecnazeno, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, ácido deshidroacético, tebuconazol, tebufloquina, dodicina, dodina, dodecil bencensulfonato bis-etilendiamina de cobre (II) (DBEDC), dodemorf, drazoxolona, triadimenol, triadimefón, triazbutil, triazóxido, triamifós, triarimol, triclámida, triciclazol, triticonazol, tridemorf, óxido de tributilestaño, triflumizol, trifloxistrobina, triforina, tolilfluanida, tolclófós-metilo, natamicina, nabam, nitroal-isopropilo, nitrostireno, nuarimol, nonilfenol sulfonato de cobre, halacrinato, validamicina, valifenalato, proteína harpina, bixafeno, picoxistrobina, picobenzamida, bitionol, bitertanol, hidroxiisoxazol-potasio, hidroxiisoxazol-potasio, binapacril, bifenilo, piperalina, himexazol, piraioxistrobina, piracarbolid, piraclostrobin, pirazofós, pirametosrobina, pirifenona, piridinitrilo, pirifenox, piribencarb, pirimetanilo, piroxicloro, piroxifur, piroquilón, vinclozolina, famoxadona, fenapanilo, fenamidona, fenaminosulf, fenarimol, fenitropán, fenoxanilo, ferimzona, ferbam, fentina, fenciclonilo, fenciprazamina, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidina, fenpropimorf, fenhexamida, ftalida, butiobato, butilamina, bupirimato, fuberidazol, blasticidina-S, furametpir, furalaxilo, fluacripirim, fluazinam, fluoxastrobina, flutrimazol, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, furcarbanilo, fluxapiroxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonilo, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, furfural, furmeciclox, flumetover, flumorf, proquinazid, procloraz, procimidona, protiocarb, protioconazol, propamocarb, propiconazol, propineb, furofanato, probenazol, bromuconazol, hexaclorobutadieno, hexaconazol, hexiltiofós, betoxazina, benalaxilo, benalaxilo-M, benodanilo, benomilo, pefurazoato, benquinox, penconazol, benzamorf, pencicurón, ácido benzohidroxámico, bentalarón, bentiazol, bentiavalicarb-isopropilo, pentiopirad, penflufeno, boscalid, fosdifeno, fosetilo, fosetilo-Al, polioxinas, polioxorim, policarbamatao, folpet, formaldehído, aceite para máquinas, maneb, mancozeb, mandipropamid, miclozolina, miclobutanilo, mildiomicina, milneb, mecarbinzida, metasulfocarb, metazoxolona, metam, metam-sodio, metalaxilo, metalaxilo-M, metiram, isotiocianato de metilo, meptildinocap, metconazol, metsulfovax, metfuraxam, metominostrobina, metrafenona, mepanipirim, mefenoxam, meptildinocap, mepronilo, mebenilo, yodometano, rabenzazol, cloruro de cobalto, cloruro de cobre básico, sulfato de cobre básico, microbicidas inorgánicos tales como plata, hipoclorito de sodio, hidróxido cúprico, azufre humectable, polisulfuro de calcio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, azufre, anhídrido de sulfato de cobre, dimetilditiocarbamato de níquel, compuestos de cobre tales como quinolinolato de cobre-8 (oxina de cobre), sulfato de cinc y sulfato de cobre pentahidratado.
- Los herbicidas ilustrativos usados para los mismos fines anteriores incluyen 1-natilacetamida, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, ioxinilo, aclonifeno, azafenidina, acifluorfen, aziprotrina, azimsulfurón, asulam, acetoclor,

