

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 988 405**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
A01N 47/02 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.06.2020** **PCT/JP2020/023192**
87 Fecha y número de publicación internacional: **17.12.2020** **WO20251013**
96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.06.2020** **E 20822844 (5)**
97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **04.09.2024** **EP 3985004**

54 Título: **Agente químico agrícola y hortícola que contiene un nuevo derivado de imidazopiridin-2-carboxamida como principio activo**

30 Prioridad:

13.06.2019 JP 2019110238

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
20.11.2024

73 Titular/es:

AGRO-KANESHO CO., LTD. (100.0%)
1-8-3, Marunouchi
Chiyoda-ku, Tokyo 100-0005, JP

72 Inventor/es:

OYAMA KATSUAKI;
OJIMA KOHEI;
ARAKI KOICHI;
MORISHITA SAKI y
FUKUCHI TOSHIKI

74 Agente/Representante:

ELZABURU, S.L.P

ES 2 988 405 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

Agente químico agrícola y hortícola que contiene un nuevo derivado de imidazopiridin-2-carboxamida como principio activo

Campo técnico

- 5 La presente invención se refiere a un nuevo compuesto de imidazopiridin-2-carboxamida y a un método para usar el compuesto como principio activo de un agente químico agrícola y hortícola, en particular, como insecticida agrícola y hortícola.

Antecedentes de la técnica

- 10 En el campo de la agricultura y la horticultura, se han desarrollado y aplicado a usos prácticos agentes de control de plagas de plantas con el fin de controlar diversas plagas. Sin embargo, los insecticidas agrícolas y hortícolas usados convencionalmente no siempre son satisfactorios, por ejemplo, en cuanto al efecto insecticida o la eficacia residual y tampoco podría decirse que se satisfacen los requisitos para, por ejemplo, reducciones en el número de aplicaciones y en la cantidad del agente en aplicación.

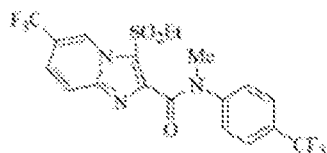
- 15 Además, también se ha convertido en un problema la aparición de diversos ácaros que han adquirido resistencia a los acaricidas usados convencionalmente.

Se desea con impaciencia desarrollar un nuevo insecticida que muestre un efecto de control suficiente con una dosis baja también sobre diversas plagas que han adquirido resistencia a los insecticidas agrícolas y hortícolas usados convencionalmente y que sea menos dañino para el medio ambiente.

- 20 Se han propuesto de diversas formas nuevos acaricidas para responder a estas exigencias, pero no necesariamente cumplen las exigencias anteriores.

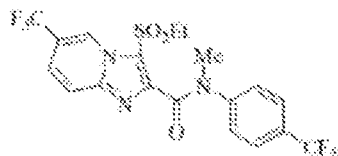
Como derivados de imidazopiridin-2-carboxamida que son similares a la presente invención, se divulgan los siguientes compuestos A y B.

- 25 El documento de patente 1 divulga compuestos que incluyen el siguiente compuesto A. Sin embargo, el documento de patente 1 no divulga ningún grupo N-alquilo ni ningún grupo N-alquiltio, grupos que posee el compuesto de la presente invención.



Documento de patente 1: Compuesto A

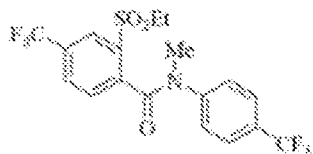
El documento de patente 2 divulga compuestos que incluyen el siguiente compuesto B, pero el sitio de ácido del mismo está limitado a un anillo de piridina, y el documento de patente 2 no divulga ningún anillo de imidazopiridina en absoluto.



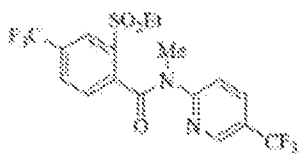
Documento de patente 2: Compuesto B

- 30 Los presentes inventores estudiaron diligentemente y, como resultado, encontraron que el presente compuesto tiene una actividad insecticida significativamente alta en comparación con los compuestos A y B. Tal mejora en la actividad fue completamente inesperada y se reveló por primera vez por los experimentos llevados a cabo por los presentes inventores.

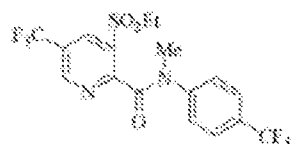
- 35 Por otra parte, se han divulgado documentos de patente que abarcan los siguientes compuestos como derivados de carboxamida que tienen un sitio de ácido de un anillo aromático o un anillo heterocíclico aromático e incluyen un grupo N-alquilo.



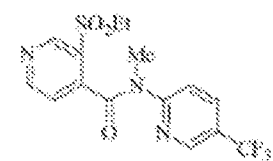
Documento de patente 3



Documento de patente 4



Documento de patente 5



Documento de patente 6



Documento de patente 7

Sin embargo, estos compuestos no son compuestos que tengan un grupo N-alcoxi o un grupo N-alquiltio. Además, la porción del lado de ácido tampoco incluye un anillo de imidazopiridina.

Lista de menciones

Documentos de patente

- 5 Documento de patente 1: JP-A-2018-024660
- Documento de patente 2: JP-A-2019-006740
- Documento de patente 3: WO 2013/191041
- Documento de patente 4: WO 2014/002754
- Documento de patente 5: WO 2014/021468
- 10 Documento de patente 6: WO 2015/067648
- Documento de patente 7: WO 2015/117912

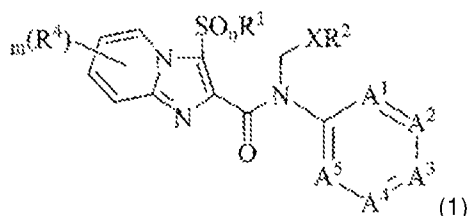
Resumen de la invención

Objeto que va a lograrse por la presente invención

- Un objeto de la presente invención es proporcionar una nueva sustancia útil para controlar diversas plagas en el campo de la agricultura y la horticultura. En particular, la presente invención tiene como objetivo proporcionar una sustancia que presente un alto efecto de control también sobre diversas plagas que tienen resistencia a los agentes convencionales de control de plagas de insectos; que además presente el efecto con una dosis baja; y que tenga una alta seguridad con problemas reducidos de toxicidad residual y problemas ambientales como contaminación ambiental.

Medios para alcanzar el objeto

- Por consiguiente, los presentes inventores han estudiado diligentemente para lograr el objeto anterior y, como resultado, han descubierto que un derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la siguiente fórmula (1), que es un nuevo compuesto que no se describió en la bibliografía, es útil como agentes químicos agrícolas y hortícolas que pueden cumplir las exigencias anteriores, en particular, que son útiles como insecticidas agrícolas y hortícolas, y por tanto se ha logrado la presente invención.
- Es decir, la presente invención se refiere a un derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la siguiente fórmula (1):



[en la fórmula,

R¹ representa un grupo alquilo C₁₋₆ o un grupo haloalquilo C₁₋₆;

- R² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁₋₆ o un grupo haloalquilo C₁₋₆;

X representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o -SO₂-;

A¹, A², A³, A⁴ y A⁵ representan cada uno independientemente un átomo de nitrógeno o C-R³, siempre que dos de A¹, A², A³, A⁴ y A⁵ no sean átomos de nitrógeno al mismo tiempo, y en al menos uno de A¹, A², A³, A⁴ y A⁵ es C-R³,

- los R³ pueden ser iguales o diferentes entre sí, y cada R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo alquenilo C₃₋₆, un grupo alquilino C₃₋₆, un grupo haloalcoxi C₁₋₆, un grupo haloalquenilo C₃₋₆, un grupo haloalquilino C₃₋₆, un grupo alquiltio C₁₋₆, un grupo alquilsulfinilo C₁₋₆, un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo haloalquiltio C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfinilo C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo fenilo opcionalmente sustituido con de uno a cuatro R⁵, un grupo fenoxi opcionalmente sustituido con de uno a cuatro R⁶, o un grupo triazolilo sustituido con uno o dos R⁷, o cuando dos R³ están sustituidos en dos átomos de carbono adyacentes, los dos R³ pueden formar un anillo de 5 o 6 miembros saturado o insaturado junto con tales dos átomos de carbono adyacentes a los que están unidos respectivamente los R³, y

- R⁵, R⁶ y R⁷ representan cada uno independientemente un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo haloalcoxi C₁₋₆, un grupo alquiltio C₁₋₆, un grupo alquilsulfinilo C₁₋₆, un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo haloalquiltio C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfinilo C₁₋₆ o un grupo haloalquilsulfonilo C₁₋₆;

los R⁴ pueden ser iguales o diferentes entre sí y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo nitro o un grupo ciano;

- n representa un número entero de 0 a 2; y

m representa un número entero de 0 a 4],

o su N-óxido o sal, y la presente invención también se refiere al uso del mismo y al método de fabricación del mismo.

Efecto de la invención

El compuesto de la presente invención presenta un excelente efecto como agente químico agrícola y hortícola, en particular, como insecticida agrícola y hortícola. Además, el presente compuesto proporciona un efecto sobre plagas que parasitan a los animales de compañía, como perros y gatos, o al ganado, como vacas y ovejas.

5 Descripción de realizaciones

En la definición del presente compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1), el término "átomo de halógeno" representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un átomo de flúor, el término "grupo alquilo C₁₋₆" representa un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo neopentilo, un grupo terc-pentilo, un grupo n-hexilo y un grupo isohexilo, el término "grupo haloalquilo C₁₋₆" representa el grupo alquilo de cadena lineal o ramificada prescrito anteriormente que tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes, preferiblemente de 1 a 3, y el término "grupo cicloalquilo C₃₋₈" representa un grupo cicloalquilo que tiene de 3 a 8, preferiblemente de 3 a 6 átomos de carbono, como grupos ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y ciclooctilo.

Los ejemplos del término "grupo haloalquilo C₁₋₆" incluyen los grupos alquilo de cadena lineal o ramificada prescritos anteriormente que tienen de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con de 1 a 13, preferiblemente de 1 a 9 átomos de halógeno, como un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo bromodifluorometilo, un grupo diclorodifluorometilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2-yodoetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 1-fluoroisopropilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 3-bromopropilo, un grupo heptafluoropropilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4-clorobutilo, un grupo nonafluorobutilo, un grupo 5,5,5-trifluoropentilo, un grupo 5-cloropentilo, un grupo undecafluoropentilo, un grupo 6,6,6-trifluorohexilo, un grupo 6-clorohexilo y un grupo tridecafluorohexilo.

Los ejemplos del término "grupo alcoxi C₁₋₆" incluyen grupos alcoxi de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, como 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-pentoxi y un grupo n-hexiloxi.

Los ejemplos del término "grupo haloalcoxi C₁₋₆" incluyen los grupos alcoxi de cadena lineal o ramificada prescritos anteriormente que tienen de 1 a 6 átomos de carbono sustituidos con de 1 a 9 átomos de halógeno, como un grupo fluorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo clorodifluorometoxi, un grupo bromodifluorometoxi, un grupo diclorodifluorometoxi, un grupo 1-fluoroetoxi, un grupo 2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 2-bromoetoxi, un grupo 2-yodoetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo 1-fluoroisopropoxi, un grupo 3-fluoropropoxi, un grupo 3-cloropropoxi, un grupo 3-bromopropoxi, un grupo 4-fluorobutoxi y un grupo 4-clorobutoxi.

Los ejemplos del término "grupo alqueniloxi C₃₋₆" incluyen grupos alqueniloxi de cadena lineal o ramificada que tienen de 3 a 6, preferiblemente de 3 a 5 átomos de carbono y que tienen al menos un doble enlace en una posición arbitraria, como un grupo aliloxi, un grupo isopropeniloxi, un grupo 2-buteniloxi, un grupo 3-buteniloxi, un grupo 1-metil-2-propeniloxi, un grupo 2-penteniloxi, un grupo 3-penteniloxi, un grupo 4-penteniloxi, un grupo 1,1-dimetil-2-propeniloxi, un grupo 1-etil-2-propeniloxi, un grupo 1-metil-2-buteniloxi, un grupo 1-metil-3-buteniloxi, un grupo 2-hexeniloxi, un grupo 3-hexeniloxi, un grupo 4-hexeniloxi, un grupo 5-hexeniloxi, un grupo 1,1-dimetil-2-buteniloxi y un grupo 1,1-dimetil-3-buteniloxi.

Los ejemplos del término "grupo haloalqueniloxi C₃₋₆" incluyen los grupos alqueniloxi de cadena lineal o ramificada prescritos anteriormente que tienen de 3 a 6 átomos de carbono, que tienen al menos un doble enlace en una posición arbitraria y que además están sustituidos con de 1 a 13, preferiblemente de 1 a 7 átomos de halógeno, como un grupo 3-cloro-2-propeniloxi, un grupo 3,3-difluoro-2-aliloxi, un grupo 3,3-dicloro-2-aliloxi, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-buteniloxi, un grupo 4,4,4-trifluoro-3-buteniloxi, un grupo 5-cloro-3-penteniloxi y un grupo 6-fluoro-2-hexeniloxi.

Los ejemplos del término "grupo alquiniiloxi C₃₋₆" incluyen grupos alquiniiloxi de cadena lineal o ramificada que tienen de 3 a 6, preferiblemente de 3 a 5 átomos de carbono y que tienen al menos un triple enlace en una posición arbitraria, tal como un grupo 2-propiniloxi, un grupo 1-metil-2-propiniloxi, un grupo 1,1-dimetil-2-propiniloxi, un grupo 1-butiniloxi, un grupo 2-butiniloxi, un grupo 3-butiniloxi, un grupo 1-pentiniloxi, un grupo 2-pentiniloxi, un grupo 3-pentiniloxi, un grupo 4-pentiniloxi, un grupo 1-metil-2-butiniloxi, un grupo 1-metil-3-butiniloxi, un grupo 1,1-dimetil-2-butiniloxi, un grupo 1,1-dimetil-3-butiniloxi, un grupo 1-metil-3-pentiniloxi y un grupo 1-metil-4-pentiniloxi.

Los ejemplos del término "grupo haloalquiniiloxi C₃₋₆" incluyen los grupos alquiniiloxi de cadena lineal o ramificada prescritos anteriormente que tienen de 3 a 6 átomos de carbono, que tienen al menos un triple enlace en una posición arbitraria y que están sustituidos con de 1 a 9, preferiblemente de 1 a 6 átomos de halógeno, como un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butiniloxi, un grupo 5,5,5-trifluoro-3-pentiniloxi, un grupo 1-metil-3,3,3-trifluoro-2-butiniloxi y un grupo 1-metil-5,5,5-trifluoro-2-pentiniloxi.

Los ejemplos del término “grupo alquiltio C₁₋₆” incluyen grupos alquiltio de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, como 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 y un grupo n-hexiltio.

- 5 Los ejemplos del término “grupo alquilsulfinilo C₁₋₆” incluyen grupos alquilsulfinilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, como un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo n-propilsulfinilo, un grupo isopropilsulfinilo, un grupo n-butilsulfinilo, un grupo sec-butilsulfinilo, un grupo terc-butilsulfinilo, un grupo n-pentilsulfinilo y un grupo n-hexilsulfinilo.

- 10 Los ejemplos del término “grupo alquilsulfonilo C₁₋₆” incluye grupos alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, como 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 y un grupo n-hexilsulfonilo.

- 15 Ejemplos del término “grupo haloalquiltio C₁₋₆” incluyen grupos alquiltio de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono sustituidos con de 1 a 13, preferiblemente de 1 a 9 átomos de halógeno, como un grupo difluorometiltio, un grupo trifluorometiltio, un grupo monoclorometiltio, un grupo diclorometiltio, un grupo triclorometiltio, un grupo monobromometiltio, un grupo dibromometiltio, un grupo tribromometiltio, un grupo 1-fluoroetiltio, un grupo 2-fluoroetiltio, un grupo 2,2-difluoroetiltio, un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, un grupo 1-cloroetiltio, un grupo 2-cloroetiltio, un grupo 2,2,-dicloroetiltio, un grupo 2,2,2-tricloroetiltio, un grupo 2-bromoetiltio, un grupo 2,2-dibromoetiltio, un grupo 2,2,2-tribromoetiltio, un grupo pentafluoroetiltio, un grupo 3-fluoropropiltio, un grupo 3-cloropropiltio, un grupo 3-bromopropiltio, un grupo 1,3-difluoro-2-propiltio, un grupo 3,3,3-trifluoropropiltio, un grupo 1,3-dicloro-2-propiltio, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propiltio, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propiltio, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propiltio, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propiltio, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropiltio, un grupo heptafluoroisopropiltio, un grupo heptafluoro-n-propiltio, un grupo 4-fluorobutiltio, un grupo 4,4,4-trifluorobutiltio, un grupo 25 grupo nonafluoro-n-butiltio y un grupo nonafluoro-2-butiltio.