atrazina, atratón, anisurón, anilofós, aviglicina, ácido abscísico, amicarbazona, amidosulfurón, amitrol, aminociclopiracloro, aminopirralida, amibuzina, amiprofós-metilo, ametrídiona, ametrina, alacloro, alidocloro, aloxidim, alorac, isourón, isocarbamida, isoxaclortol, isoxapirifop, isoxaflutol, isoxabeno, isocilo, isonorurón, isoproturón, isopropalina, isopolinato, isometiozina, inabenfida, ipacina, ipfencarbazona, iprimidam, imazaquin, imazapic, imazapir, imazametapir, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazetapir, imazosulfurón, indaziflam, indanofán, ácido indolbutírico, uniconazol-P, eglinazina, esprocarb, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etalfuralina, etiolato, eticlozato-etilo, etidimurón, etinofeno, etefón, etoxisulfurón, etoxifeno, etnipromida, etofumesato, etobenzanid, epronaz, erbón, endotal, oxadiazón, oxadiargilo, oxaziclomefona, oxasulfurón, oxapirazona, oxifluorfenó, orizalina, ortosulfamurón, orbencarb, cafenstrol, cambendiclor, carbasulam, carfentrazona, carfentrazona-etilo, carbutilato, carbetamida, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etilo, xilaclor, quinoclamina, quinonamida, quinclozac, quinmerac, cumilurón, clodinato, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, credazina, cletodim, cloxifonac, clodinafop, clodinafop-propargilo, clorotolurón, clopiralid, cloproxidim, cloprop, clorbromurón, clofop, clomazona, clometoxinilo, clometoxifeno, clomeprop, clorazifop, clorazina, cloransulam, cloranocrilo, clorambeno, cloransulam-metilo, cloridazón, clorimurón, clorimurón-etilo, clorsulfurón, clortal, clortiamida, clortolurón, clornitrofenó, clorfenac, clorfenprop, clorbufam, clorflurazól, clorflurenol, clorprocarb, clorprofam, clormequat, clorurón, cloroxinilo, cloroxurón, cloropón, saflufenacilo, cianazina, cianatrina, di-alato, diurón, dietamquat, dicamba, ciclurón, cicloato, cicloxidim, diclosulam, ciclosulfamurón, diclorprop, diclorprop-P, diclobenilo, diclofop, diclofop-metilo, diclormato, dicloralurea, diquat, cisanilida, disul, sidurón, ditopir, dinitramina, cinidón-etilo, dinosam, cinosulfurón, dinoseb, dinoterb, dinofenato, dinoprop, cihalofop-butilo, difenamida, difenoxurón, difenopenteno, difenzoquat, cibutrina, ciprazina, ciprazol, diflufenicán, diflufenzopir, dipropetrina, cipromid, ciperquat, giberelina, simazina, dimexano, dimetaclor, dimidazona, dimetametrina, dimetenamid, simetrina, simetón, dimepiperato, dimefurón, cinmetilina, swep, sulglicapina, sulcotriona, sulfalato, sulfentrazona, sulfosulfurón, sulfometurón, sulfometurón-metilo, sebumetón, setoxidim, sebutilazina, terbacilo, daimurón, dazomet, dalapón, tiazaflurón, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tiocarbazilo, tioclorim, tiobencarb, tidiazimina, tidiazurón, tifensulfurón, tifensulfurón-metilo, desmedifam, desmetrina, tetraflurón, tenilcloro, tebutam, tebutiurón, terbutmetón, tepraloxidim, tefuriltriona, tembotriona, delacloro, terbacilo, terbucarb, terbucloro, terbutilazina, terbutrina, topamezona, tralcoxidim, triaziflam, triasulfurón, tri-alato, trietazina, tricamba, tricopir, tridifano, tritac, tritosulfurón, triflusulfurón, triflusulfurón-metilo, trifluralina, trifloxisulfurón, tripropindan, tribenurón-metilo, tribenurón, trifop, trifopsima, trimeturón, naptalam, naproanilida, napropamida, nicosulfurón, nitalina, nitrofenó, nitrofluorfenó, nipiraclofenó, neburón, norflurazón, norurón, barban, paclobutrazol, paraquat, paraflurón, haloxidina, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-metilo, halosafeno, halosulfurón, halosulfurón-metilo, picloram, picolinafeno, biciclopirona, bispiribac, bispiribac-sodio, pidanón, pinoxadén, bifenox, piperofos, himexazol, piraclonilo, piraclufotol, pirazoxifeno, pirazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, pirazolato, bilanafós, piraflufen-etilo, piriclor, piridafol, piritiobac, piritiobac-sodio, piridato, piriftalid, piributicarb, piribenzoxim, pirimisulfano, primisulfurón, piriminobac-metilo, piroxasulfona, piroxsulam, fenasulam, fenisofam, fenurón, fenoxasulfona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenotiól, fenoprop, fenobenzurón, fentiaprop, fenteracol, fentrazamida, fenmedifam, fenmedifam-etilo, butacloro, butafenacilo, butamifós, butiurón, butidazol, butilato, buturón, butenaclo, butroxidim, butralina, flazasulfurón, flamprop, furiloxifeno, prinaclo, primisulfurón-metilo, fluaizifop, fluaizifop-P, fluaizifop-butilo, fluaizolato, fluoxipir, fluotiurón, fluometurón, fluoroglicofeno, fluorocloridona, fluorodifeno, fluoronitrofenó, fluoromidina, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucloalinala, flucetosulfurón, flutiacet, flutiacet-metilo, flupirsulfurón, flufenacet, flufenicán, flufenpir, flupropacilo, flupropionato, flupoxam, flumioxazina, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumipropina, flumezina, fluometurón, flumetsulam, fluridona, flurtamona, fluoxipir, pretilacloro, proxián, proglinazina, prociazina, prodiamina, prosulfalinala, prosulfurón, prosulfocarb, propaquizafop, propacloro, propazina, propanilo, propizamida, propisocloro, prohidrojamón, propirisulfurón, profam, profluaizol, profluralina, prohexadiona-calcio, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, profoxidim, bromacilo, brompirazona, prometrina, prometón, bromoxinilo, bromofenoxim, bromobutida, bromobonilo, florasulam, hexacloroacetona, hexazinona, petoxamid, benzolina, penoxsulam, pebulato, beflubutamid, vernolato, perfluidona, bencarbazona, benzadox, benzipram, bencilaminopurina, benztiázurón, benzfendizona, bensulida, bensulfurón-metilo, benzoilprop, benzobiciclón, benzofenap, benzofluoro, bentazona, pentanocloro, bentiocarb, pendimetalina, pentoxazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, fomesafeno, foramsulfurón, forclorfenurón, hidrazida maleica, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfurón, mesosulfurón-metilo, mesotriona, mesoprazina, metoprotina, metazaclor, metazol, metazosulfurón, metabenztiázurón, metamitrón, metamifop, metam, metalpropalina, metiurón, metiozolina, metiobencarb, metildimrón, metoxurón, metosulam, metsulfurón, metsulfurón-metilo, metflurazón, metobromurón, metobenzurón, metometón, metolaclo, metribuzina, cloruro de mepiquat, mefenacet, mefluidida, monalida, monisourón, monurón, ácido monocloroacético, monolinurón, molinato, morfamquat, yodosulfurón, yodosulfurón-metil-sodio, yodobonilo, yodometano, lactofeno, linurón, rimsulfurón, lenacilo, rodetanilo, peróxido de calcio y bromuro de metilo.

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

Otros ejemplos de bioplaguicidas incluyen depredadores naturales tales como *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*,

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

5 El compuesto de la presente invención o una sal del mismo también es adecuado para la desinfección de parásitos que viven en el interior o el exterior de animales tales como seres humanos, animales domésticos y mascotas. El animal puede ser un animal no humano.

10 La presente invención también incluye un agente de control de ectoparásitos animales que comprende el compuesto de la presente invención o una sal del mismo como principio activo; y un método para controlar ectoparásitos animales, que comprende tratar ectoparásitos animales con el agente de control de ectoparásitos animales. El compuesto de la presente invención se puede utilizar mediante aplicación puntual o por vertido, normalmente en uno o dos sitios de la piel de un animal, tal como un gato o un perro. El área de aplicación suele ser de 5 a 10 cm². Una vez aplicado, el
15 compuesto de la presente invención se difunde preferentemente por todo el cuerpo del animal y luego se seca sin cristalización o cambios en la apariencia visual o textura. La cantidad preferible del compuesto utilizado se selecciona entre el intervalo de 0,1 a 10 ml según el peso del animal, y en particular, es de aproximadamente 0,5 a 1 ml para un gato y de aproximadamente 0,3 a 3 ml para un perro.

20 El agente de control de ectoparásitos de la presente invención es efectivo contra, por ejemplo, los siguientes ectoparásitos animales. Los parásitos Siphonaptera incluyen las especies del género *Pulex*, tales como *Pulex irritans*; las especies del género *Ctenocephalides*, tales como *Ctenocephalides felis* y *Ctenocephalides canis*; las especies del género *Xenopsylla*, tales como *Xenopsylla cheopis*; las especies del género *Tunga*, tales como *Tunga penetrans*; las especies del género *Echidnophaga*, tales como *Echidnophaga gallinacea*; y las especies del género *Nosopsyllus*, tales
25 como *Nosopsyllus fasciatus*.

Los parásitos Siphunculata incluyen las especies del género *Pediculus*, tales como *Pediculus humanus capitis*; las especies del género *Pthirus*, tales como *Pthirus pubis*; las especies del género *Haematopinus*, tales como *Haematopinus eurytetrus* y *Haematopinus suis*; las especies del género *Damalinia*, tales como *Damalinia ovis* y
30 *Damalinia bovis*; las especies del género *Linognathus*, tales como *Linognathus vituli* y *Linognathus ovillus* (parásito en el tronco del cuerpo de una oveja); y las especies del género *Solenopotes*, tales como *Solenopotes capillatus*.

Los parásitos Mallophaga incluyen las especies del género *Menopon*, tales como *Menopon gallinae*; *Trimenopon* spp.; *Trinoton* spp.; las especies del género *Trichodectes*, tales como *Trichodectes canis*; la especie del género *Felicola*, tales como *Felicola subrostratus*; las especies del género *Bovicola*, tales como *Bovicola bovis*; las especies del género *Menacanthus*, tales como *Menacanthus stramineus*; *Werneckiella* spp.; y *Lepikentron* spp.

Los parásitos hemípteros incluyen las especies del género *Cimex*, tales como *Cimex lectularius* y *Cimex hemipterus*; las especies del género *Reduvius*, tales como *Reduvius senilis*; las especies del género *Arilus*, tales como *Arilus*
40 *critatus*; las especies del género *Rhodnius*, tales como *Rhodnius prolixus*; las especies del género *Triatoma*, tales como *Triatoma rubrofasciata*; y *Panstrongylus* spp.