- Los ejemplos del término “grupo haloalquilsulfinilo C₁₋₆” incluyen grupos alquilsulfinilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono sustituidos con de 1 a 13, preferiblemente de 1 a 9 átomos de halógeno, como un grupo difluorometilsulfinilo, un grupo trifluorometilsulfinilo, un grupo diclorometilsulfinilo, un grupo triclorometilsulfinilo, un grupo monobromometilsulfinilo, un grupo dibromometilsulfinilo, un grupo tribromometilsulfinilo, un grupo 1-fluoroetilsulfinilo, un grupo 2-fluoroetilsulfinilo, un grupo 2,2-difluoroetilsulfinilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfinilo, un grupo 1-cloroetilsulfinilo, un grupo 2-cloroetilsulfinilo, un grupo 2,2,-dicloroetilsulfinilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilsulfinilo, un grupo 2-bromoetilsulfinilo, un grupo 2,2-dibromoetilsulfinilo, un grupo 2,2,2-tribromoetilsulfinilo, un grupo pentafluoroetilsulfinilo, un grupo 3-fluoropropilsulfinilo, un grupo 3-cloropropilsulfinilo, un grupo 3-bromopropilsulfinilo, un grupo 1,3-difluoro-2-propilsulfinilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilsulfinilo, un grupo 1,3-dicloro-2-propilsulfinilo, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propilsulfinilo, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propilsulfinilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilsulfinilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propilsulfinilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilsulfinilo, un grupo heptafluoroisopropilsulfinilo, un grupo heptafluoro-n-propilsulfinilo, un grupo 4-fluorobutilsulfinilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilsulfinilo, un grupo nonafluoro-n-butilsulfinilo y un grupo nonafluoro-2-butilsulfinilo.
- 30
- 35
- 40

- Los ejemplos del término “grupo haloalquilsulfonilo C₁₋₆” incluyen grupos alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6, preferiblemente de 1 a 3, átomos de carbono sustituidos con de 1 a 13, preferiblemente de 1 a 9, átomos de halógeno, como un grupo difluorometilsulfonilo, un grupo trifluorometilsulfonilo, un grupo diclorometilsulfonilo, un grupo triclorometilsulfonilo, un grupo monobromometilsulfonilo, un grupo dibromometilsulfonilo, un grupo tribromometilsulfonilo, un grupo 1-fluoroetilsulfonilo, un grupo 2-fluoroetilsulfonilo, un grupo 2,2-difluoroetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfonilo, un grupo 1-cloroetilsulfonilo, un grupo 2-cloroetilsulfonilo, un grupo 2,2,-dicloroetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilsulfonilo, un grupo 2-bromoetilsulfonilo, un grupo 2,2-dibromoetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-tribromoetilsulfonilo, un grupo pentafluoroetilsulfonilo, un grupo 3-fluoropropilsulfonilo, un grupo 3-cloropropilsulfonilo, un grupo 3-bromopropilsulfonilo, un grupo 1,3-difluoro-2-propilsulfonilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilsulfonilo, un grupo 1,3-dicloro-2-propilsulfonilo, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propilsulfonilo, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propilsulfonilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilsulfonilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propilsulfonilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilsulfonilo, un grupo heptafluoroisopropilsulfonilo, un grupo heptafluoro-n-propilsulfonilo, un grupo 4-fluorobutilsulfonilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilsulfonilo, un grupo nonafluoro-n-butilsulfonilo y un grupo nonafluoro-2-butilsulfonilo.
- 45
- 50
- 55

Los ejemplos de la sal del derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1) de la presente invención incluyen sales de ácidos inorgánicos, como clorhidrato, sulfato, nitrato y fosfato, y sales de ácidos orgánicos, como acetato, fumarato, maleato, oxalato, metanosulfonato, bencenosulfonato y p-toluenosulfonato.

El derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1) de la presente invención puede incluir uno o más centros asimétricos en su fórmula estructural, y pueden estar presentes dos o más isómeros ópticos y diastereómeros. La presente invención abarca estos isómeros ópticos y una mezcla que los contiene en cualquier proporción arbitraria. Además, en el derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1) de la presente invención, pueden estar presentes dos isómeros geométricos derivados de un doble enlace carbono-carbono, y la presente invención abarca estos isómeros geométricos y una mezcla que los contiene en proporciones arbitrarias.

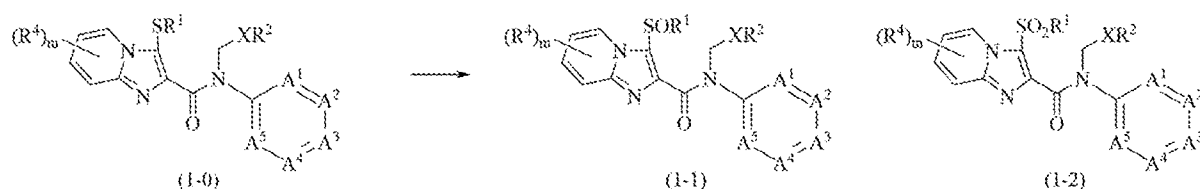
Entre los compuestos de la presente invención, se prefieren aquellos compuestos en los que R^2 es un grupo alquilo C_{1-3} o un grupo haloalquilo C_{1-3} , y se prefieren aún más aquellos compuestos en los que R^2 es un grupo metilo.

Entre los compuestos de la presente invención, se prefieren los compuestos en los que R^1 es un grupo alquilo C_{1-3} o un grupo haloalquilo C_{1-3} , y se prefieren aún más aquellos compuestos en los que R^1 es un grupo alquilo C_{1-3} .

Entre los compuestos de la presente invención, se prefieren aquellos compuestos en los que R^3 y R^4 son grupos haloalquilo C_{1-3} , y se prefieren aún más aquellos compuestos en los que R^3 y R^4 son grupos alquilo C_{1-3} .

A continuación se describirá un método típico para fabricar el nuevo derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1) de la presente invención, pero el alcance de la presente invención no se limita al mismo.

Fórmula de reacción 1



[En la fórmula, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , X y m son como se definieron anteriormente].

En el método mostrado en la fórmula de reacción 1, los derivados de imidazopiridin-2-carboxamida (1-1) y (1-2) representados por la fórmula (1) se fabrican mediante reacción de oxidación del derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1-0).

Como disolvente que va a usarse en la reacción de oxidación del compuesto de fórmula (1-0), puede usarse ampliamente un disolvente que es inerte para la reacción, y los ejemplos del mismo incluyen disolventes de hidrocarburos alifáticos o alicíclicos, como hexano, ciclohexano y heptano; disolventes de hidrocarburos aromáticos, como benceno, clorobenceno, tolueno y xileno; disolventes de hidrocarburos halogenados, como cloruro de metileno, 1,2-dicloroetano y cloroformo; disolventes alcohólicos, como metanol y etanol; disolventes de éster, como acetato de metilo y acetato de etilo; disolventes cetónicos, como acetona y metiletilcetona; disolventes de amida, como N,N -dimetilformamida; disolventes de nitrilo, como acetonitrilo y propionitrilo; disolventes polares no protónicos, como N -metilpirrolidona y N,N' -dimetilimidazolinona; y ácido acético. Estos disolventes pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más de los mismos según sea necesario.

El agente oxidante que va a usarse en la reacción de oxidación de fórmula (1-0) es, por ejemplo, ácido m -cloroperbenzoico, peryodato de sodio o peróxido de hidrógeno.

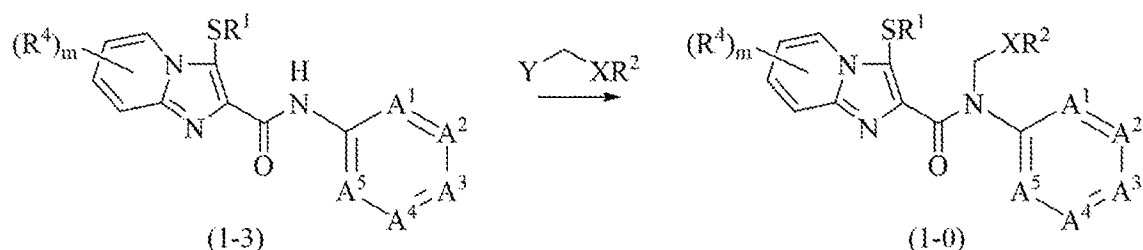
Un agente oxidante de este tipo puede usarse habitualmente en una cantidad de 1 a 3 equivalentes, preferiblemente de 1 a 2.5 equivalentes, con respecto al derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1-0).

La reacción puede realizarse normalmente dentro de un intervalo de temperatura de -78°C al punto de ebullición del disolvente usado, y la reacción se realiza preferiblemente a una temperatura de 0°C a temperatura ambiente.

El tiempo de reacción varía dependiendo de la temperatura de reacción, etc., y aunque no puede decirse de manera incondicional, la reacción habitualmente se completa en aproximadamente de 0.5 a 24 horas.

Los compuestos objetivo obtenidos mediante cada una de las reacciones anteriores pueden aislarse fácilmente de una mezcla de reacción mediante un método de aislamiento que se realiza generalmente, tal como extracción con disolventes orgánicos, cromatografía, un método de recristalización o un método de destilación y pueden purificarse adicionalmente mediante un método general de purificación.

Fórmula de reacción 2



[en la fórmula, R¹, R², R³, R⁴, A¹, A², A³, A⁴, A⁵, X y m son como se definieron anteriormente, e Y representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metanosulfonilo o un grupo trifluorometanosulfonilo].

En el método mostrado en la fórmula de reacción 2, se permite que un derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1-3) y un derivado de éter halogenado o un derivado de tioéter halogenado representado por YCH₂XR² reaccionen entre sí en un disolvente en presencia de una base según el método descrito en *Bioorganic Medicinal Chemistry Letters*, 18 (20), 5537-5540 (2008) para fabricar un compuesto de fórmula (1-0).

Como disolvente que va a usarse en la reacción mostrada en la fórmula de reacción 2, puede usarse ampliamente un disolvente conocido siempre que el disolvente sea inerte para la reacción, y los ejemplos del mismo pueden incluir disolventes de éter, como dietil éter, tetrahidrofurano y 1,4-dioxano; disolventes de amida, como N,N-dimetilformamida; y disolventes, como dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona y N,N'-dimetilimidazolinona. Estos disolventes pueden usarse solos o como una mezcla de dos o más de los mismos según sea necesario.

Como base que va a usarse en la reacción, puede usarse una base inorgánica o una base orgánica conocida, y los ejemplos de la misma pueden incluir hidruros de metales alcalinos, como hidruro de sodio e hidruro de potasio; carbonatos de metales alcalinos, como carbonato de sodio y carbonato de potasio; hidróxidos de metales alcalinos, como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de litio; alcóxidos de metales alcalinos, como t-butoxido de potasio; y bases orgánicas, como trietilamina, tributilamina, diisopropilamina, N-metilmorfolina, piridina, 4-(N,N-dimetilamino)piridina, N,N-dimetilanilina, N,N-di-etilanilina, 1,5-diazabicyclo [4.3.0]non-5-eno, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO) y 1,8-diazabicyclo [5.4.0]-7-undeceno (DBU). Se prefieren hidruros de metales alcalinos, carbonatos de metales alcalinos e hidróxidos de metales alcalinos, y se prefieren aún más hidruro de sodio y carbonato de potasio.

La cantidad de base usada puede ser habitualmente de 1 a 3 equivalentes, preferiblemente de 1 a 2.5 equivalentes, basándose en 1 mol del compuesto de fórmula (1-3).

La reacción se realiza preferiblemente a una temperatura de 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado, más preferiblemente a una temperatura de 0 °C a 80 °C.

La reacción normalmente se completa en un tiempo de reacción de aproximadamente 0.5 a 24 horas.

Una vez completada la reacción, es suficiente que el compuesto objeto se aísle del sistema de reacción que contiene el compuesto objeto mediante un método habitual y el compuesto objeto puede purificarse mediante, por ejemplo, recristalización o cromatografía en columna según sea necesario, para producir el objeto compuesto. Así, puede fabricarse el compuesto objeto. Alternativamente, el objeto puede someterse al proceso posterior sin aislar el compuesto objeto del sistema de reacción.

El derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula general (1-3) que va a usarse en la presente reacción puede sintetizarse, por ejemplo, según el método descrito en el documento JP-A-2018-24672.

En la tabla 1 se muestran ejemplos típicos del compuesto derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la fórmula (1), pero el alcance de la presente invención no se limita a los mismos.

A propósito, las propiedades físicas en la tabla muestran la naturaleza o el punto de fusión (°C), "n" representa normal, "i" representa iso, "Me" representa un grupo metilo, "Et" representa un grupo etilo y "Pr" representa un grupo propilo.

Fórmula general (1)

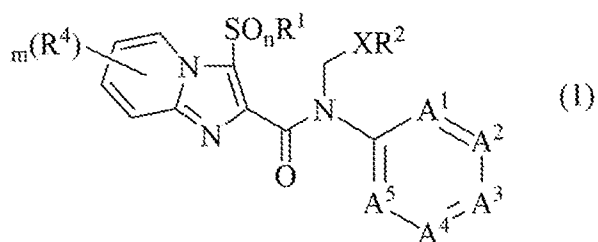


Tabla 1

Compuesto n.º	R ¹	R ²	(R ⁴) _m	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	A ⁵	X	n	Punto de fusión
A-1	Me	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-2	Me	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	136-141
A-3	Me	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	121-122
A-4	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-5	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	135-136
A-6	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	124-126
A-7	nPr	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-8	nPr	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	116-117
A-9	nPr	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	120-122
A-10	iPr	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-11	iPr	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	106-111
A-12	iPr	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	aceite
A-13	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	103-105
A-14	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	147-149
A-15	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	165-166
A-16	Et	Et	5-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-17	Et	Et	5-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	
A-18	Et	Et	5-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	154-157
A-19	Et	Et	7-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	66-74
A-20	Et	Et	7-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	92-94
A-21	Et	Et	7-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	aceite

ES 2 988 405 T3

A-22	Et	Et	8-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-23	Et	Et	8-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	
A-24	Et	Et	8-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	aceite
A-25	Et	Et	6-Cl	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-26	Et	Et	6-Cl	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	
A-27	Et	Et	6-Cl	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	96-100
A-28	Et	Et	6-Me	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-29	Et	Et	6-Me	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	1	aceite
A-30	Et	Et	6-Me	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	O	2	81-87
A-31	Et	Et	6-CF ₃	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	O	0	aceite
A-32	Et	Et	6-CF ₃	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	O	1	
A-33	Et	Et	6-CF ₃	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	O	2	aceite
A-34	Et	Et	6-CF ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	O	0	aceite
A-35	Et	Et	6-CF ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	O	1	
A-36	Et	Et	6-CF ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	O	2	137-140
A-37	Et	Et	6-CF ₃	CMe	CH	CH	CH	CH	O	0	
A-38	Et	Et	6-CF ₃	CMe	CH	CH	CH	CH	O	1	
A-39	Et	Et	6-CF ₃	CMe	CH	CH	CH	CH	O	2	
A-40	Et	Et	6-CF ₃	CH	CMe	CH	CH	CH	O	0	
A-41	Et	Et	6-CF ₃	CH	CMe	CH	CH	CH	O	1	
A-42	Et	Et	6-CF ₃	CH	CMe	CH	CH	CH	O	2	
A-43	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CMe	CH	CH	O	0	aceite
A-44	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CMe	CH	CH	O	1	
A-45	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CMe	CH	CH	O	2	111-114
A-46	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CF	CH	CH	O	0	aceite
A-47	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CF	CH	CH	O	1	109-112
A-48	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CF	CH	CH	O	2	115-116
A-49	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	O	0	aceite
A-50	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	O	1	114-117

ES 2 988 405 T3

A-51	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	O	2	162-165
A-52	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	O	0	aceite
A-53	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	O	1	110-112
A-54	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	O	2	121-126
A-55	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	Cl	CH	CH	O	0	aceite
A-56	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	Cl	CH	CH	O	1	132-133
A-57	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	Cl	CH	CH	O	2	133-134
A-58	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CNO ₂	CH	CH	O	0	96-98
A-59	Et	Et	6-CF ₃	CH i	H	CNO ₂	CH	CH	O	1	152-154
A-60	Et	Et	6-CF ₃	CH i	H	CNO ₂	CH	CH	O	2	142-146
A-61	Et	Et	6-CF ₃	CH	H	CCN	CH	CH	O	0	aceite
A-62	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCN	CH	CH	O	1	153-158
A-63	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCN	CH	CH	O	2	aceite
A-64	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CC ₂ F ₅	CH	CH	O	0	
A-65	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CC ₂ F ₅	CH	CH	O	1	
A-66	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CC ₂ F ₅	CH	CH	O	2	
A-67	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-68	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	O	1	aceite
A-69	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	O	2	aceite
A-70	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSCF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-71	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSCF ₃	CH	CH	O	1	aceite
A-72	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSCF ₃	CH	CH	O	2	aceite
A-73	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSOCF ₃	CH	CH	O	0	
A-74	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSOCF ₃	CH	CH	O	1	
A-75	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSOCF ₃	CH	CH	O	2	aceite
A-79	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	O	0	aceite
A-80	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	O	1	aceite
A-81	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSO ₂ CF ₃	CH	CH	O	2	aceite
A-82	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSC ₂ F ₅	CH	CH	O	0	aceite

A-83	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSC ₂ F ₅	CH	CH	O	1	aceite
A-84	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSC ₂ F ₅	CH	CH	O	2	aceite
A-85	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSF ₅	CH	CH	O	0	aceite
A-86	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSF ₅	CH	CH	O	1	83-86
A-87	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CSF ₅	CH	CH	O	2	116-118
A-88	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF(CF ₃) ₂	CH	CH	O	0	aceite
A-89	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF(CF ₃) ₂	CH	CH	O	1	aceite
A-90	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF(CF ₃) ₂	CH	CH	O	2	aceite
A-91	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	N	CH	O	0	76-77
A-92	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	N	CH	O	1	135-136
A-93	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	N	CH	O	2	143-145
A-94	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	N	O	0	
A-95	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	N	O	1	
A-96	Et	Et	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	N	O	2	93-97
A-97	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	S	0	
A-98	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	S	1	
A-99	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	S	2	159-161
A-100	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	SO ₂	0	
A-101	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	SO ₂	1	
A-102	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	SO ₂	2	247-251
A-103	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	O	0	75-76
A-104	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	O	1	114-116
A-105	Et	Me	6-CF ₃	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	O	2	132-133

El compuesto de la presente invención puede usarse para la prevención y el exterminio de organismos que son nocivos en la agricultura o en interiores o en el bosque, para el ganado, o en diversas situaciones como la higiene. A continuación se mostrarán situaciones de uso específicas, organismos nocivos objetivo y métodos de uso, pero el contenido de la presente invención no se limita a los mismos.

5

El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede usarse para controlar organismos nocivos, como artrópodos, moluscos, nematodos y hongos y bacterias que incluyen Eumycota, Myxomycota, Bacteriomycota y Actinomycota, que dañan los cultivos, por ejemplo, cultivos alimentarios (p. ej., arroz, variedades de trigo como cebada, trigo, centeno y avena, maíz, patata, boniato, taro y judías como soja, judías adzuki, habas, guisantes, judías comunes y cacahuètes), hortalizas (por ejemplo, cultivos de Brassicaceae como col, col china, rábano, nabo, brócoli, coliflor y espinaca mostaza japonesa, frutas cucurbitáceas como calabaza, pepino, sandía, melón oriental y melón, berenjena, tomate, pimiento morrón, pimiento, okra, espinacas, lechuga, raíz de loto, zanahoria, bardana y plantas aliáceas como ajo, cebolla y cebolla verde), setas (p. ej., seta

10

- shiitake y champiñones), árboles frutales y frutas (p. ej., manzana, cítricos, pera, uva, melocotón, ciruela, cereza, nuez, castaña, almendra, plátano y fresa), cultivos de condimentos y ornamentales (p. ej., lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta y jengibre), cultivos industriales (p. ej., tabaco, té, remolacha azucarera, caña de azúcar, lúpulo, algodón, cáñamo, olivo, caucho y café), pastos y cultivos forrajeros (por ejemplo, hierba timotea, trébol, alfalfa, maíz, sorgos, pastos de huerta, gramíneas y leguminosas), césped (p. ej., pasto manila y pasto doblado), árboles forestales (p. ej., abeto Sakhalin, abeto Todo, pinos, cipreses, cedros y cipreses japoneses) y plantas ornamentales (p. ej., hierbas y flores como crisantemo, rosa, claveles, orquídeas y árboles de jardín como ginkgo, flores de cerezo y laurel japonés). Los ejemplos específicos de organismos nocivos incluyen los siguientes.
- 5 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Lepidoptera de Arthropoda Insecta, por ejemplo, Noctuidae, como *Helicoverpa armigera*, *Heliothis* spp., *Agrotis segetum*, *Autographa nigrisigna*, *Trichoplusia* no, *Mamestra brassicae*, *Spodoptera minigua* y *Spodoptera litura*; Yponomeutidae, como *Plutella xilostela*; Tortricidae, como *Adoxophyes orana facciata*, *Adoxophyes honmai*, *Archips fuscocupreanus*, *Homona magnanima*, *Caloptilia theivora* y *Grapholita molesta*; Psychidae, como *Eumeta minuscula*; Lyonetidae, como *Lyonetia prunifolia malinella* y *Lyonetia clerkella*; Phyllocnistinae, como *Phyllocnistis citrella*; Gracillariidae, como *Phyllonorycter ringoniella*;
- 10 *Acrolepiidae*, como *Acrolepiopsis sapporensis*; Sesiidae, como *Synanthedon hector*; Stathmopodidae, como *Stathmopoda masinissa*; Gelechiidae, como *Pectinophora gossypiella*; Carposinidae, como *Carposina niponensis*; Cossidae, como *Cossus jezoensis*; Tineidae, como *Nemapogon granella*; Limacodidae, como *Monema flavecens*, *Parasa lepida* y *Scopelodes contracus*; Crambidae, como *Chilo suppressalis*, *Scirpophaga incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Hellula undalis*, *Conogethes punctiferlis*, *Diaphania indica* y *Parapediasis tetterella*; Pyralidae, como
- 15 *Locastra muscosalis*; Hesperidae, como *Parnara guttata*; Papilionidae, como *Papilio xuthus*; Pieridae, como *Pieris rapae crucivora*; Lycaenidae, como *Lampididae boeticus* Geometridae, como *Ascotis selenaria*; Sphingidae, como *Agrius convolvuli*; Notodontidae, como *Phalera flavescentis*; Lasiocampidae, como *Malacosoma neurtium testaceum*; Saturniidae, como *Saturnia japonica*; Lymantriidae, como *Euproctis pseudospersa*, *Orgyia thyellina* y *Telochorus recens approximans*; Arctiidae, como *Spilosoma imparilis* y *Hyphantria cunea*; y *Endopiza viteana* y
- 20 *Laspeyresia pomonella*,
- 25 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Coleoptera, por ejemplo, Scarabaeidae, como *Anomala cuprea*, *Popillia japonica*, *Oxycetonia jucunda* y *Anomala geniculata*; Buprestidae, como *Agrilus auriventris*; Elaterinae, como *Melanotus fortunum*; Coccinellidae, como *Epilachna vigintioctopunctata*; Cerambycidae, como *Anoplophora malasiaca* y *Xylotrechus pyrrhoderus*; Chrysomelidae, como *Aulacophora femoralis*, *Diabrotica* spp., *Phyllotreta striolata*, *Cassida nebulosa*, *Phaedon brassicae*, *Oulema orizae*, *Epilachna varivestis* y *Leptinotarsa decemlineata*; Attelabidae, como *Rhynchites heros*; Brentidae, como *Cylas formicarius*; Curculionidae, como *Curculio sikkimensis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Anthonomus grandis grandis* y *Sphenophorus venatus vestitus*; y Nitidulidae, como *Epuraea domina*,
- 30 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Heteroptera o Hemiptera, por ejemplo Pentatomidae, como *Eurydema rugosum*, *Eysarcoris lewisi*, *Eysarcoris parvus*, *Nezara viridula*, *Plautia stali* y *Halymorpha mista*; Urostylidae, como *Urochela luteovoria*; Lygaeidae, como *Togo hemipterus*; Coreidae, como *Riptortus clavatus* y *Cletus punctiger*; Alydidae, como *Leptocoris chinensis*; Pyrrhocoridae, como *Dysdercus cingulatus*; Tingidae, como *Stephanitis nashi* y *Stephanitis piroides*; Miridae, como *Apolygus spinolai*, *Stenotus rubrovittatus* y *Trigonotylus coelestialium*; y Plataspididae, como *Megacopta punctatissimum*,
- 35 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Homoptera de Hemiptera, por ejemplo, Cicadidae, como *Platypleura kaempferi*; Cicadellidae, como *Arboridia apicalis*, *Empoasca onukii*, *Nephotettix cincticeps* y *Nephotettix verescens*; Delphacidae, como *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens* y *Sogatella furcifera*; Flatidae, como *Geisha distinctissima*; Psyllidae, *Psylla pyrisuga* y *Diaphorina citri*; Aleyrodidae, como *Aleurocanthus spiniferus*, *Bemisia argentifolii*, varios biotipos de *Bemisia tabaci*, *Dialeurodes citri* y *Trialeurodes vaporariorum*; Phylloxeridae, como *Viteus vitifolii*; Aphididae, como *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis gossypii*, *Aulacorthum solani*, *Brevicoryne brassicae*, *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Aulacorthum magnoliae*, *Schizaphis piricola*, *Nippolachnus piri*, *Lipaphis erysimi*, *Hyalopterus pruni*, *Plectrochophorus chrysanthemi*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Megoura crassicauda*, *Sitobion ibarae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Myzus varians*, *Myzus persicae*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae* y *Eriosoma lanigerum*; Monophlebidae, como *Icerya purchasi*; Pseudococcidae, como *Pseudococcus comstocki*, *Phenacoccus viburnae* y *Phenacoccus kraunhiae*;
- 40 *Coccidae*, como *Ceroplastes ceriferus* y *Ceroplastes Rubens*; y Diaspididae, como *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Pseudaulacaspis oentagoea* y *Unaspis yanonensis*,
- 45 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Thysanoptera, por ejemplo Thripidae, como *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*, *Thrips setosus*, *Frankliniella intonsa*, *Frankliniella occidentalis* y *Heliethrips haemorrhoidalis*; y Phlaeothripidae, como *Ponticulothrips diospyrosi* y *Haplothrips aculeatus*,
- 50 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Hymenoptera, por ejemplo Tenthredinidae, como *Athalia rosae ruficornis* y *Arge pagana*; Argidae, como *Arge mali*; Cynipidae, como *Dryocampus kuriphilus*; Megachilidae, como *Megachile nipponica nipponica*; y Formicidae, como *Formica japonica*, *Camponotus kiusiuensis*, *Lasius fuliginosus* y *Solenopsis richteri* (*S. invicta*, *S. geminata*),
- 55

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Diptera, por ejemplo, Cecidomyiidae, como *Asphondylia yushimai*; Tephritidae, como *Rhacochlaena japonica* y *Bactrocera cucurbitaceae*; Ephydriidae, como *Hydrellia griseola*; Drosophilidae, como *Drosophila suzukii*; Agromyzidae, como *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Chromatomyia horticola*, *Agromyza oryzae* y *Liriomyza brioniae*; y Anthomyiidae, como *Delia platura* y *Delia antiqua*,

- 5 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Orthoptera, por ejemplo, Acrididae, como *Locusta migratoria*; Tettigoniidae, como *Ruspolia lineosa*; Gryllidae, como *Teleogryllus emma* y *Truljalia hibinonis*; Gryllotalpidae, tal como *Gryllotalpa orientalis*; y Acrididae, como *Oxya yezoensis*,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Isoptera, por ejemplo, Termitidae, como *Odontotermes formosanus*,

- 10 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Dermaptera, por ejemplo, Labiduridae, como *Labidura riparia*,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Collembola de Arthropoda Parainsecta, por ejemplo, Sminthuridae, como *Sminthurus viridis*; Onychiuridae, como *Onychiurus matsumotoi*; adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Isopoda de Arthropoda Malacostraca, por ejemplo, Armadillidae, como *Armadillidium vulgare*,

- 15 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Acari de Arthropoda Arachnida, por ejemplo, Tarsonemidae, como *Polyphagotarsonemus latus* y *Phytonemus pallidus*; Eupodidae, como *Penthaleus major*; Tenuipalpidae, como *Brevipalpus lewisi* y *Brevipalpus phoenicis*; Tetranychidae, como *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai*, *Amphitetranychus viennensis*, *Oligonychus ununguis*, *Bryobia eharae*, *Eotetranychus kankitus* y *Bryobia praetiosa*; Eriophyidae, como *Aculus schlechtendali*, *Aculops pelekassi*,
20 *Phyllocoptruta citri*, *Eriophyes chibaensis*, *Aceria tulipae*, *Colomerus vitis*, *Aculus fockeui* y *Calacarus carinatus*; y Acaridae, como *Tyrophagus putrescentiae* y *Rhizoglyphus robini* y

plagas pertenecientes a Architaenioglossa de Mollusca Gastropoda, por ejemplo, Pilidae, como *Pomacea canaliculate*, plagas pertenecientes a Plumonata, por ejemplo, Achatinidae, como *Achatina fulica*; Philomycidae, como *Meghimatium bilineatum*; Milacidae, como *Milax gagates*; Limacidae, como *Lehmannina valentina*; y
25 *Bradybaenidae*, como *Acusta despecta sieboldiana*,

plagas pertenecientes a Tylenchida de Nematoda Secernentea, por ejemplo, Anguinidae, como *Ditylenchus destructor*; Belonolaimidae, como *Tylenchorhynchus claytoni*; Pratylenchidae, como *Pratylenchus penetrans* y *Pratylenchus coffeae*; Hoplolaimidae, como *Helicotylenchus dihystra*; Heteroderidae, como *Globodera rostochiensis*; Meloidogynidae, como *Meloidogyne incognita*; Criconematidae, como *Criconema jaejuense*;
30 Anguinidae, como *Nothotylenchus acris*; Aphelenchoididae, como *Aphelenchoides fragariae*, plagas pertenecientes a Dorylaimida de Adenophorea, por ejemplo, Longidoridae, como *Xiphinema sp.*; y Trichodoridae, como *Trichodorus sp.*, y

plagas pertenecientes a hongos o bacterias, como Eumycota, Myxomycota, Bacteriomycota y Actinomycota.

- Los ejemplos de las enfermedades a las que puede aplicarse el compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) incluyen enfermedades del arroz, como enfermedad del añublo (*Pyricularia oryzae*), mancha parda (*Cochliobolus miyabeanus*), tizón de la vaina (*Rhizoctonia solani*), pardeamiento bacteriano de la palea (*Pantoea ananatis*), enfermedad de la raya marrón (*Acidovorax avenae* subsp. *avenae*), podredumbre parda de la vaina (*Pseudomonas fuscovaginae*), tizón bacteriano de las hojas (*Xanthomonas oryzae* pv. *oryzae*) y tizón bacteriano de las plántulas (*Burkholderia plantarii*); enfermedades del trigo, como mildiú polvoriento (*Erysiphe graminis*), mildiú rojo (*Gibberella zeae*), roya de la hoja (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita* y *P. hordei*), moho de la nieve (*Typhula sp.* y *Micronectriella nivalis*), carbón suelto (*Ustilago tritici* y *U. nuda*), carbón hediondo (*Tilletia caries*), mancha ocular (*Pseudocercospora herpotrichoides*), mancha foliar (*Rhynchosporium secalis*), tizón de la hoja (*Septoria tritici*), mancha de la gluma (*Leptosphaeria nodorum*), mancha de la red (*Pyrenophora teres*), mancha foliar zonada (*Helminthosporium zonatum* Ikata) y roya bacteriana (*Pseudomonas syringae* pv. *japonica*); enfermedades de los cítricos, como mancha negra (*Diaporthe citri*), antracnosis puntual (*Elsinoe fawcetti*), podredumbre del fruto (*Penicillium digitatum* y *P. italicum*), podredumbre parda (*Phytophthora citrophthora* y *P. nicotianae*) y sarna (*Phyllosticta citricarpa*); enfermedades del manzano, como tizón foliar de Molinia (*Monilinia mali*), cancro de valsa (*Valsa mali*), mildiú polvoriento (*Podosphaera leucotricha*), mancha foliar por alternaria (*Alternaria mali*), sarna (*Venturia inaequalis*), mancha negra (*Mycosphaerella pomi*), podredumbre amarga (*Colletotrichum acutatum*), podredumbre anular (*Botryosphaeria berengeriana*), roya (*Gymnosporangium yamadae*) y podredumbre parda (*Monilinia fructicola*);
45
50

enfermedades del peral, como sarna (*Venturia nashicola* y *V. pirina*), mancha morada (*Alternaria kikuchiana*), roya (*Gymnosporangium haraeaeum*) y podredumbre parda (*Monilinia fructigena*); enfermedades del melocotón, como podredumbre parda (*Monilinia fructicola*), sarna (*Cladosporium carpophilum*), podredumbre por *Phomopsis* (*Phomopsis sp.*) y mancha bacteriana (*Brenneria nigrifluens*); enfermedades de la uva, como antracnosis (*Elsinoe ampelina*), podredumbre madura (*Colletotrichum acutatum*), mildiú polvoriento (*Uncinula necator*), roya (*Phakopsora ampelopsidis*), podredumbre negra (*Guignardia bidwellii*), mildiú velloso (*Plasmopara viticola*), podredumbre parda (*Monilinia fructigena*), sarna (*Cladosporium viticolum*), moho gris (*Botrytis cinerea*) y agalla de