Los parásitos Acarina incluyen las especies del género *Amblyomma* tales como *Amblyomma americanum* y *Amblyomma maculatum*; las especies del género *Boophilus*, tales como *Boophilus microplus* y *Boophilus annulatus*; las especies del género *Dermacentor*, tales como *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor taiwanensis* y *Dermacentor andersoni*; las especies del género *Haemaphysalis* tales como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava* y *Haemaphysalis*
45 *campanulata*; las especies del género *Ixodes*, tales como *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes pacificus* e *Ixodes holocyclus*; las especies del género *Rhipicephalus* tales como *Rhipicephalus sanguineus* y *Rhipicephalus appendiculatus*; las especies del género *Argas*, tales como *Argas persicus*; las especies del género *Ornithodoros*, tales como *Ornithodoros hermsi* y *Ornithodoros turicata*; las especies del género *Psoroptes*, tales como *Psoroptes ovis* y *Psoroptes equi*; las especies del género *Knemidocoptes*, tales como *Knemidocoptes mutans*; las especies del género *Notoedres*, tales como *Notoedres cati* y *Notoedres muris*; las especies del género *Sarcoptes*, tales como *Sarcoptes scabiei*; las especies del género *Otodectes*, tales como *Otodectes cynotis*; las especies del género *Listrophorus*, tales como *Listrophorus gibbus*; *Chorioptes* spp.; *Hypodectes* spp.; *Pterolichus* spp.; *Cytodites*
50 spp.; *Laminosioptes* spp.; las especies del género *Dermanyssus*, tales como *Dermanyssus gallinae*; las especies del género *Ornithonyssus*, tales como *Ornithonyssus sylviae* y *Ornithonyssus bacoti*; las especies del género *Varroa*, tales como *Varroa jacobsoni*; las especies del género *Cheyletiella*, tales como *Cheyletiella yasguri* y *Cheyletiella blakei*; *Ornithocheyletia* spp.; las especies del género *Demodex*, tales como *Demodex canis* y *Demodex cati*; *Myobia* spp.; *Psorergates* spp.; y las especies del género *Trombicula*, tales como *Trombicula akamushi*, *Trombicula pallida* y
60 *Trombicula scutellaris*. Se prefieren los parásitos Siphonaptera, parásitos Siphunculata y parásitos Acarina.

Los animales a los que se les puede administrar el agente de control de ectoparásitos de la presente invención pueden ser animales huéspedes de los ectoparásitos animales antes mencionados. Dichos animales suelen ser homeotermos y poiquilotermos que se crían como animales domésticos o mascotas. Dichos homeotermos incluyen mamíferos tales como ganado vacuno, búfalos, ovejas, cabras, cerdos, camellos, ciervos, gamos, renos, caballos, burros, perros, gatos, conejos, hurones, ratones, ratas, hámsteres, ardillas y monos; animales de peletería, tales como visones,

chinchillas y mapaches; y aves, tales como gallinas, gansos, pavos, patos domésticos, pichones, loros y codornices. Los poiquiloterms antes mencionados incluyen reptiles, tales como tortugas, tortugas de mar, galápagos americanos, tortugas de estanque japonesas, lagartos, iguanas, camaleones, salamandras, pitones, serpientes colúbridas y cobras. Se prefieren los homeoterms, y más preferidos son mamíferos, tales como perros, gatos, ganado bovino, caballos, cerdos, ovejas y cabras.

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

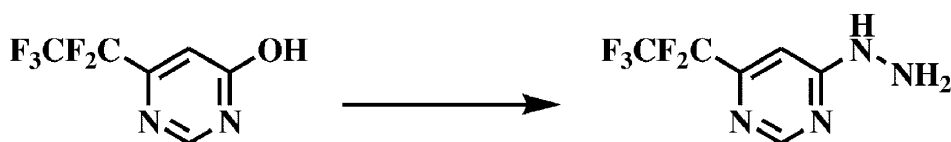
Ejemplos

Ejemplo de producción del intermedio 1

Método de producción de

4-hidrazinil-6-(pentafluoroetil)pirimidina

[Quím. 11]



Se disolvió 6-(pentafluoroetil)pirimidin-4-ol (150 mg, 0,701 mmol), que se sintetizó mediante el método descrito en el documento WO 2010/134478, en acetonitrilo (2,5 ml). A esto, se le añadió POCl_3 (0,260 ml, 2,80 mmol) y la mezcla se agitó a reflujo durante 1 hora. Después de eso, se añadió agua para detener la reacción y la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. Se añadieron al residuo hidrato de hidrazina (69,0 μl , 1,40 mmol) y EtOH (2,5 ml), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una vez finalizada la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar 4-hidrazinil-6-(pentafluoroetil)pirimidina (88,0 mg, 0,386 mmol, 50 %).

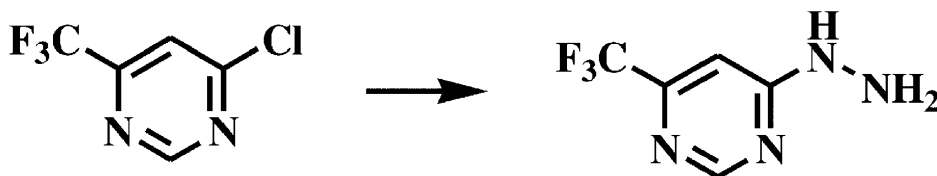
Propiedad física: Punto de fusión de 128 a 130 °C

Ejemplo de producción del intermedio 2

Método de producción de

4-hidrazinil-6-(trifluorometil)pirimidina

[Quím. 12]



Se añadieron $\text{NH}_2\text{NH}_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$ (163 μl , 3,33 mmol) y EtOH (8,1 ml) a 4-cloro-6-(trifluorometil)pirimidina comercial (289 mg, 1,58 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una vez finalizada la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro y se filtró, y el filtrado se concentró para dar 4-hidrazinil-6-(trifluorometil)pirimidina (249 mg, 1,40 mmol, 88 %).