- 55

la corona (*Agrobacterium vitis*); enfermedades del caqui, como podredumbre amarga (*Gloeosporium kaki*) y mancha angular de las hojas (*Cercospora kaki* y *Mycoshaerella nawae*); enfermedades de la calabaza, como podredumbre amarga (*Colletotrichum lagenarium*), mildiú polvoriento (*Sphaerotheca fuliginea* y *Oidiopsis taurica*), tizón gomoso del tallo (*Didymella bryoniae*), marchitez por *Fusarium* (*Fusarium oxysporum*), mildiú vellosa (*Pseudoperonospora cubensis*), podredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora* sp.) y marchitez (*Pythium* sp.); enfermedades del pepino, como mancha bacteriana (*Pseudomonas syringae* pv. *lochrymans*), tizón marginal (*Pseudomonas viridiflava*) y mancha parda bacteriana (*Xanthomonas campestris* pv. *cucurbitae*); enfermedades del melón, como mancha marrón bacteriana (*Xanthomonas campestris* pv. *cucurbitae*), podredumbre vellosa (*Agrobacterium rhizogenes*) y tumor de la raíz (*Streptomyces* sp.); enfermedades de la sandía, como mancha bacteriana del fruto (*Acidovorax avenae* pv. *citrulli*); enfermedades de vegetales Solanaceae, como marchitez bacteriana (*Ralstonia solanacearum*); enfermedades del tomate, como podredumbre anular (*Alternaria solani*), moho de las hojas (*Cladosporium fulvum*), podredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora infestans*), cancro bacteriano (*Clavibacter michiganense* subsp. *michiganense*), necrosis del tallo (*Pseudomonas corrugata*) y podredumbre blanda bacteriana (*Pectobacterium carotovorum* subsp. *carotovorum*); enfermedades de la berenjena, como mancha marrón (*Phomopsis vexans*) y mildiú polvoriento (*Erysiphe cichoracearum*); enfermedades de vegetales Brassicaceae, como mancha morada (*Alternaria japonica*), mancha blanca (*Cercospora brassicae*) y podredumbre blanda (*Pectobacterium carotovorum* subsp. *carotovorum*);

enfermedades del repollo, como podredumbre blanda (*Pseudomonas syringae* pv. *marginalis*) y podredumbre negra (*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*); enfermedades de la lechuga, como podredumbre blanda (*Pseudomonas cichorii* y *Pseudomonas viridiflava*) y mancha bacteriana (*Xanthomonas campestris* pv. *vitans*); enfermedades de la cebolla verde, como roya (*Puccinia allii*); enfermedades de la soja, como cepa de semilla morada (*Cercospora kikuchii*), sarna por *Sphaeloma* (*Elsinoe glycines*) y mancha negra (*Diaporthe faseolorum* var. *sojae*); enfermedades de las judías, como podredumbre amarga (*Colletotrichum lindemthianum*); enfermedades del cacahuete, como mancha foliar (*Cercospora personata*) y mancha foliar marrón (*Cercospora arachidicola*); enfermedades de los guisantes, como mildiú polvoriento (*Erysiphe pisi*); enfermedades de la patata, como tizón temprano (*Alternaria solani*), podredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora infestans*) y podredumbre por *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*); enfermedades de la fresa, como mildiú polvoriento (*Sphaerotheca humuli*); enfermedades del té, como tizón de las ampollas (*Exobasidium reticulatum*), mancha foliar (*Elsinoe leucospila*), tizón bacteriano de los brotes (*Pseudomonas syringae* pv. *theae*) y cancro bacteriano (*Xanthomonas campestris* pv. *theicola*); enfermedades del tabaco, como roya (*Alternaria longipes*), mildiú polvoriento (*Erysiphe cichoracearum*), podredumbre amarga (*Colletotrichum tabacum*), mildiú vellosa (*Peronospora tabacina*), podredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora nicotianae*), marchitez bacteriana (*Ralstonia solanacearum*) y tallo hueco (*Pectobacterium carotovorum* subsp. *carotovorum*); enfermedades de la remolacha azucarera, como mancha parda de las hojas (*Cercospora beticola*) y marchitez (*Aphanomyces cochlidioides*); enfermedades de la rosa, como sarna (*Diplocarpon rosae*) y mildiú polvoriento (*Sphaerotheca pannosa*); enfermedades del crisantemo, como mancha foliar marrón (*Septoria chrysanthemi-indici*), roya (*Puccinia horiana*) y agalla de la corona (*Agrobacterium tumefaciens*); enfermedades de diversos cultivos, por ejemplo, berenjenas, pepinos y lechugas, como moho gris (*Botrytis cinerea*) y podredumbre por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*); enfermedades del césped, como moho de la nieve (*Pythium iwayamai*, *Typhula incarnate*, *Fusarium nivale* y *Sclerotinia borealis*), mildiú polvoriento (*Erysiphe graminis*), enfermedad de anillos de hadas (*Lycoperdon perlatum*, *Lepista subnudo* y *Marasmius oreades*), podredumbre por *Rhizoctonia* (*Ceratobasidium* spp.), marchitez bacteriana (*Gaeumannomyces graminis*), tizón foliar por *Curvularia* (*Curvularia geniculata*), podredumbre por *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*), podredumbre de la raíz por *Pythium* (*Pythium periplocum* y *Pythium vanterpoolii*), roya (*Puccinia* spp.) y enfermedad de la mancha dólar (*Sclerotinia homoeocarpa*); y enfermedades del pasto doblado, como tizón bacteriano de los brotes (*Pythium aphanidermatum*) y podredumbre amarga (*Colletotrichum* sp.).

El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede usarse para controlar artrópodos y hongos que están activos en el interior de edificios, incluidas casas comunes, que dañan o pudren la madera y sus muebles de madera procesados, alimentos almacenados, ropa, libros., etc., y que dañan nuestra vida. Ejemplos específicos de organismos nocivos incluyen los siguientes.

Adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Isoptera de Arthropoda Insecta, por ejemplo, Phinotermitidae, como *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes speratus*, otras termitas de *Reticulitermes* spp. (p. ej., *Reticulitermes hesperus*, *R. tibialis*, *R. flavipes*, *R. lucifugus* y *R. santonensis*) e *Incisitermes minor*; Termitidae, como *Odontotermes formosanus*; Termopsidae, como *Hodotermopsis japonica*; y Kalotermitidae, como *Cryptotermes domesticus*,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Coleoptera, por ejemplo, Rhynchophoridae, como *Sitophilus zeamais* y *Sitophilus zeamais*; Bruchidae, como *Callosobruchus chinensis*, *Bruchus pisorum* y *Bruchus rufimanus*; Tenebrionidae, como *Tribolium castaneum* y *Tribolium confusum*; Silvanidae, como *Oryzaephilus surinamensis* y *Cryptolestes pusillus*; Anobiidae, como *Lasioderma serricorne* y *Stegobium paniceum*; Dermesidae, como *Attagenus unicolor japonicus*, *Anthrenus verbasci* y *Dermestes maculatus*; Ptinidae, como *Gibbium aequinoctiale*; Bostrychidae, como *Dinoderus minutus* y *Rhizopertha dominica*; y Lyctidae, como *Lyctus brunneus*,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Lepidoptera, por ejemplo, Pyralidae, como *Cadra cautella*, *Efestia kuehniella* y *Plodia interpunctella*; Gelechiidae, como *Sitotroga cerealella*; Tineidae, como *Tinea translucens* y *Tineola bisselliella*, adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Psocoptera, por ejemplo, Trogiidae, como *Lepinotus reticulatus*; y Liposcelidae, como *Liposcelis bostrychophilus*,

- 5 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Blattodea, por ejemplo, Blattellidae, como *Blattella germanica*; y Blattidae, como *Periplaneta fuliginosa* y *Periplaneta japonica*, adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Hymenoptera, por ejemplo, Formicidae, como *Monomorium pharaonic* y *Monomorium nipponense*,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Zygentoma, por ejemplo, Lepismatidae, como *Ctenolepisma villosa* y *Lepisma saccharina*,

- 10 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Diptera, por ejemplo, Drosophilidae, como *Drosophila melangogaster*; y Piophilidae, como *Piophilus casei*,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Acari de Arthropoda Arachnida, por ejemplo, Acaridae, como *Tyrophagus putrescentiae* y *Lardoglyphus konoi*; y Carpoglyphidae, como *Carpoglyphus lactis*, y hongos que pudren la madera, como *Tyromyces palustris* y *Coriolus versicolor*; y

- 15 microorganismos de deterioro de materiales, como *Aspergillus niger*, *Aspergillus terreus*, *Aureobasidium pullulans*, *Chaetomium globosum*, *Cladosporium cladosporioides*, *Eurotium tonophilus*, *Fusarium moniliforme*, *Gliocladium virens*, *Myrothecium verrucaria*, *Penicillium citrinum*, *Penicillium funiculosum* y *Rhizopus oryzae*.

- El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede usarse para controlar organismos nocivos que son perjudiciales para los árboles en bosques naturales, bosques plantados y espacios verdes urbanos o que debilitan los árboles. Los ejemplos específicos de organismos nocivos incluyen los siguientes.

- Adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Lepidoptera de Arthropoda Insecta, por ejemplo, Lymantriidae, como *Calliteara argentata*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Orygia recens approximans*, *Euproctis subflava* y *Lymantria dispar*; Lasiocampidae, como *Malacosoma neustria testacea*, *Dendrolimus spectabilis* y *Dendrolimus superans*; Pyralidae, como *Crytolabes loxiella*; Noctuidae, como *Agrotis segetum*; Tortricidae, como *Ptycholoma lecheana circumclusana*, *Cydia kurokoi* y *Cydia cryptomeriae*; Arctiidae, como *Spilosoma imparilis* e *Hyphantria cunea*; Nepticulidae, como *Stigmella castanopsiella*; Limacodidae, como *Parasa lepida*, *Scopelodes contracus* y *Microleon longipalpis*, adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Coleoptera, por ejemplo, Scarabaeidae, como *Anomala rufocuprea* y *Heptophylla picea*; Buprestidae, como *Agrilus spinipennis*; Cerambycidae, como *Monochamus alternatus* Chrysomelidae, como *Basilepta pallidula*; Curculionidae, como *Scepticus griseus* y *Shirahoshizo insidiosus*; Rhynchophoridae, como *Sipalinus gigas*; Scolytidae, como *Tomicus piniperda* e *Indocryphalus aceris* y Bostrychidae, como *Rhizopertha dominica*,

- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Hemiptera, por ejemplo, Aphididae, como *Cinara todocola*; Adelgidae, como *Adelges japonicus*; Diaspididae, como *Aspidiotus cryptomeriae*; y Coccidae, como *Ceroplastes ceriferus*, adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Hymenoptera, por ejemplo, Tenthredinidae, como *Pachynematus itoi*; Diprionidae, como *Neodiprion sertifer*; y Cynipidae, como *Dryocosmus kuriohilus*, adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Diptera, por ejemplo, Tipulidae, como *Tipula aino*; Anthomyiidae, como *Strobilomyia laricicola*; y Cecidomyiidae, como *Contarinia inouyei* y *Contarinia matsusintome*,

- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Acari de Arthropoda Arachnida, por ejemplo, *Oligonychus hondoensis* y *oligonichus ununguis*, y

- 40 plagas pertenecientes a Tylenchida de Nematoda Secernentea, por ejemplo, Parasitaphelenchidae, como *Bursaphelenchus xylophilus*.

- El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede usarse para prevenir, tratar o controlar artrópodos, nematodos, trematodos, cestodos y protozoos que parasitan interna o externamente ganado y mascotas, es decir, vertebrados, especialmente vertebrados de sangre caliente, como vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, aves, perros, gatos y peces. Los ejemplos de las especies animales objetivo incluyen, además de lo anterior, mascotas y animales de experimentación, por ejemplo, roedores, como ratones, ratas, hámsteres y ardillas; animales carnívoros, como hurones; y aves, como patos y palomas. Los ejemplos específicos de organismos nocivos incluyen los siguientes.

- Adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Diptera de Arthropoda Insecta, por ejemplo, Tabanidae, como *Tabanus rufidens* y *Tabanus chrysurus*; Muscidae, como *Musca bezzii*, *Musca domestica* y *Stomoxys calcitrans*; Gasterophilidae, como *Gasterophilus intestinalis*; Hypodermatidae, como *Hypoderma bovis*; Oestridae, como *Oestrus ovis*; Calliphoridae, como *Aldrichina graham*; Phoridae, como *Megaselia spiracularis*; Sepsidae, como *Sepsis punctum*; Psychodidae, como *Telmatoscopus albipunctatus* y *Psychoda alternata*; Culicidae, como *Culex pipiens molestus*, *Culex pipiens pallens*, *Anopheles sinensis*, *Culex pipiens triaeniorhynchus summorosus* y *Ades albopictus*; Simuliidae, como *Simulium iwataense* y *Prosimulium yezoense*; y Ceratopogonidae, como *Culicoides Schulzei* y *Culicoides arakawae*,

- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Siphonaptera, por ejemplo, Pulicidae, como *Pulex irritans* y *Ctenocephalides canis*,
- 5 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Anoplura, por ejemplo, Echinophthiriidae, como *Haematopinus suis* y *Haematopinus eurysternus*; Trichodectidae, como *Damalinia bovis*; Linognathidae, como *Linognathus vituli*; y Menoponidae, como *Menopon gallinae*,
- 10 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Acari de Arthropoda Arachnida, por ejemplo, Varroidae, como *Varroa jacobsoni*; ixodidae, como *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes ovatus*, *Boophilus microplus* y *Amblyomma testudinarium*; Macronyssidae, como *Ornithonyssus sylvialum*; Dermanyssidae, como *Dermanyssus gallinae*; Demodicidae, como *Demodex phylloides*; Sarcoptidae, como *Sarcoptes scabiei* bovis y *Knemidocoptes mutans*; y Psoroptidae, como *Otodectes cynotis* y *Psoroptes communis*, y
- plagas pertenecientes a Strongylida de Nematoda Secernentea, por ejemplo, *Bunostomum phlebotomum*, *Stephanurus dentatus*, *Metastrongylus elongatus*, *Trichostrongylus orientalis* y *Oesophagostomum radiatum*;
- 15 Ascaridida, por ejemplo, *Ascaris suum* y *Ascaridia galli*; Platyhelminthes Trematoda, por ejemplo, *Schistosoma japonicum*, *Fasciola hepatica* Linnaeus, *Paramphistomum cervi*, *Paragonimus westermanii* y *Prosthogonimus ovatus*; y Cestoda, por ejemplo, *Anoplocephala perfoliata*, *Moniezia expansa*, *Moniezia benedeni*, *Raillietina tetragona*, *Raillietina echinobothrida* y *Raillietina cesticillus*, plagas pertenecientes a Rhizomastigida del Phylum Protozoa Flagellat, por ejemplo, *Histomonas*; Protomastigida, por ejemplo, *Leishmania* y *Trypanosoma*; Hipermastigida, por ejemplo, *Giardia*; y Trichomonadida, por ejemplo, *Trichomonas*,
- 20 Amoebida de Sarcodina, por ejemplo, *Entamoeba*, y Piroplasmia de Sporozoea, por ejemplo, *Theilaria* y *Babesia*; y Telosporea, por ejemplo, *Eimeria*, *Plasmodium* y *Toxoplasma*.
- El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede usarse para exterminar organismos nocivos que causan daño o malestar directo al cuerpo humano o para mantener la salud pública frente a organismos nocivos que portan y transmiten patógenos. Los ejemplos específicos de organismos nocivos incluyen los siguientes.
- 25 Adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Lepidoptera de Arthropoda Insecta, por ejemplo, Lymantriidae, como *Sphrageidus similis*; Lasiocampidae, como *Kunugia undans*; Limacodidae, como *Parasa consocia*; y Zygaenidae, como *Artona martini*,
- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Coleoptera, por ejemplo, Oedemeridae, como *Xanthochroa waterhousei*; Meloidae, como *Epicauta gorhani*; y Staphylinidae, como *Paederus fuscipes*,
- 30 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Hymenoptera, por ejemplo, Vespidae, como *Vespa simillima* xanthoptera; Formicidae, como *Brachyponera chinensis*; y Pompilidae, como *Batozonellus annulatus*,
- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Diptera, por ejemplo, Culicidae, como *Armigeres subalbatus*; Ceratopogonidae, como *Culicoides nipponensis*; Chironomidae, como *Chironomus yoshimatsui*; Simuliidae, como *Simulium nikkoense*; Tabanidae, como *Hirosia humilis*; Muscidae, como *Musca domestica*; Fanniidae, como *Fannia canicularis*; Calliphoridae, como *Phormia regina*; y Calliphoridae, como *Sarcophaga peregrina*,
- 35 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Siphonaptera, por ejemplo, Pulicidae, como *Pulex irritans*,
- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Blattodea, por ejemplo, Blattellidae, como *Blattella germanica*; y Blattidae, como *Periplaneta americana*, *Periplaneta fuliginosa* y *Periplaneta japonica*,
- 40 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Orthoptera, por ejemplo, Gryllacrididae, como *Diestrammena japonica* y *Diestrammena apicalis*,
- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Anoplura, por ejemplo, Pediculidae, como *Pediculus humanus humanus*; y Pthiridae, como *Phthirus pubis*,
- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Hemiptera, por ejemplo, Cimicidae, como *Cimex lectularius*; y Reduviidae, como *Isyndus obscurus*,
- 45 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Collembola de Arthropoda Parainsecta, por ejemplo, Hypogastridae, como *Hypogastrura communis*,
- adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Acari de Arthropoda Arachnida, por ejemplo, Ixodidae, como *Ixodes persulcatus*; Macronyssidae, como *Ornithonyssus bacoti*; Cheyletidae, como *Chelacaropsis moorei*; Pyemotidae, como *Pyemotes ventricosus*; Demodicidae, como *Demodex folliculorum*; Pyroglyphidae, como *Dermotophagoides pteronyssinus*; Sarcoptidae, como *Sarcoptes scabiei*; y Trombiculidae, como *Trombicula akamushi*,
- 50

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Araneae, por ejemplo, Clubionidae, como Chiracanthium japonicum; Sparassidae, como Heteropoda venatoria; Pholcidae, como Sperophora senoculata y Pholcus falangioides; Urocterae, como Uroctea compactilis; y Salticidae, como Plexippus paykulli y Plexippus adansoni,

5 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a escorpiones, por ejemplo, Buthidae, como Isometrus europaeus,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Scolopendromorpha de Arthropoda Chilopoda, por ejemplo, Scolopendridae, como Scolopendra subspinipes mutilans y scolopendra subspinipes japonica,

adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Scutigermorpha, por ejemplo, Scutigeridae, como Thereuronema hilgendorfi,

10 adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Polydesmida de Arthropoda Diplopoda, por ejemplo, Paradoxosomatidae, como Oxidus gracilis,

Adultos, larvas y huevos de plagas pertenecientes a Isopoda de Arthropoda Crustacea, por ejemplo, Porcellionidae, como Porcellio scaber, y

15 plagas pertenecientes a Gnathobdellida de Annelida Hirudinea, por ejemplo, Haemadipsidae, como Haemadipsa zeylanica japonica, y

Eumycetes, por ejemplo, hongos Trichophyton, como Trichophyton rubrum y Trichophyton mentagrophytes; hongos Candida, como Candida albicans; y hongos Aspergillus, como Aspergillus fumigatus, bacterias Gram negativas, por ejemplo, Escherichia coli y Pseudomonas aeruginosa, y bacterias Gram positivas, por ejemplo, Staphylococcus aureus.

20 El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) es particularmente valioso en el control de organismos nocivos que dañan cultivos, árboles en bosques naturales, bosques plantados y espacios verdes urbanos, y plantas ornamentales, como artrópodos, gasterópodos, nematodos y hongos. En tal situación, el compuesto de la presente invención también puede estar presente en una formulación comercialmente útil y una forma de uso preparada a partir de dicha formulación como agente mixto con otro compuesto activo tal como un insecticida, un acaricida, un nematocida, un fungicida, un sinergista, un regulador del crecimiento vegetal, un cebo venenoso o un herbicida.

30 La forma de uso puede ser, por ejemplo, un polvo dispersable en agua, un polvo granular dispersable en agua, un agente fluido seco, un agente soluble en agua, un agente de emulsión, un agente líquido, un agente oleoso, un agente fluido tal como un agente de suspensión en agua o un agente de emulsión en agua, cápsulas, una formulación en polvo, gránulos, gránulos finos, un cebo, comprimidos, una formulación en pulverización, una formulación de neblina o una formulación en aerosol. Para formar estas formulaciones, pueden usarse apropiadamente diversos adyuvantes pesticidas que se han usado convencionalmente en el campo técnico de agentes químicos agrícolas y hortícolas. Estos adyuvantes pesticidas pueden usarse con el fin de, por ejemplo, mejorar el efecto, estabilizar y mejorar la dispersabilidad de agentes químicos agrícolas y hortícolas.

35 Los ejemplos del adyuvante pesticida incluyen un portador (diluyente), un agente esparcidor, un emulsionante, un agente humectante, un dispersante y un disgregante. Los ejemplos del portador líquido incluyen agua; hidrocarburos aromáticos, como tolueno y xileno; alcoholes, como metanol, butanol y glicol; cetonas, como acetona; amidas, como dimetilformamida; sulfóxidos, como dimetilsulfóxido; y metilnaftaleno, ciclohexano, aceites animales y vegetales y ácidos grasos. Los ejemplos de portadores sólidos incluyen arcilla, caolín, talco, tierra de diatomeas, sílice, carbonato cálcico, montmorillonita, bentonita, feldespato, cuarzo, alúmina, serrín, nitrocelulosa, almidón y goma arábiga.

Como emulsionante o dispersante, pueden usarse tensioactivos ordinarios. Por ejemplo, pueden usarse un tensioactivo aniónico, un tensioactivo catiónico, un tensioactivo no iónico o un tensioactivo anfótero, tal como sulfato sódico de alcohol superior, cloruro de esteariltrimetilamonio, alquilfeniléter de polioxietileno y lauril betaína.

45 Además, por ejemplo, puede usarse un agente esparcidor; un agente humectante, tal como sulfosuccinato de dialquilo; un agente adhesivo, tal como carboximetilcelulosa o poli(alcohol vinílico); y un disgregante, tal como lignina sulfonato de sodio o lauril sulfato de sodio.

50 Uno de los compuestos de la presente invención puede usarse solo como principio activo, o puede usarse una combinación de dos o más de los mismos como principio activo. En estas formulaciones, el contenido del compuesto de la presente invención como principio activo es, por ejemplo, del 0.01 al 99.5 % en masa y se selecciona preferiblemente de un intervalo del 0.5 al 90 % en masa y puede determinarse apropiadamente según diversas condiciones como la forma de formulación y el método de aplicación. Por ejemplo, es posible fabricar una formulación en polvo para que contiene de aproximadamente el 0.5 al 20 % en masa, preferiblemente del 1 al 10 % en masa, del principio activo, un polvo dispersable en agua para que contenga de aproximadamente el 1 al 90 % en masa, preferiblemente del 10 al 80 % en masa del principio activo, y un agente de emulsión para que contenga

de aproximadamente el 1 al 90 % en masa, preferiblemente del 10 al 40 % en masa del principio activo.

Para controlar artrópodos, gasterópodos, nematodos u hongos, habitualmente, la formulación puede usarse pulverizando hojas y tallos de plantas en un lugar donde está produciéndose o puede producirse el daño causado por estos organismos nocivos o permitiéndose que se absorba por las raíces mediante el tratamiento del suelo o similar a través de, por ejemplo, mezclado de todas las capas del suelo, aplicación en hileras de plantación, mezcla de suelo en lechos, plántula celular, tratamiento de hoyos de plantación, tratamiento de raíces de plantas, recubrimiento superior, tratamiento en cajas de plantas de arroz o aplicación sumergida. Además, la formulación puede usarse mediante el tratamiento de semillas, como remojo de semillas en productos químicos, recubrimiento en polvo de semillas o tratamiento con Calper, aplicación a una solución nutritiva en nutricultura (cultivo hidropónico) o ahumado o inyección en el tronco. En el uso, aunque varía dependiendo del tipo y la cantidad del organismo nocivo, la forma de cultivo o las condiciones de crecimiento del cultivo o árbol objetivo, en general, se aplican de 0.1 a 1000 g, preferiblemente de 1 a 100 g, del principio activo por 10 áreas. En este caso, se diluye un polvo dispersable en agua, un polvo granular dispersable en agua, un agente fluido seco, un agente soluble en agua, un agente de emulsión, un agente líquido, un agente fluido tal como un agente de suspensión en agua o un agente de emulsión en agua, o cápsulas con agua y, aunque varía dependiendo del tipo, la forma de cultivo o la condición de crecimiento de la planta objetivo, en general, la formulación diluida puede pulverizarse sobre un cultivo o similar en una cantidad de aplicación de 10 a 1000 l por 10 áreas. En el caso de una formulación en polvo, una formulación en pulverización o una formulación en aerosol, puede tratarse un cultivo o similar con la formulación tal como está.

Los ejemplos del método de aplicación cuando los organismos nocivos objetivo dañan principalmente las plantas en el suelo o cuando los organismos nocivos objetivo se controlan permitiendo que un agente químico se absorba desde las raíces incluyen un método de aplicación de una formulación a la raíz de la planta o al lecho del vivero para cultivar plántulas con o sin dilución en agua, un método de pulverización de gránulos a la raíz de la planta o al lecho del vivero para plántulas, un método de pulverización de una formulación en polvo, un polvo dispersable en agua, un polvo granular dispersable en agua o gránulos para mezclarlos con todo el suelo antes de sembrar o trasplantar, y un método para la pulverización de una formulación en polvo, un polvo dispersable en agua, un polvo granular dispersable en agua, gránulos o gránulos finos a los hoyos de plantación o a las hileras de plantación antes de sembrar o plantar las plantas. Es suficiente que se diluya un polvo dispersable en agua, un polvo granular dispersable en agua, un agente soluble en agua, un agente de emulsión, un agente líquido, un agente fluido tal como un agente de suspensión en agua o un agente de emulsión en agua, o cápsulas con agua y puede pulverizarse a la superficie del suelo o irrigarse en el suelo, en general, en una cantidad de aplicación de 5 a 500 l por 10 áreas, de manera que sea uniforme en toda el área de tratamiento. Puede pulverizarse una formulación en polvo, gránulos, gránulos finos o un cebo sobre la superficie del suelo en el estado de la formulación para que sea uniforme en toda el área de tratamiento. La pulverización o irrigación puede realizarse alrededor de las semillas, los cultivos o los árboles que van a protegerse de daños. Además, el principio activo puede dispersarse mecánicamente arando durante la pulverización o después de la pulverización.

Como método de aplicación a la caja de vivero de arroz con cáscara, mientras que la forma de dosificación puede diferir según el momento de la aplicación, como aplicación en el momento de la siembra, aplicación en la fase de enverdecimiento o aplicación en el momento del trasplante, por ejemplo, la aplicación puede realizarse en una forma de dosificación tal como una formulación en polvo, un polvo granular dispersable en agua, gránulos o gránulos finos. La aplicación también puede realizarse mezclando la formulación con suelo de cultivo, y el suelo de cultivo puede mezclarse con una formulación en polvo, un polvo granular dispersable en agua, gránulos o gránulos finos, por ejemplo, mezclando suelo de lecho, mezclando suelo de cobertura o mezclando con todo el suelo de cultivo. Alternativamente, puede aplicarse simplemente suelo de cultivo y una formulación alternativamente en forma de capa.

Como método de aplicación a un arrozal, en general, se pulveriza una formulación sólida tal como un agente jumbo, un agente de embalaje, gránulos o un polvo granular dispersable en agua o un agente líquido tal como un agente fluido o un agente de emulsión para un arrozal en condición sumergida. Además, en el momento de plantar arroz, también puede pulverizarse o inyectarse en el suelo una formulación apropiada directamente o como una mezcla con un fertilizante. El uso de un agente químico líquido, tal como un agente de emulsión o un agente fluido, en una fuente de entrada de agua a un arrozal, tal como una salida de agua o un equipo de irrigación, permite la aplicación con el suministro de agua de una manera que ahorra mano de obra.

Los ejemplos del método de tratamiento de semillas incluyen un método de sumergir semillas en una formulación líquida o sólida en estado líquido con o sin dilución para permitir que el producto químico se adhiera o se infiltre en las semillas, un método de mezclar una formulación sólida o una formulación líquida con semillas para tratamiento de recubrimiento para permitir que la formulación se adhiera a las superficies de las semillas, un método para mezclar semillas con un portador adhesivo, tal como una resina o un polímero, para recubrir las semillas con el portador, y un método de pulverización de una formulación cerca de las semillas al mismo tiempo que se planta. El término "semillas" que van a someterse a tratamiento de semillas significa cuerpos vegetales cultivados tempranamente usados para la propagación de plantas, y ejemplos de los mismos incluyen, además de semillas, bulbos, tubérculos, patatas de siembra, brotes, propágulos y plantas de propagación vegetativas para cultivo de bulbos o esquejes. El término "suelo" o "portador de cultivo" para una planta en aplicación indica un soporte para cultivar un cultivo, en particular, un soporte para permitir que crezcan las raíces, y el material del mismo no está

particularmente limitado siempre que permita que las plantas crezcan. El soporte puede ser el denominado suelo, estera de vivero o agua, y los ejemplos del material incluyen arena, piedra pómez, vermiculita, tierra de diatomeas, agar, sustancia similar a un gel, sustancia polimérica, lana de roca, lana de vidrio, astillas de madera y corteza.

5 El tratamiento de una planta cultivada que va a trasplantarse durante la siembra y el período de siembra es preferiblemente un tratamiento directo de las semillas o un tratamiento de irrigación con un agente químico en estado líquido o un tratamiento de pulverización de gránulos en un lecho de vivero. Además, también es preferible tratar los hoyos de plantación con gránulos en el momento de la plantación o mezclar los gránulos con el soporte de cultivo cerca de la posición de trasplante.

10 El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también es valioso para proteger la madera (árboles en pie, árboles caídos, madera procesada, madera almacenada o madera estructural) del daño de insectos, como termitas y escarabajos, y hongos. En tal situación, el control es posible mediante un método de realización de pulverización, inyección, irrigación o aplicación de un agente oleoso, un agente de emulsión, un polvo dispersable en agua, una formulación de sol o la pulverización de una formulación en polvo o gránulos a la madera o al suelo alrededor de la madera. El agente oleoso, el agente de emulsión, el polvo dispersable en agua o la
15 formulación en polvo que se usa en esta situación pueden estar presentes como un agente mixto con otro compuesto activo, tal como un insecticida, un acaricida, un nematocida, un fungicida, un repelente o un sinérgico, y la cantidad total de compuestos de principio activo en tal formulación es del 0.0001 al 95 % en masa. Para el agente oleoso, la formulación en polvo o los gránulos, la cantidad es preferiblemente del 0.005 al 10 % en masa, y para el agente de emulsión, el polvo dispersable en agua o la formulación de sol, la cantidad es preferiblemente del 0.01
20 al 50 % en masa. En el caso del control de artrópodos u hongos, se pulverizan de 0.01 a 100 g del compuesto de principio activo por 1 m² de suelo o superficie de madera.

El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) puede usarse para proteger productos de, por ejemplo, cereales, frutas, frutos secos, especias y tabaco cuando se almacenan tal como están, en forma de polvo o en estados mixtos en productos, del daño causado por lepidópteros, coleópteros, ácaros y hongos. Además,
25 cuando se almacenan productos animales (cuero, pieles, lana, plumas, etc.) o vegetales (algodón, papel, etc.) en su estados naturales o transformados, es posible protegerlos de los ataques de Lepidoptera, Coleoptera, Thysanura y Periplaneta. Además, es posible proteger alimentos como carne y pescado del ataque de Lepidoptera, Coleoptera, Diptera y ácaros. En tal situación, el control es posible mediante un método de pulverización de un agente oleoso, un agente de emulsión, un polvo dispersable en agua o una formulación en polvo, instalando un agente de transpiración de resina, tratando con un agente humeante o una formulación de neblina, instalando gránulos,
30 comprimidos, cebos envenenados o aerosoles de pulverización. Estas formulaciones también pueden estar presentes como un agente mixto con otro compuesto activo, tal como un insecticida, un acaricida, un nematocida, un fungicida, un repelente o un sinérgico, y la cantidad total de los compuestos de principio activo en tal formulación puede ser del 0.0001 al 95 % en masa.

35 El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) es valioso para exterminar o prevenir artrópodos u hongos que parasitan la superficie corporal de seres humanos y ganado y causan daño directo tal como alimentándose de la piel o chupando sangre; artrópodos, nematodos, trematodos, cestodos o protozoos que transmiten enfermedades humanas y del ganado o son mediadores de tales enfermedades; y artrópodos que incomodan a los seres humanos. En tal situación, el compuesto de la presente invención puede administrarse por
40 vía oral como una comida o alimento que contiene una pequeña cantidad del compuesto de la presente invención o como una composición química farmacéutica ingerible apropiada, por ejemplo, comprimidos, píldoras, cápsulas, pastas, geles, bebidas, alimentos medicados, agua potable medicada, cebos medicados o píldoras grandes de liberación controlada que incluyen un portador o material de recubrimiento farmacéuticamente aceptable, u otro dispositivo de liberación controlada que va a retenerse en el tracto gastrointestinal, o puede administrarse
45 percutáneamente como pulverización, polvo, grasa, crema, ungüento, emulsión, loción, un agente para aplicación en la piel, un agente para aplicación en poros o champú. Para lograr un efecto mediante tales usos, la formulación generalmente contiene del 0.0001 al 0.1 % en masa, preferiblemente del 0.001 al 0.01 % en masa, de un compuesto de principio activo. A propósito, como método para la administración percutánea o la administración tópica, puede usarse un dispositivo (por ejemplo, un collar, un medallón o una etiqueta en la oreja) unido a un animal para controlar
50 artrópodos local o sistémicamente.

Ahora se explicarán específicamente, pero no se limitarán a los mismos, un método de administración oral y un método de administración transdérmica cuando el compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) se usa como insecticida para animales como ganado y mascotas o seres humanos.

55 Cuando el compuesto se administra por vía oral como agua potable medicada, la bebida suele ser una solución, suspensión o dispersión del compuesto en un disolvente no tóxico apropiado o agua junto con un agente de suspensión, tal como bentonita, o un humectante u otro excipiente. En general, una bebida también contiene un agente antiespumante. Una formulación de bebida contiene generalmente del 0.01 al 1.0 % en masa, preferiblemente del 0.01 al 0.1 % en masa de un compuesto de principio activo.