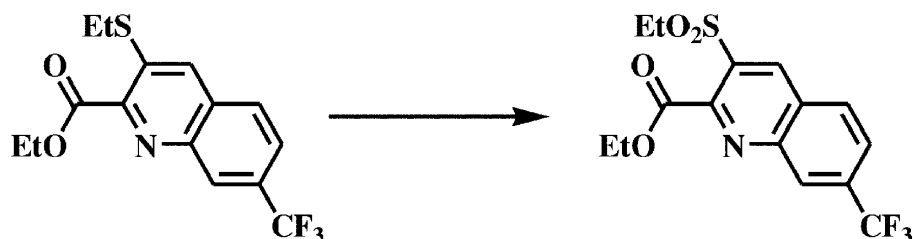
Propiedad física: Punto de fusión de 109 a 111 °C

Producción del intermedio 3-1

Método de producción de

éster etílico del ácido 3-(etilsulfonil)-7-(trifluorometil)quinolina-2-carboxílico

[Quím. 13]



Se disolvió éster etílico del ácido 3-(etilsulfonil)-7-(trifluorometil)quinolina-2-carboxílico (300 mg, 0,911 mmol), que se sintetizó mediante el método descrito en el documento WO 2016/091731, en acetato de etilo (20 ml). A esto, se le añadió m-CPBA (ácido meta-cloroperbenzoico) (aprox. el 70 % en peso, bromodifenilmetano (561 mg, 2,28 mmol), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Una vez finalizada la reacción, se añadieron una solución acuosa de tiosulfato de sodio y una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y la mezcla se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar éster etílico del ácido 3-(etilsulfonil)-7-(trifluorometil)quinolin-2-carboxílico (126 mg, 0,349 mmol, 38 %).

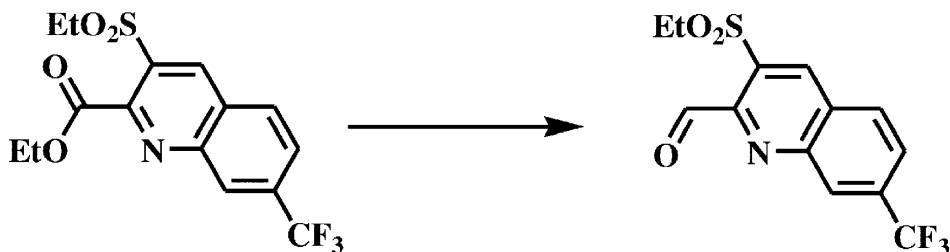
Propiedad física: Punto de fusión de 143 a 145 °C

Ejemplo de producción del intermedio 3

Método de producción de

3-(etilsulfonil)-7-(trifluorometil)quinolina-2-carbaldehído

[Quím. 14]



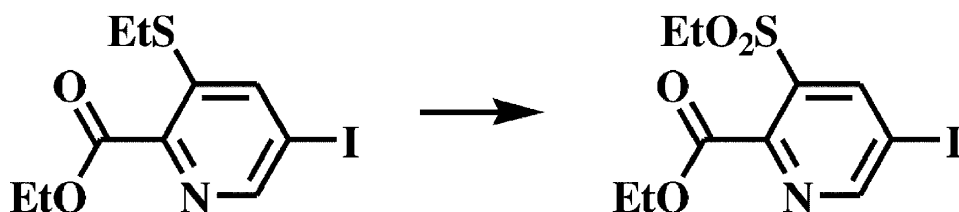
Se disolvió éster etílico del ácido 3-(etilsulfonil)-7-(trifluorometil)quinolin-2-carboxílico (95,0 mg, 0,263 mmol) en THF (2,3 ml). A esto, se le añadió DIBAL (1 M en tolueno, 0,320 ml, 0,320 mmol) a -78 °C y la mezcla se agitó durante 3 horas. Después de eso, se añadieron una solución acuosa de sal de Rochelle y MeOH para detener la reacción y la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-(etilsulfonil)-7-(trifluorometil)quinolin-2-carbaldehído (50,0 mg, 0,158 mmol, 60 %).

Propiedad física: Punto de fusión de 114 a 116 °C

Ejemplo de producción del intermedio 4-2

Método de producción de éster etílico del ácido 3-(etilsulfonil)-5-yodopicolínico

[Quím. 15]



Se disolvió éster etílico del ácido 3-(etiltio)-5-yodopicolínico (1,40 g, 4,15 mmol), que se sintetizó mediante el método descrito en el documento WO 2017/065183, en acetato de etilo (30 ml). A esto, se le añadió m-CPBA (aprox. al 70 % en peso, bromodifenilmetano (2,56 g, 10,38 mmol), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Una vez finalizada la reacción, se añadieron una solución acuosa de tiosulfato de sodio y una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y la mezcla se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar éster etílico del ácido 3-(etilsulfonyl)-5-yodopicolínico con un rendimiento cuantitativo.