Quando es deseable administrar por vía oral un sólido seco en una forma de dosificación unitaria, generalmente se usan cápsulas, píldoras o comprimidos que contienen una cantidad predeterminada de un principio activo. Estas formas de uso se fabrican mezclando un principio activo con un diluyente, carga, disgregante y/o aglutinante finamente triturado, tal como almidón, lactasa, talco, estearato de magnesio o caucho vegetal. Tal prescripción de uso unitario puede cambiar ampliamente la masa y el contenido de un insecticida según el tipo del animal huésped que va a tratarse, el grado de infección, el tipo de parásito y el peso del huésped.

En la administración a través de piensos para animales, el compuesto activo puede usarse dispersándolo homogéneamente en el pienso, como recubrimiento o en forma de gránulos. En general, para lograr un efecto antiparasitario deseable, el contenido final del compuesto de principio activo en el pienso es del 0.0001 al 0.05 % en masa y preferiblemente del 0.0005 al 0.01 % en masa.

El compuesto activo que va a disolverse o dispersarse en un excipiente de portador líquido puede administrarse por vía parenteral a un animal mediante inyección intragástrica, intramuscular, intratraqueal o subcutánea. Para la administración parenteral, el compuesto activo se mezcla adecuadamente con un aceite vegetal apropiado, tal como aceite de cacahuete o aceite de semilla de algodón. En tal prescripción, generalmente, el contenido del compuesto de principio activo es del 0.05 al 50 % en masa y preferiblemente del 0.1 al 5.0 % en masa.

Alternativamente, el compuesto activo puede administrarse por vía tópica mezclándolo con un portador apropiado, tal como dimetilsulfóxido o un disolvente de hidrocarburo. Esta formulación se aplica directamente a la superficie exterior del animal mediante pulverización o adición directa.

Además, el compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede usarse como insecticida contra artrópodos que causan daño directo o artrópodos que son mediadores de enfermedades, mediante pulverización, inyección, irrigación o aplicación de un agente oleoso, un agente de emulsión, un polvo dispersable en agua, etc., mediante pulverización de una formulación en polvo, etc., mediante tratamiento con un fumigante, una formulación de neblina térmica tal como una bobina antimosquitos, un agente humeante autocombustible o una formulación de neblina de tipo reacción química, un agente humeante como nebulización o un agente ULV, o mediante la instalación de gránulos, comprimidos o un cebo venenoso en el entorno circundante donde los organismos nocivos pueden estar latentes, o mediante adición dejando gotear una formulación en polvo flotante, gránulos, etc. en un canal de agua, un pozo, un depósito de agua, un tanque de agua u otro agua corriente o estancada. Además, Lymantriidae, que también es una plaga agrícola y forestal, puede controlarse mediante el mismo método anterior. Contra Diptera, es eficaz un método de mezclar el compuesto con pienso para ganado de manera que el compuesto se mezcle con las heces, y contra Culicidae, también es eficaz un método de volatilizar el compuesto en el aire con un dispositivo eléctrico repelente de mosquitos o similar. A propósito, las formulaciones en estas formas de uso pueden estar presentes como agentes mixtos con otro compuesto activo, tal como un agente de control de plagas, un agente de control de ácaros, un agente de control de nematodos, un agente de control de enfermedades, un repelente o un sinergista, y la cantidad total de compuestos de principio activo en tal formulación es del 0.0001 al 95 % en masa.

El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede estar presente junto con otro compuesto activo como agente de mezclado. En particular, en el control de organismos nocivos, como artrópodos, gasterópodos y nematodos, que dañan las plantas, la gama de plagas objetivo que va a controlarse puede ampliarse usando el compuesto como una mezcla con un compuesto (insecticida) que tiene una actividad de control de plagas, una actividad de control de garrapatas o una actividad de control de nematodos, y pueden esperarse efectos sinérgicos, como una reducción de la dosis. Los ejemplos de tal compuesto activo incluyen los siguientes.

Agentes organofosforados, como acefato, azinfos-metilo, clorpirifos, daizín, diclorvos, dimetón-S-metilo, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, etión, fenitrotión, fentión, isoxatión, malatión, metamidofos, metidatión, monocrotofos, naled, oxideprofos, paratión, fentoato, fosfalona, pirimifos-metilo, piridafentión, profenofos, protiofos, propafos, piraclofos, salitión, sulfprofos, tiometón, tetraclorvinfos, triclorfón y vamidotión;

agentes de carbamato, como alanycarb, bendiocarb, benfurcarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfán, etiofencarb, fenobucarb, furatiocarb, isoprocarb, metomilo, metolcarb, pirimicarb, propoxur y tiocarb;

agentes de cloro orgánico, como aldrina, clordano, DDT (p,p'-DDT), endosulfán y lindano;

agentes piretroides, como acrinetrina, aletrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, deltametrina, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenprox, fluvalinato, furametrina, halfenprox, imiprotrina, permtrina, fenotrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, silafluofen, teflutrina, tralometrina y transflutrina;

agentes neonicotinoides, como acetamiprid, clotianidina, dinotefran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam;

agentes de diamida, como clorantraniliprol, ciantraniliprol, ciclaniliprol, flubenciamida y tetraniliprol;

agentes de fenilpirazol, como etiprol, fipronil, acetoprol, pirafluoprol y piriplore;

agentes de nereistoxina, como bensultap, cartap, tiociclam y tiosultap;

reguladores del crecimiento de insectos que incluyen agentes de fenilbenzoilurea y diacilhidracinas, como clorfluazurón, diflubenzurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumurón, buprofezina, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida y ciromazina;

5 agentes hormonales juveniles, como diofenolan, fenoxicarb, hidropreno, metopreno y piriproxifeno;

materiales insecticidas producidos por microorganismos, como abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina, milbemectina, nemadectina, nikkomicina, polioxinas, espinetram, espinosad y agentes BT;

10 materiales insecticidas derivados de productos naturales, como anabasina, azadiractina, deguelina, decanolioctanoilglicerol, hidroxipropilalmidón, lecitina de soja, nicotina, normicotina, oleato de sodio, aceite de petróleo, éster de ácido graso de propilenglicol (monolaurato de propilenglicol), aceite de colza, rotenona, éster de ácido graso de sorbitán y almidón;

15 otros insecticidas, como afidpiropen, benzopirimoxano, broflanilida, clorfenapir, diafentiurón, dicloromezotiaz, dimpropiridaz, DBEDC (sal de bisetilendiamina y cobre [II] del ácido dodecilbencenosulfónico), flonicamid, flometoquina, flufenerim, flupiradifurona, flupirimina, fluralaner, fluxametamida, hidrametilnon, indoxacarb, isocicloseram, metaflumizona, metaldehído, sulfato de nicotina, oxazosulfilo, pimetozina, piridalilo, pirfluquinazona, espirotetramato, sulfoxaflor, tolfenpirad, triazamato, triflumezopirim y ticlopirazoflor;

20 acaricidas, como acequinciclo, acinonapir, amidoflomet, amitraz, azociclotina, benzoximato, bifenazato, binapacril, bromopropilato, quinometionato, clofentezina, cienopirafeno, ciflumetofeno, hidróxido de tricicloexilestaño (cihexatina), dicofol, dienocloro, etoxazol, fenazaflor, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacripirim, hexitiazox, pirimidifeno, polinactinas, propargita, piflubumida, piridabeno, espiroclifofeno, espiropidión, espiromesifeno, tebufenpirad, tetradifón y KUI-1821 (nombre de prueba);

mematicidas, como fosfuro de aluminio, benclotiaz, cadusafos, etoprofos, fluazaindolizina, fluensulfona, fostiazato, furfural, imicyafos, clorhidrato de levamisol, mesulfenfos, carbam (metam-amonio), isotiocianato de metilo, tartrato de morantel, oxamilo y tiozafeno; y

25 cebos venenosos, como clorfacinona, cumatetralilo, difacinona, monofluoroacetato (fluoroacetato de sodio) y warfarina.

El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (1) también puede estar presente como un agente mixto con un compuesto activo distinto del compuesto que tiene una actividad de control de plagas, una actividad de control de garrapatas o una actividad de control de nematodos. Para controlar enfermedades y/o malezas que se producen simultáneamente en el momento de uso, puede esperarse un efecto sinérgico de una reducción en el trabajo de control de plagas y una reducción en la dosis usando el compuesto de la presente invención en combinación con un compuesto que tiene una actividad bactericida, una actividad herbicida o una actividad reguladora del crecimiento vegetal. Además, puede esperarse un efecto de control más eficaz mediante el efecto sinérgico, etc. usando el compuesto mezclado con un repelente o un sinergista.

35 Los ejemplos de tal compuesto activo incluyen agentes de control de enfermedades, por ejemplo, DD (1,3-dicloropropeno), acibenzolar-S-metilo, aldimorf, ametoctradina, amisulbrom, andoprim, triazina (anilazina), azaconazol, azoxistrobina, sulfato de cobre básico, benodanilo, benomil, bentiavalicarb-isopropilo, bentiazol, bitertanol, bixafeno, blastidina S, boscalid, bromuconazol, carbonato de calcio, butiobato, azufre de cal (polisulfuro de calcio), captafol, captan, carbendazim, carboxina, carpropamida, quinometionato, clorfenazol, cloroneb, cloropirina, clorotalonil, clozolinato,

40 DBEDC (complejo de bis(etilendiamina)cobre-bis-(ácido dodecilbencenosulfónico)), hidróxido de cobre, nonilfenolsulfonato de cobre, oxicloruro de cobre, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, dazomet, diclobutrazol, diclofluanida, diclona, diclocimet, diclomezina, dietofencarb, difenoconazol, diflometorim, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, ditano inoxidable, ditianon, dodina, eclomezol, edifenfos, enestrobina, epoxiconazol, etaconazol, etaboxam, extracto de champiñón, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanol, fenciclonil, fenpropidina, fenpirazamina, ferimzona, fluazinam, flumetover, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluorimida, fluotrimazol, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusulfamida, flutolanil, fluxapiroxad, folpet, fosetil-Al, ftalida, fuberidazol, fludioxonil, flusilazol, flutianil, flutriafol, furametpir, furconazol, guazatina, hexaconazol, hidroxioxazol, himexazol, imazalil, sulfato de imazalil, imibenconazol, acetato de iminoctadina, albesilato de iminoctadina (iminoctadina-DBS), ipconazol, IBP (iprobentfos), iprodiona, iprovalicarb, isofetamid, isoprotiolano, isopirazam, isotianil, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, manzeb, mepanipirim, mepronil, metalaxil, carbam (metam-amonio), carbam-sodio (metam-sodio), metconazol, metasulfocarb, bromuro de metilo, metilisotiocianato, metominostrobin, metrafenona, mildiomicina, miclobutanil, sal orgánica de azufre y níquel (dimetilditiocarbamato de níquel), nuarimol, orisastrobina, oxadixil, oxatiapiprolina, organocobre (oxina-cobre), ácido oxolínico, fumarato de oxpoconazol, oxicarboxina, oxi-triaciclina, epulato, pefurazato, penconazol, penicuron, penflufen, pentiopirad, picarbutrazox, picoxistrobina, piperalina, policarbamato, polioxina B, polioxinas, bicarbonato de potasio, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb,

propiconazol, propineb, proquinazida, protioconazol, piraclostrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, pirazofos, piribencarb, piridinitril, pirifenox, pirimetanilo, pirofenona, piroquilón, quinoxifeno, quintoceno, sedaxano, plata, simeconazol, hidrogenocarbonato de sodio, hipoclorito de sodio, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebfloquina, tebuconazol, tecloftalam, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tiadiazina, tifulazida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinil, tolclofos-metilo, tolprocarb, toliifluanida, triadimefón, triadimenol, triclopiricarb, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol-P, validamicina(-A), vinclozolina, zarilamida, sulfato de zinc, zineb, ziram y zoxamida.

Ejemplos del compuesto que tiene actividad herbicida incluyen

aclonifeno, acifluofen n-sódico, alaclor, aloxidim, amicarbazona, amidosulfurón, anilofos, asulam, atrazina, azimsulfurón, benfuresato, bensulfurón-metilo, bentazona, bentiocarb, benzobiciclón, benzofenap, bialafos, bifenox, bromobutida, bromoxinil, butamifos, cafenstrol, peróxido de calcio, carbetamida, cinosulfurón, clomeprop, ciclosulfamurón, cihalofop-butilo, daimurón, desmedifam, diclofop-metilo, diflufenican, dimefurón, dimetametrina, dinoterb, diquat, diurón, esprocarb, etiozina, etofumesato, etoxisulfurón, etobenzanida, fenoxaprop-P-etilo, fentrazamida, flucarbazona, flufenacet, flurtamona, flutiacet-metilo, foramsulfurón, glufosinato de amonio, glifosato-isopropilamina, glifosato-trimesio, imazapir, imazosulfurón, indanofan, yodosulfurón, ioxinil-octanoato, isoproturón, isoxadifeno, isoxaflutol, lactofeno, linurón, mefenacet, mesosulfurón, metamitrón, metabenzotiazurón, metosulam, metribuzina, napropamida, neburón, oxadiargilo, oxadiazón, oxaziclomefona, paraquat, pendimetalina, pentoxazona, fenmedifam, pretilacloro, propoxicarbazona, prosulfocarb, piracilonil, piraflufen-etilo, pirazolato, pirazosulfurón n-etilo, piributicarb, piriftalida, piriminobac-metilo, quizalofop-etilo, setoxidim, simazina, sulcotrion, sulfentrazona, tenilcloro, triaziflam y tribufos.

Como compuesto que tiene actividad reguladora del crecimiento vegetal, por ejemplo, pueden usarse en combinación 1-naftilacetamida (ácido 1-naftilacético), 4-CPA, 6-bencilaminopurina, butralina, cloruro de calcio, formiato de calcio, peróxido de calcio, sulfato de calcio, cloromequat (cloruro de cloromequat), colina, cianamida, ciclanilida, daminozida, alcohol decílico, diclorprop, etefón, eticlozato, flurprimidol, forclorfenurón, giberelina (ácido giberélico), ácido indolbutírico, sal potásica de hidrazida maleica, mefenpir, cloruro de mepiquat, sulfato de oxina (sulfato de 8-hidroxiquinolina), paclobutrazol, parafina, prohexadiona-calcio, prohidrojasmona, tidiazurón, trinexapac-etil, uniconazol-P o cera.

Los ejemplo del repelente incluyen capsaicina, carano-3,4-dial, citronelal, deet, ftalato de dimetilo, hinokitiol, limoneno, linalol, mentol, mentona, naftaleno y tiram.

Los ejemplos del sinergista incluyen metilendioxinaftaleno, naftil propinil éter, tiocianato de nitrobenzilo, octaclorodipropil éter, pentinilftalimida, fenilsalioxón, butóxido de piperonilo, safrol, sesamex, sesamina, sulfóxido, fosfato de trifenilo y verbutina.

Se espera que el compuesto de la presente invención proporcione el mismo efecto que el de un pesticida biótico al usarse en combinación con el pesticida biótico, por ejemplo, una formulación viral, tal como el virus de la poliedrosis citoplasmática (CPV), el virus de entomopox (EPV), virus de la granulosis (GV) o virus de la poliedrosis nuclear (NPV); un pesticida microbiano que se usa como insecticida o nematocida, como *Beauveria bassiana*, *Beauveria brongniartii*, *Monacrosporium Phymatophagum*, *Paecilomyces fumosoroseus*, *Pasteuria penetrans*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema glaseri*, *Steinernema kushidai* o *Verticillium lecanii*; un pesticida microbiano que se usa como fungicida, tal como *Agrobacterium radiobactor*, *Bacillus subtilis*, *Erwinia carotovora* no patógena, *Fusarium oxysporum* no patógena, *Pseudomonas CAB-02*, *Pseudomonas fluorescens*, *Talaromyces flavus*, *Trichoderma atroviride* o *Trichoderma lignorum*; o un pesticida biótico que se usa como herbicida, como *Xanthomonas campestris*.

Además, es posible usar el presente compuesto como pesticida biótico en combinación con, por ejemplo, un enemigo natural, tal como *Amblyseius californicus*, *Amblyseius cucumeris*, *Amblyseius degenerans*, *Aphidius colemani*, *Afidoletes aphidimyza*, *Chrysoperia carnea*, *Dacnusa sibirica*, *Diglyphus isaea*, *Encarsia formosa*, *Eretmocerus eremicus*, *Franklinothrips vespiformis*, *Harmonia axyridis*, *Hemiptarsenus varicornis*, *Neochrysocharis formosa*, *Orius sauteri*, *Orius strigicollis*, *Phytoseiulus persimilis*, *Pilophorus typicus* o *Piocoris various*; o una formulación de feromonas, tal como codlelure, cuelure, geraniol, giptol, liblure, looplure, metil eugenol, orfuralure, peachflure, phycilure, pirimalure o trementina.

Ejemplos

La presente invención se describirá ahora con mayor detalle mediante ejemplos, ejemplos de formulación y ejemplos de prueba, pero el alcance de la presente invención no se limita a estos ejemplos, ejemplos de formulación y ejemplos de prueba.

Ejemplo 1. Síntesis de N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etiltio)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida, compuesto n.º: A-13)

Se añadió hidruro de sodio (60 %, 0.06 g) a una solución de N-{4-(trifluorometil)-3-(etiltio)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (0.35 g) en N,N-dimetilformamida (3.5 ml), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 6 minutos. Luego se le añadió clorometil metil éter (122 µl), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3.5 horas. Además, se le añadió clorometil metil éter (122 µl), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 2.5 horas. Después de la adición de ácido clorhídrico 1 N a la solución de reacción, se realizó la extracción con acetato de etilo. La capa orgánica resultante se lavó con solución salina saturada y luego se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El desecante se separó por filtración y el disolvente se destiló a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para obtener N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etiltio)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (0.27 g, pf: de 103 °C a 105 °C)

Ejemplo 2. Síntesis de N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etilsulfinil)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (compuesto n.º: A-14)

Se añadió ácido 3-cloroperbenzoico (0.06 g) a una solución de N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etiltio)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (0.11 g) en cloroformo (2 ml), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3.5 horas. Se añadió agua con bicarbonato de sodio saturado a la solución de reacción, seguido de extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con solución salina saturada y luego se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El desecante se separó por filtración y el disolvente se destiló a presión reducida. Los cristales en bruto resultantes se lavaron con hexano para obtener N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etilsulfinil)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (0.08 g, pf: de 147 °C a 149 °C)

Ejemplo 3. Síntesis de N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etilsulfonyl)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (compuesto n.º: A-15)

Se añadió ácido 3-cloroperbenzoico (0.27 g) a una solución de N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etiltio)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (0.22 g) en cloroformo (3 ml), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 4 horas. Se añadió agua con bicarbonato de sodio saturado a la solución de reacción, seguido de extracción con cloroformo. La capa orgánica resultante se lavó con solución salina saturada y luego se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El desecante se separó por filtración y el disolvente se destiló a presión reducida. Los cristales en bruto resultantes se lavaron con hexano para obtener N-(metoximetil)-N-{4-(trifluorometil)fenil}-3-(etilsulfonyl)-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (0.22 g, pf: de 165 °C a 166 °C).

Con respecto a los compuestos fabricados como en los ejemplos anteriores, los datos de ¹H-RMN se muestran en la siguiente tabla 2.

Tabla 2

Compuesto n.º	¹ H-RMN[CDC13/TMS, 400MHz]
A-1	¹ H-RMN(CDC13) δppm: 1.22 (3H, t), 2.32 (3H, s), 3.74 (2H, s), 5.39 (2H, s), 7.42 (3H, d), 7.50 (2H, d), 7.62 (1H, d), 8.71 (1H, s)
A-4	¹ H-RMN(CDC13) δppm: 1.19 (3H, t), 1.21 (3H, t), 2.82 (2H, q), 3.74 (2H, s), 5.37 (2H, s), 7.40 (3H, d), 7.49 (2H, d), 7.61 (2H, d), 8.74 (1H, s)
A-7	¹ H-RMN(CDC13) δppm: 0.97 (3H, t), 1.22 (3H, t), 1.53 (2H, q), 2.74 (2H, t), 3.75 (2H, s), 5.37 (2H, s), 7.40 (3H, d), 7.49 (2H, d), 7.61 (1H, d), 8.72 (1H, s)

ES 2 988 405 T3

A-10 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.22-1.24 (9H, m), 3.44+3.59 (1H, quin+quin), 3.75+3.83 (2H, s+q), 5.36+5.63 (2H, s+s), 7.40-7.81 (6H, m), 8.75+8.92 (1H, s+s)
A-12 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.10+1.21 (3H, s+t), 1.38 (6H, d), 3.54+3.85-3.94 (4H, s+m), 5.13+5.36 (2H, s+s), 7.40-8.06 (6H, m), 9.22+9.36 (1H, s+s)
A-16	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.18-1.28 (6H, m), 2.86 (2H, q), 3.79 (2H, s), 5.32 (2H, s), 7.28-7.95 (7H, m)
A-21 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.11+1.24 (3H, s+t), 1.35+1.41 (3H, t+t), 3.60+3.84 (4H, q+q), 5.17+5.36 (2H, s+s), 7.19 (1H, d), 7.51+7.73 (4H, s+s), 7.83+8.12 (1H, s+s), 9.02+9.15 (1H, d+d)
A-22 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.18+1.21 (6H, t+a.), 2.87+2.94 (2H, q+q), 3.74+3.83 (2H, s+q), 5.39+5.63 (2H, s+s), 6.98+7.06 (1H, t+t), 7.42-7.60 (5H, m), 8.59+8.73 (1H, d+d)
A-24 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.12-1.29 (3H, m), 1.35+1.41 (3H, t+t), 3.60+3.84 (4H, q+q), 5.17-5.27+5.36 (2H, m+s), 7.07 (1H, t), 7.26-8.06 (5H, m), 9.06+ (1H, d+s)
A-25	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.18 (6H, m), 2.77 (2H, q), 3.73 (2H, s), 5.37 (2H, s), 7.22 (1H, d), 7.39-7.50 (5H, m), 8.41 (1H, s)
A-28	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.17-1.24 (6H, m), 2.37 (2H, s), 2.74 (2H, q), 3.71 (2H, d), 5.39 (2H, s), 7.11 (1H, d), 7.42-7.50 (5H, m), 8.16 (1H, s)
A-29 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.18+1.24 (3H, t+t), 2.36 (3H, s), 3.24-3.33 (1H, m), 3.42-3.55 (1H, m), 3.56+3.68+3.86 (2H, d+t+s), 5.28-5.36+5.81 (2H, m+br), 7.19 (1H, d), 7.43 (3H, d), 7.59 (2H, d), 8.64+9.00 (1H, s+s)
A-31	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19 (3H, t), 1.24 (3H, t), 2.81 (2H, q), 3.76 (2H, s), 5.37 (2H, 2), 7.39-7.42 (4H, m), 7.60 (2H, s), 8.72 (1H, s)
A-33 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.27 (3H, t), 1.36 (3H, t), 3.54+3.85 (4H, q+q), 5.13+5.36 (2H, s+s), 7.29-8.05 (6H, m), 9.22+9.40 (1H, s+s)
A-34 ⁻¹	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.04+1.18-1.23+1.27 (6H, t+m+t), 2.87-3.03 (2H, m), 3.20-4.00 (2H, m), 4.58+4.75 (1H, d+d), 5.79+6.08 (1H, d+d), 7.28-7.83 (6H, m), 8.77+8.92 (1H, s+s)
A-43	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.18 (3H, t), 1.27 (3H, t), 2.21 (3H, s), 2.74 (2H, s), 3.86 (2H, s), 5.34 (2H, s), 6.95 (2H, s), 7.11 (2H, s), 7.37 (1H, s), 7.60 (1H, s), 8.64 (1H, s)
A-46	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19 (3H, t), 1.27 (3H, s), 2.81 (2H, s), 3.86 (2H, s), 5.33 (2H, s), 6.85 (2H, s), 7.21 (2H, s), 7.39 (1H, s), 7.58 (1H, s), 8.66 (1H, s)
A-49	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19 (3H, t), 1.26 (3H, t), 2.81 (2H, s), 3.81 (2H, s), 5.33 (2H, s), 7.19 (4H, s), 7.39 (1H, d), 7.61 (1H, s), 8.70 (1H, s)
A-52	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.18 (3H, t), 1.24 (3H, t), 2.81 (2H, d), 3.80 (2H, s), 5.33 (2H, s), 7.15 (2H, s), 7.32-7.42 (3H, m), 7.61 (1H, d), 8.71 (1H, s)
A-55	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.18 (3H, t), 1.24 (3H, t), 2.80 (2H, d), 3.78 (2H, s), 5.33 (2H, s), 7.02 (2H, s), 7.40 (1H, d), 7.5

	2 (2H, s), 7.62 (1H, d), 8.71 (1H, s)
A-61 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.20-1.29 (6H, m), 2.85+2.96 (2H, q+q), 3.71+3.84 (2H, q+q), 5.38+5.64 (2H, s+s), 7.38-7.83 (6H, m), 8.76+8.92 (1H, s+s)
A-63 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.24+1.37 (6H, t+t), 3.58+3.74-3.85 (4H, q+m), 5.35 (2H, s), 7.40-8.06 (6H, m), 9.28+9.66 (1H, s+s)
A-67	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19 (3H, t), 2.83 (2H, s), 3.81 (2H, s), 5.34 (2H, s), 7.00 (2H, s), 7.30-7.42 (3H, m), 7.60 (1H, s), 8.72 (1H, s)
A-68 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.22 (3H, s), 1.42 (3H, t), 3.30-3.39+3.43-3.51+3.69 (4H, m+m+s), 5.17+5.39+6.10 (2H, s+d+s), 7.20+7.42+7.78 (6H, s+s+s), 9.67 (1H, s)
A-69 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.09+1.26 (3H, t+t), 1.24+1.36 (3H, t+t), 3.56+3.84 (4H, q+q), 5.11+5.34 (2H, s+s), 7.04+7.31 (2H, d+d), 7.41+7.50 (2H, d+d), 7.52+7.69 (2H, d+d), 7.63+7.92 (2H, d+d), 9.25+9.40 (1H, s+s)
A-70 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19+1.22+1.46 (6H, t+t+t), 2.80+2.96 (2H, q+q), 3.74+4.49 (2H, d+q), 5.38 (2H, s), 7.32-7.83 (6H, m), 8.74+8.91 (2H, s+s)
A-71	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.21 (3H, t), 1.43 (3H, t), 3.31-3.40 (1H, m), 3.43-3.52 (1H, m), 3.61 (1H, s), 3.70 (1H, s), 5.29 (1H, s), 5.71 (1H, br), 7.35 (2H, s), 7.46 (2H, s), 7.63 (2H, d), 9.72 (1H, s)
A-72 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.14+1.26+1.37 (6H, s+s+t), 3.60+3.85 (4H, q+d), 5.16+5.37 (2H, s+s), 7.42+8.07 (6H, m), 9.27+9.37 (1H, s+s)
A-75	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.27+1.37 (6H, s+t), 3.60+3.85 (4H, q+s), 5.39 (2H, s), 7.40-8.06 (6H, m), 9.28 (1H, s)
A-79	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.21-1.30 (6H, m), 2.88 (2H, q), 3.68 (2H, q), 5.43 (2H, s), 7.43 (1H, d), 7.57 (3H, d), 7.89 (2H, d), 8.79 (1H, s)
A-80 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.23+1.44 (6H, t+t), 3.33-3.42 (1H, m), 3.44-3.51 (1H, m), 3.56-3.61 (1H, m), 3.66-3.80 (1H, m), 5.28 (1H, d), 5.82 (1H, d), 6.71-8.09 (6H, m), 9.74 (1H, s)
A-81 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.24+1.38+1.47 (6H, t+t+t), 3.61+3.73+3.79 (4H, q+q+s), 4.51+5.38 (2H, q+s), 7.59-7.72 (4H, m), 7.92-7.95 (2H, m), 9.31+9.65 (1H, s+d)
A-82	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19-1.28 (6H, m), 2.81 (2H, q), 3.74 (2H, s), 5.38 (2H, s), 7.31 (2H, d), 7.39 (1H, d), 7.48 (2H, d), 7.56 (1H, d), 8.73 (1H, s)
A-83	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.20 (3H, t), 1.43 (3H, t), 3.31-3.40 (1H, m), 3.43-3.52 (1H, m), 3.61 (1H, s), 3.70 (1H, s), 5.29 (1H, s), 5.71 (1H, br), 7.34 (2H, s), 7.46 (2H, s), 7.63 (2H, d), 9.72 (1H, s)
A-84 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19-1.28+1.37 (6H, m+t), 3.61+3.85 (4H, q+d), 5.17+5.38 (2H, s+s), 7.43-8.06 (6H, m), 9.27 (1H, s)
A-85 ^{*1}	¹ H-RMN (CDCl ₃) δppm: 1.19+1.28 (6H, m), 2.83 (2H, q), 3.71 (2H, s), 5.37 (2H, s), 7.39-7.45 (3H, m), 7.62+7.66 (3H, m), 8.77 (1H, s)

A88	$^1\text{H-RMN}$ (CDC13) δ ppm: 1.19–1.28 (6H, m), 2.81 (2H, q), 3.73 (2H, s), 5.39 (2H, s), 7.40–7.58 (6H, m), 8.76 (1H, s)
A-89	$^1\text{H-RMN}$ (CDC13) δ ppm: 1.23 (3H, t), 1.43 (3H, t), 3.31–3.40 (1H, m), 3.43–3.52 (1H, m), 3.61 (1H, s), 3.71 (1H, s), 5.28 (1H, s), 5.70 (1H, s), 7.44–7.61 (6H, m), 9.74 (1H, s)
A-90 ^{*1}	$^1\text{H-RMN}$ (CDC13) δ ppm: 1.13+1.29+1.37 (6H, s+s+t), 3.62+3.86 (4H, d+d), 5.17+5.39 (2H, s+s), 7.42–8.06 (6H, m), 9.29 (1H, s)

*1: una mezcla de isómeros rotacionales A y B en una proporción de aproximadamente 5:1.

Las formulaciones que contienen el compuesto de la presente invención se describirán ahora específicamente con referencia a algunos ejemplos de formulación, pero el compuesto de la presente invención, los componentes auxiliares y las cantidades de los mismos no se limitan a los de los siguientes ejemplos de formulación. A propósito, el término "parte(s)" en los siguientes ejemplos de formulación significa parte(s) en masa.

Ejemplo de formulación 1: agente de emulsión

El compuesto (10 partes) de la presente invención, xileno (60 partes), N-metil-2-pirrolidona (20 partes) y Sorpol 3005X (el nombre comercial de una mezcla de un tensioactivo no iónico y un tensioactivo aniónico disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (10 partes) se mezclaron uniformemente y disolvieron para obtener un agente de emulsión.

Ejemplo de formulación 2: Polvo dispersable en agua-1

El compuesto (20 partes) de la presente invención, Nipsil NS-K (el nombre comercial de carbón blanco disponible de Tosoh Silica Corporation) (10 partes), Kaolin Clay (el nombre comercial de caolinita disponible de Takehara Kagaku Kogyo Co., Ltd.) (60 partes), SAN X P-252 (el nombre comercial de lignina sulfonato de sodio disponible de NIPPON PAPER Chemicals Co., Ltd.) (5 partes) y Runox P-65L (el nombre comercial de sulfonato de alquilalilo disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes) se mezclaron uniformemente y se pulverizaron en un molino de aire para obtener un polvo dispersable en agua.

Ejemplo de formulación 3: Polvo dispersable en agua-2

El compuesto (20 partes) de la presente invención, Nipsil NS-K (el nombre comercial de carbón blanco disponible de Tosoh Silica Corporation) (20 partes), Kaolin Clay (50 partes), Runox 1000C (el nombre comercial de un condensado de sulfonato de naftaleno disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes) y Sorpol 5276 (el nombre comercial de un tensioactivo no iónico disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes) se mezclaron uniformemente y se pulverizaron en un molino de aire para obtener un polvo dispersable en agua.

Ejemplo de formulación 4: Agente soluble en agua-1

El compuesto (20 partes) de la presente invención, Runox P-65L (el nombre comercial de sulfonato de alquilalilo disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (3 partes) y un portador soluble en agua (cloruro de potasio) (77 partes) se mezclaron uniformemente y se pulverizaron para obtener un agente soluble en agua.

Ejemplo de formulación 5: Agente soluble en agua-2

El compuesto (50 partes) de la presente invención, Newkalgen BX-C (el nombre comercial de alquilnaftalenosulfonato de sodio fabricado por TAKEMOTO OIL & FAT Co., Ltd.) (5 partes), dióxido de silicio (2 partes) y un portador soluble en agua (43 partes) se mezclaron uniformemente y se pulverizaron para obtener un agente soluble en agua.

Ejemplo de formulación 6: Agente fluido-1

El compuesto (20 partes) de la presente invención se dispersó en una solución mixta preparada previamente mezclando propilenglicol (5 partes), Sorpol 7933 (el nombre comercial de un tensioactivo aniónico disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes) y agua (50 partes) para obtener una mezcla similar a una suspensión, luego esta mezcla similar a una suspensión se pulverizó en húmedo con DYNO-MILL (Shinmaru Enterprise Corporation) y se añadió una dispersión preparada de antemano mezclando meticulosamente goma xantana (0.2 partes) con agua (19.8 partes) para obtener un agente fluido.

Ejemplo de formulación 7: Agente fluido-2

El compuesto (20 partes) de la presente invención, Newkalgen FS-26 (el nombre comercial de una mezcla de sulfosuccinato de dioctilo y triestirilfenil éter de polioxietileno disponible de TAKEMOTO OIL & FAT Co., Ltd.) (5 partes), propilenglicol (8 partes) y agua (50 partes) se mezclaron de antemano, y esta mezcla similar a una suspensión se pulverizó en húmedo con DYNOMILL (Shinmaru Enterprise Corporation). Posteriormente, se mezcló meticulosamente goma xantana (0.2 partes) y se dispersó en agua (16.8 partes) para producir una sustancia similar a un gel y se mezcló suficientemente con la suspensión pulverizada para obtener un agente fluido.