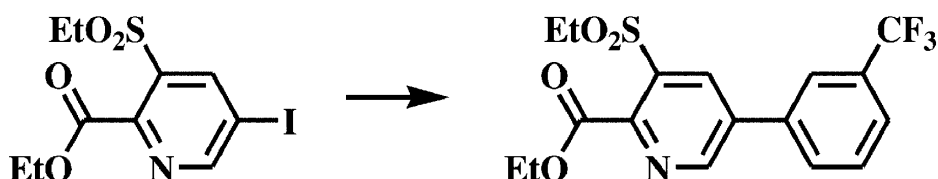
Propiedad física: Punto de fusión de 67 a 69 °C

Ejemplo de producción del intermedio 4-1

Método de producción de

éster etílico del ácido 3-(etilsulfonyl)-5-(3-(trifluorometil)fenil)picolínico

[Quím. 16]



Se mezclaron éster etílico del ácido 3-(etilsulfonyl)-5-yodopicolínico (758 mg, 2,05 mmol), ácido 3-(trifluorometil)fenilborónico (586 mg, 3,08 mmol), Pd(PPh₃)₄ (117 mg, 0,205 mmol), Cs₂CO₃ (1,33 g, 4,10 mmol), DME (1,2-dimetoxietano) (28 ml) y H₂O (7 ml), y la mezcla se agitó a reflujo durante 2 horas. Una vez finalizada la reacción, Se realizó la filtración con Celite y el filtrado se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar éster etílico del ácido 3-(etilsulfonyl)-5-(3-(trifluorometil)fenil)picolínico (263 mg, 0,679 mmol, 33 %).

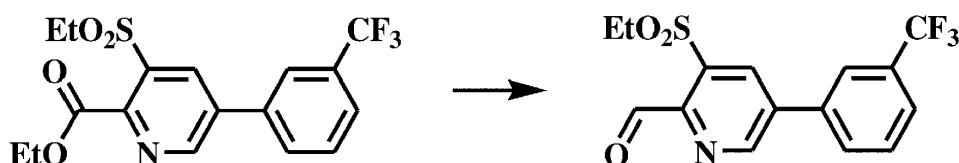
Propiedad física: Punto de fusión de 92 a 94 °C

Ejemplo de producción del intermedio 4

Síntesis de

3-(etilsulfonyl)-5-(3-(trifluorometil)fenil)picolina aldehído

[Quím. 7]



Se disolvió éster etílico del ácido 3-(etilsulfonyl)-5-(3-(trifluorometil)fenil)picolínico (740 mg, 1,91 mmol) en THF (20 ml). A esto, se le añadió DIBAL (1 M en tolueno, 2,3 ml, 2,30 mmol) a -78 °C y la mezcla se agitó durante 3 horas. Después de eso, se añadieron una solución acuosa de sal de Rochelle y MeOH para detener la reacción y la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía

en columna de gel de sílice para dar 3-(etilsulfonil)-5-(3-(trifluorometil)fenil)picolina aldehído (290 mg, 0,845 mmol, 44 %).

Propiedad física: Punto de fusión de 116 a 117 °C

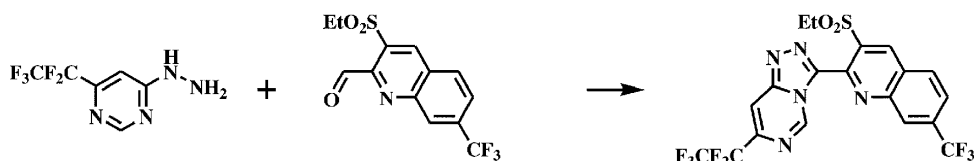
5

Ejemplo 1

Método de producción de

10 3-(etilsulfonil)-2-(7-pentafluoroetil)-[1,2,4]triazolo[4, 3-c]pirimidin-3-il-7-(trifluorometil)quinolina (compuesto número 4-27)

[Quím. 18]



15

Se disolvió 3-etilsulfonil-7-(trifluorometil)quinolin-2-carbaldehído (17,0 mg, 0,0536 mmol) en EtOH (4,0 ml). A esto, se le añadió 4-hidrazinil-6-(pentafluoroetil)pirimidina (12,2 mg, 0,0536 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Una vez finalizada la reacción, se recogió el precipitado por filtración. El residuo (5,0 mg) se disolvió en tolueno (3,0 ml). A esto, se le añadió diacetato de yodobenceno (BAIB) (4,0 mg, 0,0123 mmol) y la mezcla se agitó a 70 °C durante 1 hora. Después de eso, se añadió una solución acuosa de tiosulfato de sodio para detener la reacción y la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar el compuesto deseado (5,0 mg, 0,00952 mmol, 18 %).

20

25

Propiedad física: Punto de fusión de 212 a 214 °C

Ejemplo 2-1

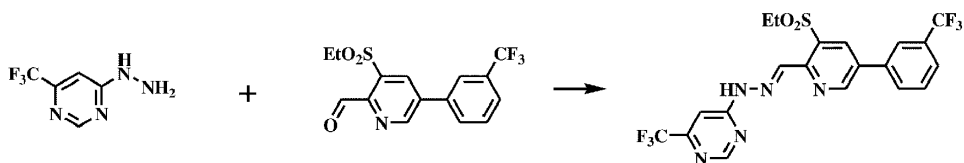
30

Método de producción de

4-(2-((3-(etilsulfonil)-5-(3-(trifluorometil)fenil)piridin-2-il)metilen)hidrazinil)-6-(trifluorometil)pirimidina

35

[Quím. 19]



40

Se disolvió 3-(etilsulfonil)-5-(3-(trifluorometil)fenil)picolina aldehído (150 mg, 0,437 mmol) en EtOH (30 ml). A esto, se le añadió 4-hidrazinil-6-(trifluorometil)pirimidina (78,0 mg, 0,437 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Una vez finalizada la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar 4-(2-((3-(etilsulfonil)-5-(3-(trifluorometil)fenil)piridin-2-il)metilen)hidrazinil)-6-(trifluorometil)-pirimidina (131 mg, 0,260 mmol, 60 %).

45

Propiedad física: Punto de fusión de 223 a 225 °C

Ejemplo 2-2

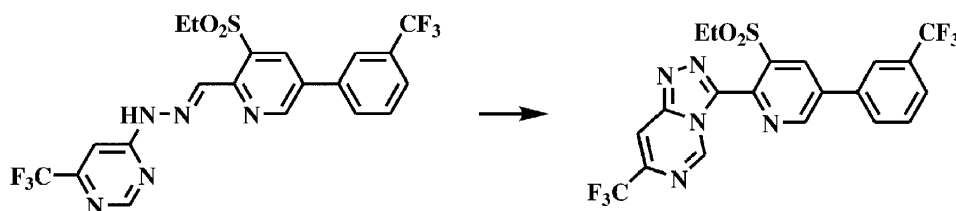
Método de producción de

50

3-(3-(etilsulfonil)-5-(3-(trifluorometil)fenil)piridin-2-il)-(7-trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-c]pirimidina (compuesto número 2-36)

55

[Quím. 20]



Se disolvió 4-(2-((3-(etilsulfonil)-5-(3-(trifluorometil)fenil)piridin-2-il)metilen)hidrazinil)-6-(trifluorometil)-pirimidina (97,0 mg, 0,193 mmol) en tolueno (10 ml). A esto, se le añadió BAIB (81,0 mg, 0,251 mmol) y la mezcla se agitó a 60 °C durante 1 hora. Después de eso, se añadió una solución acuosa de tiosulfato de sodio para detener la reacción y la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar 3-(3-(etilsulfonil)-5-(3-(trifluorometil)fenil)piridin-2-il)-(7-trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-c]pirimidina (74,0 mg, 0,148 mmol, 76 %).

Propiedad física: Punto de fusión de 214 a 216 °C

En lo sucesivo en el presente documento, se muestran ejemplos de formulación, pero la presente invención no se limita a los mismos. En los ejemplos de formulación, "partes" significa partes en peso.

Ejemplo de formulación 1

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

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

Ejemplo de formulación 2

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

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

Ejemplo de formulación 3

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

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

Ejemplo de formulación 4

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

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

En lo sucesivo en el presente documento, se muestran ejemplos de prueba en relación con la presente invención, pero

la presente invención no se limita a los mismos.

Ejemplo de prueba 1

5 Prueba de eficacia de control en *Myzus persicae*

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

[Fórm. matem. 1]

$$\text{Velocidad de control} = 100 - \left\{ (T \times Ca) / (Ta \times C) \right\} \times 100$$

Ta: el número de supervivientes antes de la aplicación foliar en una parcela de tratamiento

T: el número de supervivientes después de la aplicación foliar en una parcela de tratamiento

Ca: el número de supervivientes antes de la aplicación foliar en una parcela sin tratamiento

C: el número de supervivientes después de la aplicación foliar en una parcela sin tratamiento

25 Criterios

A: la tasa de control es del 100 %.

B: la tasa de control es del 90 al 99 %.

C: la tasa de control es del 80 al 89 %.

D: la tasa de control es del 50 al 79 %.

Como resultado, los compuestos 1-1, 1-11, 1-21, 1-41, 1-44, 1-51, 1-52, 1-53, 1-56, 2-1, 2-16, 2-21, 2-26, 2-31, 2-36, 2-37, 2-41, 2-46, 2-56, 2-66, 2-67, 2-68, 2-69, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-74, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 4-27, 4-31, 4-41, 5-26, y 5-46 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Ejemplo de prueba 2

40 Prueba insecticida en *Laodelphax striatellus*

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

[Fórm. matem. 2]

Tasa de mortalidad corregida (%)

$$= 100 \times (\text{tasa de supervivencia en una parcela sin tratamiento} - \text{tasa de supervivencia en una parcela de tratamiento}) / \text{tasa de supervivencia en una parcela sin tratamiento}$$

Tasa de mortalidad corregida

A: la tasa de mortalidad corregida es del 100 %.

B: la tasa de mortalidad corregida es del 90 al 99 %.

C: la tasa de mortalidad corregida es del 80 al 89 %.

D: la tasa de mortalidad corregida es del 50 al 79 %.

Como resultado, los compuestos 1-1, 1-11, 1-21, 1-41, 1-44, 1-51, 1-52, 1-53, 1-56, 2-1, 2-16, 2-21, 2-26, 2-31, 2-36, 2-37, 2-41, 2-46, 2-56, 2-66, 2-67, 2-68, 2-69, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-74, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 4-27, 4-31, 4-41, 5-26, y 5-46 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Ejemplo de prueba 3

Prueba insecticida en *Plutella xylostella*

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

15 [Fórm. matem. 3]

Tasa de mortalidad corregida (%)

20
$$= 100 \times (\text{Número de larvas eclosionadas en una parcela sin tratamiento} - \text{Número de larvas eclosionadas en una parcela de tratamiento}) / \text{Número de larvas eclosionadas en una parcela sin tratamiento}$$