Ejemplo de formulación 8: EW-1

El compuesto (20 partes) de la presente invención, Sorpol CA-42 (el nombre comercial de un tensioactivo no iónico disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (15 partes) y el conservante Proxel GX-L (0.1 partes) se mezclaron hasta que era uniforme y después se añadió gradualmente a lo mismo agua (59.6 partes) con agitación para obtener una dispersión. A la dispersión resultante se le añadió un agente antiespumante Antifoam E-20 (el nombre comercial de silicona modificada de tipo emulsión disponible de Kao Corporation) (0.1 partes) y se añadió a la misma goma xantana (0.2 partes) dispersada en propilenglicol (5.0 partes) para obtener una emulsión (emulsificación por inversión de fases).

Ejemplo de formulación 9: EW-2

El compuesto (10 partes) de la presente invención se disolvió en xileno (10 partes) y se mezcló con un tensioactivo Rheodol 430V (el nombre comercial del tetraoleato de polioxietilensorbitol disponible de Kao Corporation) (24 partes). La solución mixta resultante, un agente antiespumante Antifoam E-20 (el nombre comercial de un sistema de silicona modificada de tipo emulsión disponible de Kao Corporation) (0.1 partes) y un conservante Proxel GX-L (0.1 partes) se añadieron a agua (50.6 partes), seguido de dispersión con un homogeneizador. Se añadió a lo mismo goma xantana (0.2 partes) dispersada en propilenglicol (5.0 partes) para obtener una emulsión (emulsificación mecánica).

Ejemplo de formulación 10: agente ME-1

El compuesto (0.01 partes) de la presente invención y Sorpol CA-42 (el nombre comercial de un tensioactivo no iónico disponible de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) (0.1 partes) se mezclaron hasta que fueran uniformes, y se añadió entonces gradualmente a lo mismo agua (99.79 partes) con agitación. Se añadió un conservante Proxel GX-L (0.1 partes) a la dispersión resultante para obtener una microemulsión.

Ejemplo de formulación 11: agente ME-2

El compuesto (10 partes) de la presente invención y Newkalgen D-945 (el nombre comercial de monooleato de polioxietilensorbitán (20 moles) disponible en TAKEMOTO OIL & FAT Co., Ltd.) (20 partes) se mezclaron hasta que fueran uniformes, y después se añadió gradualmente a lo mismo agua (69.9 partes) con agitación. Se añadió un conservante Proxel GX-L (0.1 partes) a la dispersión resultante para obtener una microemulsión.

Ejemplo de formulación 12: agente ME-3

El compuesto (0.01 partes) de la presente invención se disolvió en un disolvente SOLVLESSO 200 (0.08 partes) y Newkalgen ST-30 (el nombre comercial de una mezcla de condensado de arilfenil éter de polioxietileno-formaldehído, un arilfenil éter de polioxialquileño, un sulfonato de alquilbenceno y xileno disponibles de TAKEMOTO OIL & FAT Co., Ltd.) (0.12 partes) hasta que fueran uniformes, y se añadió gradualmente a lo mismo agua (99.69 partes) con agitación. Se añadió un conservante Proxel GX-L (0.1 partes) a la dispersión resultante para obtener una microemulsión.

Ejemplo de formulación 13: Gránulo-1

El compuesto (5 partes) de la presente invención, bentonita (30 partes), arcilla (60 partes) y lignina sulfonato de sodio (5 partes) se mezclaron uniformemente y se pulverizaron, y se añadió agua a lo mismo, seguido de un amasado minucioso.

Luego, se realizaron granulación por extrusión, secado y dimensionamiento para obtener gránulos.

Ejemplo de formulación 14: Gránulo-2

Se puso arena de sílice (90 partes) en un granulador oscilante y se hidrató, y el compuesto (5 partes) de la presente invención, lignina sulfonato de sodio (4 partes), poli(alcohol vinílico) (PVA) (0.5 partes) y carbón blanco (0.5 partes) que se mezclaron y pulverizaron de antemano se pusieron luego en el granulador para su recubrimiento. Luego se realizó el secado y dimensionamiento para obtener gránulos.

Ejemplo de formulación 15: Gránulo-3

Se puso ishikawalita (89 partes) en un granulador oscilante y se hidrató, y el compuesto (5 partes) de la presente invención, lignina sulfonato de sodio (3 partes), dioctilsulfosuccinato de sodio (0.5 partes), estirilfenil éter de POE (2 partes) y poli(alcohol vinílico) (PVA) (0.5 partes) que se mezclaron y pulverizaron de antemano se pusieron entonces en el granulador para su recubrimiento. Luego se realizó el secado y dimensionamiento para obtener gránulos.

Ejemplo de formulación 16: Gránulo fino-1

El compuesto (2 partes) de la presente invención se diluyó con un disolvente y se mezcló con piedra pómez (98 partes) como agente de carga pulverizando la solución diluida. La composición granular resultante se secó, seguido por tamizado para obtener gránulos finos.

Ejemplo de formulación 17: Gránulo fino-2

El compuesto (5 partes) de la presente invención se molió con aire o se trituró mecanoquímicamente según fuera necesario. Este material de origen en polvo y arena de sílice (85 partes) como agente de carga se mezclaron uniformemente y luego la mezcla se mezcló con un aglutinante Toxanona GR-31A (10 partes) diluido con un disolvente mediante pulverización del aglutinante diluido. La composición granular resultante se secó, seguido por tamizado para obtener gránulos finos.

Ejemplo de formulación 18: Formulación en polvo

El compuesto (5 partes) de la presente invención se mezcló uniformemente con carbón blanco (5 partes) y arcilla (nombre comercial, Nippon Talc Co., Ltd.) (90 partes), seguido de pulverización para obtener una formulación en polvo.

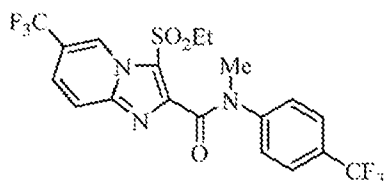
Ejemplo de formulación 19: formulación en polvo DL

El compuesto (5 partes) de la presente invención se mezcló uniformemente con propilenglicol (0.5 partes) y DL Clay (94.5 partes), seguido de pulverización para obtener una formulación en polvo.

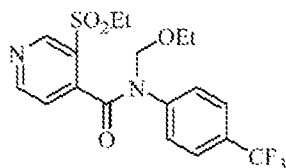
Ejemplo de formulación 20: Formulación en polvo de recubrimiento de semillas

El compuesto (10 partes) de la presente invención, lignina sulfonato de sodio (6 partes), poli(alcohol vinílico) (PVA) (1 parte) y Clay (nombre comercial, Nippon Talc Co., Ltd.) (83 partes) se mezclaron uniformemente y se pulverizaron para preparar una formulación en polvo. La formulación en polvo se mezcló con semillas prehumedecidas, seguido de secado al aire para obtener semillas recubiertas.

El efecto y la utilidad del compuesto de la presente invención se describirán con ejemplos específicos. Los compuestos de la presente invención se indican mediante los números de compuesto que se muestran en la tabla 1, y los compuestos usados como controles de comparación se indican mediante las siguientes fórmulas de compuestos.



Compuesto A



Compuesto B

Ejemplo de prueba 1: Prueba de efecto insecticida para *Plutella xylostella* de col china

Una cantidad suficiente de una solución diluida en agua de un agente de emulsión (500 ppm) preparada como en el ejemplo de formulación 1 se pulverizó con un cepillo de aire sobre las hojas de plántulas de col china plantadas en macetas elevadas durante 2 semanas después de la siembra. El agente líquido se secó al aire y entonces se

5 inocularon cinco larvas de tercer estadio de *Plutella xylostella* por maceta y se mantuvieron en una cámara termostática a 25 °C. Cinco días después de la liberación del insecto, se investigaron la vida y la muerte y la agonía de las larvas, y se determinó la tasa insecticida (%) cuando los insectos agonizantes se incluyeron en los insectos muertos. A propósito, la prueba se llevó a cabo usando una plántula en cada sala.

Tasa insecticida (%) = [número de larvas muertas]/(número de larvas de prueba)] x 100

10 Como resultado, para los presentes compuestos n.^{os} A-13, A-14, A-15, A-18, A-20, A-21, A-22, A-25, A-27, A-31, A-33, A-70, A-72, A-75, A-91, A-96, A-99 y A-102, la tasa insecticida fue del 100 %. Por el contrario, las tasas insecticidas del compuesto A y del compuesto B fueron del 90 % y del 50 %, respectivamente.

Ejemplo de prueba 2: Prueba larvicida para *Spodoptera litura* (Fabricius)

Una solución diluida en agua de un agente de emulsión (500 ppm) preparada como en el ejemplo de formulación 1 se puso en una copa de polietileno de 120 ml, y se sumergió el alimento artificial Insecta LF (Nosan Corporation, diámetro: 5 cm) cortado en rodajas de 5 mm de grosor y cortado en 1/4 en la copa de polietileno durante

15 aproximadamente 60 segundos. Después del tratamiento de inmersión, el trozo de alimento artificial resultante se puso en otra copa de polietileno de 120 ml (diámetro: 8 cm, altura: 4 cm) con papel de filtro (diámetro: 55 mm) en el fondo junto con insectos de prueba, y la copa se cubrió con una tapa y luego se mantuvo en una cámara termostática a 25 °C. Siete días después de la liberación del insecto, se investigaron la vida y la muerte y la agonía de las larvas, y se determinó la tasa insecticida (%) cuando los insectos agonizantes se incluyeron en los insectos muertos. A propósito, la prueba se llevó a cabo usando una copa en cada sala.

Tasa insecticida (%) = [número de larvas muertas]/(número de larvas de prueba)] x 100

25 Como resultado, para los presentes compuestos n.^{os} A-13, A-14, A-15, A-18, A-20, A-21, A-22, A-25, A-27, A-33, A-70, A-72, A-75, A-91, A-96, A-99 y A-102, la tasa insecticida fue del 100 %. Por el contrario, las tasas insecticidas del compuesto A y del compuesto B fueron del 90 % y del 0 %, respectivamente.

Ejemplo de prueba 3: Prueba de muerte de adultos para *Aculops lycopersici* Massee

Se colocó una tapa provista de un orificio (diámetro: aproximadamente 5 mm) en el centro sobre una copa de polietileno de 430 ml que contenía agua. Se puso sobre la tapa papel de filtro circular con un diámetro de 6,5 cm que se cortó de manera que se formó un trozo de papel de filtro en forma de tira que tenía un ancho de

30 aproximadamente 5 mm, y el trozo de papel de filtro se insertó en el orificio de la tapa de modo que la punta del trozo se extendiera hacia abajo desde el orificio y se sumergiera en el agua de la copa. Además, se puso algodón absorbente sobre el papel de filtro de manera que el agua de la taza siempre llegara al algodón absorbente. Se colocaron tres discos foliares (1 cm x 1 cm) de folíolos de tomate en la fase temprana de desarrollo de hojas verdaderas sobre el algodón absorbente de modo que el dorso de las hojas en forma de disco quedara en la parte superior, y se inocularon pequeños trozos de una hoja parasitizada por ácaros de la roya del tomate en las hojas en forma de disco. Después de 24 horas desde la inoculación, se retiraron los trozos pequeños y se colocó la copa en un cilindro acrílico de 50 cm de altura y 10 cm de diámetro. Se pulverizó una solución diluida en agua de un agente de emulsión (500 ppm) preparada como en el ejemplo de formulación 1 en una cantidad de 2.0 ml por copa usando un cepillo de aire. Después de la pulverización, la copa se mantuvo en una cámara termostática a 25 °C.

40 Tres días después del tratamiento, la tasa de control se evaluó en cuatro escalas: 100 (tasa de control: 100 %), 80 (tasa de control: del 99 % al 80 %), 50 (tasa de control: del 79 % al 50 %) y 0 (tasa de control: menos del 50 %), y se calculó la tasa de supresión de densidad de próxima generación basándose en los resultados mediante la siguiente ecuación. A propósito, la prueba se llevó a cabo usando una taza en cada sala.

45 Tasa de control = (A x 100 + B x 80 + C x 50) / (A + B + C + D)

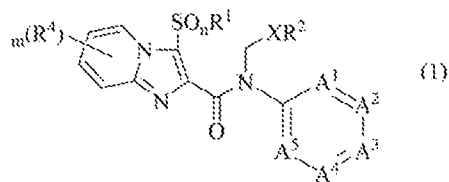
A: el número de discos para 100, B: el número de discos de 80, C: el número de discos de 50, D: el número de discos para 0.

Como resultado, para los presentes compuestos n.^{os} A-14, A-15, A-25, A-27, A-33, A-70, A-72, A-75, A-96 y A-102, la tasa de control fue del 100 %. Las tasas de control del compuesto A y del compuesto B fueron ambas del 100 %.

50

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la siguiente fórmula (1):



[en la fórmula,

5 R¹ representa un grupo alquilo C₁₋₆ o un grupo haloalquilo C₁₋₆;

R² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁₋₆ o un grupo haloalquilo C₁₋₆;

X representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o -SO₂-;

A¹, A², A³, A⁴ y A⁵ representan cada uno independientemente un átomo de nitrógeno o C-R³, en donde dos de A¹, A², A³, A⁴ y A⁵ no son átomos de nitrógeno al mismo tiempo, y al menos uno de A¹, A², A³, A⁴ y A⁵ es C-R³;

10 los R³ son iguales o diferentes entre sí, y cada R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo alquenilo C₃₋₆, un grupo alquileno C₃₋₆, un grupo haloalcoxi C₁₋₆, un grupo haloalquenilo C₃₋₆, un grupo haloalquileno C₃₋₆, un grupo alquiltio C₁₋₆, un grupo alquilsulfinilo C₁₋₆, un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo haloalquiltio C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfinilo C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo fenilo
15 opcionalmente sustituido con de uno a cuatro R⁵, un grupo fenoxi opcionalmente sustituido con de uno a cuatro R⁶, o un grupo triazolilo sustituido con uno o dos R⁷, o cuando dos R³ están sustituidos en dos átomos de carbono adyacentes, los dos R³ forman opcionalmente un anillo de 5 o 6 miembros saturado o insaturado junto con los dos átomos de carbono adyacentes a los que están unidos respectivamente los R³, y

20 R⁵, R⁶ y R⁷ representan cada uno independientemente un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo haloalcoxi C₁₋₆, un grupo alquiltio C₁₋₆, un grupo alquilsulfinilo C₁₋₆, un grupo alquilsulfonilo C₁₋₆, un grupo haloalquiltio C₁₋₆, un grupo haloalquilsulfinilo C₁₋₆ o un grupo haloalquilsulfonilo C₁₋₆;

25 los R⁴ son iguales o diferentes entre sí y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁₋₆, un grupo haloalquilo C₁₋₆, un grupo cicloalquilo C₃₋₈, un grupo alcoxi C₁₋₆, un grupo nitro o un grupo ciano;

n representa un número entero de 0 a 2; y

m representa un número entero de 0 a 4],

o su N-óxido o sal.

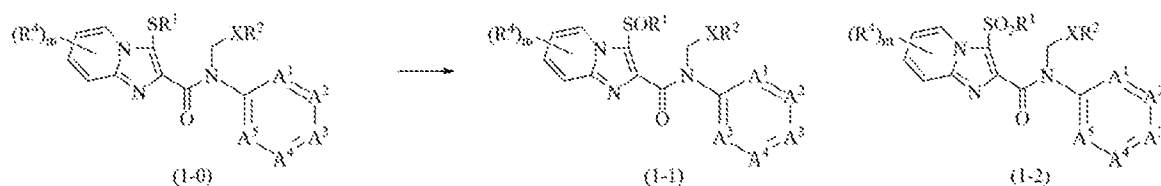
30 2. El derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según la reivindicación 1, en donde R¹ representa un grupo alquilo C₁₋₆.

3. El derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según la reivindicación 1, en donde R² representa un grupo alquilo C₁₋₆.

4. El derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde X representa un átomo de oxígeno.

35 5. El derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde X representa un átomo de azufre.

6. Un método para fabricar un derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por la siguiente fórmula (1-1) o (1-2),



comprendiendo el método oxidar un derivado de imidazopiridin-2-carboxamida representado por una fórmula (1-0), en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , X y m son como se definieron en la reivindicación 1.

- 5 7. Un agente químico agrícola y hortícola que comprende el derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.
8. Un agente de control de ácaros agrícola y hortícola que comprende el derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.
9. Un agente de control de plagas agrícola y hortícola que comprende el derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.
- 10 10. Un agente preventivo de enfermedades agrícola y hortícola que comprende el derivado de imidazopiridin-2-carboxamida o su N-óxido o sal según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5.
11. Un método para controlar organismos nocivos para plantas, que comprende una etapa de tratar organismos nocivos y/o un entorno de hábitat de los mismos y/o semillas como objetivo al que se unirán organismos nocivos y/o un material de cultivo vegetal, con el agente químico agrícola y hortícola según la reivindicación 7.
- 15 12. Un método para controlar organismos nocivos para las plantas, que comprende una etapa de tratar un lugar donde se permite que crezca o está creciendo un cultivo o un cultivo en crecimiento, con el agente químico agrícola y hortícola según la reivindicación 7.
13. Un método para preparar una composición agroquímica, que comprende una etapa de mezclar el agente químico agrícola y hortícola según la reivindicación 7, con un agente de carga y/o un tensioactivo.