25 Como resultado, los compuestos 1-1, 1-11, 1-21, 1-41, 1-44, 1-51, 1-52, 1-53, 1-56, 2-1, 2-16, 2-21, 2-26, 2-31, 2-36, 2-37, 2-41, 2-46, 2-56, 2-66, 2-67, 2-68, 2-69, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-74, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 4-27, 4-31, 4-41, 5-26, y 5-46 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

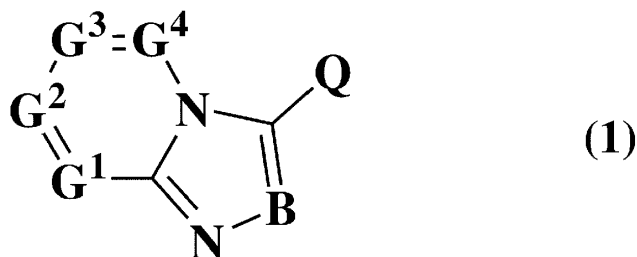
Aplicabilidad industrial

30 El compuesto de la presente invención es altamente eficaz para el control de un amplio espectro de plagas agrícolas y hortícolas y por lo tanto es útil.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1):

5 [Quím. 1]



{en donde

10 B representa un átomo de nitrógeno o C-R⁰, en donde R⁰ representa

- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un átomo de halógeno;
- (a3) un grupo nitro;
- 15 (a5) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a6) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
- 20 (a10) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (a11) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
- (a12) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
- (a13) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

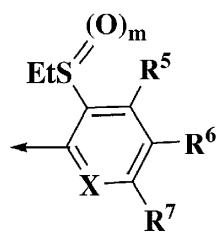
25 G¹ representa un átomo de nitrógeno o C-R¹,
 G² representa un átomo de nitrógeno o C-R²,
 G³ representa un átomo de nitrógeno o C-R³,
 G⁴ representa un átomo de nitrógeno o C-R⁴

30 (en donde R¹, R², R³ y R⁴ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno

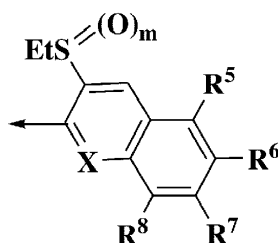
- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un átomo de halógeno;
- 35 (a3) un grupo nitro;
- (a4) N(R²⁰)(R²¹) (en donde R²⁰ y R²¹ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo cicloalquilo (C₃-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆) o un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);
- (a5) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- 40 (a6) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
- (a10) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- 45 (a11) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
- (a12) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
- (a13) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), y

50 Q representa un grupo de anillo representado por cualquiera de las siguientes fórmulas estructurales Q-1, Q-2 y Q-3:

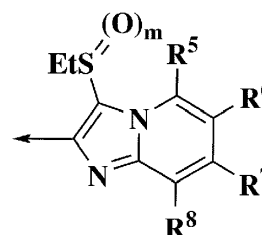
[Quím. 2]



(Q-1)



(Q-2)



(Q-3)

(en donde

m representa 0, 1 o 2,

R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸ pueden ser iguales o diferentes, y representan cada uno

(b1) un átomo de hidrógeno;

(b2) un átomo de halógeno;

(b3) un grupo formilo;

(b4) un grupo alquilo (C₁-C₆);

(b5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);

(b6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆) alquilo (C₁-C₆);

(b7) un grupo alcoxi (C₁-C₆);

(b8) un grupo alquiltio (C₁-C₆);

(b9) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);

(b10) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);

(b11) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);

(b12) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);

(b13) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);

(b14) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆);

(b15) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);

(b16) N(R²⁰)(R²¹) (en donde R²⁰ y R²¹ son como se han definido anteriormente)

(b17) C(R²⁰)=NO(R²¹) (en donde R²⁰ y R²¹ son como se han definido anteriormente);

(b18) un grupo arilo; o

(b19) un grupo arilo que tiene, en un anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆) alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆), (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), (p) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆), (q) un grupo carboxilo y (r) un grupo alcoxycarbonilo (C₁-C₆), y

X representa un átomo de nitrógeno o CH (cada flecha representa la unión al grupo heterocíclico condensado))) y

una sal del mismo.

2. El compuesto heterocíclico condensado y la sal según la reivindicación 1, en donde Q es Q-2.

3. El compuesto heterocíclico condensado y la sal según la reivindicación 1, en donde Q es Q-1.

4. Uso del compuesto heterocíclico condensado o la sal según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 como insecticida agrícola y hortícola.

5. Un método para usar un insecticida agrícola y hortícola, que comprende tratar plantas o suelo con un principio activo del insecticida agrícola y hortícola especificado en la reivindicación 4.

6. Un método para controlar plagas agrícolas y hortícolas, que comprende tratar plantas o suelo con una cantidad eficaz del insecticida agrícola y hortícola especificado en la reivindicación 4.

7. Un agente de control de ectoparásitos de animales no humanos que comprende el compuesto heterocíclico condensado o la sal según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 como principio activo.

8. Un agente de control de ectoparásitos de animales no humanos según la reivindicación 7 para su uso en un método para controlar ectoparásitos de animales no humanos, que comprende tratar ectoparásitos de animales no humanos con una cantidad eficaz del agente de control de ectoparásitos de animales no humanos según la reivindicación 7.