

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 928 103**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A61K 31/4709 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.10.2017** **PCT/JP2017/037090**

87 Fecha y número de publicación internacional: **19.04.2018** **WO18070503**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.10.2017** **E 17860829 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.07.2022** **EP 3527567**

54 Título: **Compuesto de 1H-pirrolopiridina o N-óxido del mismo o sal del mismo, insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto, y método para usar dicho insecticida**

30 Prioridad:

13.10.2016 JP 2016201644

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

15.11.2022

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

YONEMURA, IKKI;
SHIMIZU, NAOTO;
SUWA, AKIYUKI y
FUJIE, SHUNPEI

74 Agente/Representante:

ELZABURU, S.L.P

ES 2 928 103 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuesto de 1H-pirrolopiridina o N-óxido del mismo o sal del mismo, insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto, y método para usar dicho insecticida

Campo técnico

- 5 La presente invención se refiere a un compuesto heterocíclico condensado o a una sal del mismo. Más particularmente, la presente invención se refiere a un insecticida agrícola y hortícola que comprende un compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol, tal como ciertos tipos de compuestos de 1H-pirrolopiridina, un N-óxido del mismo o una sal del mismo como ingrediente activo, y un método por usar el insecticida.

Técnica anterior

- 10 Se han examinado varios compuestos por su potencial como insecticidas agrícolas y hortícolas y, entre ellos, se han presentado ciertos tipos de compuestos heterocíclicos condensados que son útiles como insecticidas (por ejemplo, véase la literatura de patentes 1 a 9). Sin embargo, la literatura no describe ningún compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol como se reivindica en la reivindicación 1.

Lista de citas

- 15 Literatura de patentes
- Literatura de patentes 1: JP-A 2009-280574
- Literatura de patentes 2: JP-A 2010-275301
- Literatura de patentes 3: JP-A 2011-79774
- Literatura de patentes 4: JP-A 2012-131780
- 20 Literatura de patentes 5: WO 2012/086848
- Literatura de patentes 6: WO 2013/018928
- Literatura de patentes 7: WO 2014/157600
- Literatura de patentes 8: WO 2016/091731
- Literatura de patentes 9: JP-A 2009 514823

Compendio de la invención**Problema técnico**

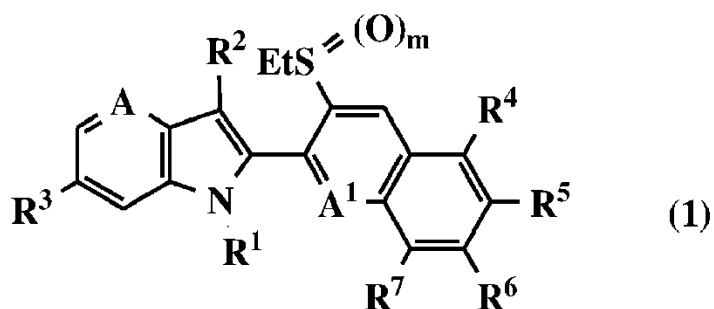
- En la producción de cultivos en los campos de la agricultura, la horticultura y similares, el daño causado por las plagas de insectos, etc., es todavía inmenso, y la aparición de plagas de insectos resistentes a los insecticidas existentes es un problema creciente. Además, la protección del medio ambiente en la tierra es un desafío global que debe abordarse
- 30 en todos los campos, incluido el campo agrícola y hortícola. Por lo tanto, se desea el desarrollo de compuestos novedosos como insecticidas agrícolas y hortícolas que tengan una carga medioambiental baja.

Solución al problema

- Los presentes inventores llevaron a cabo una amplia investigación para resolver los problemas descritos anteriormente. Como resultado, los presentes inventores encontraron que un compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol representado por la fórmula general (1), un N-óxido del mismo y una sal del mismo son altamente
- 35 eficaces para el control de plagas agrícolas y hortícolas y tienen una baja carga medioambiental. Basándose en este hallazgo, los presentes inventores completaron la presente invención.

Es decir, la presente invención incluye lo siguiente.

[1] Un compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol representado por la fórmula general (1):



{en el que

R¹ representa

- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a4) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
- (a5) un grupo alquinilo (C₂-C₆);
- (a6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alcoxycarbonilo (C₁-C₆);
- (a10) un grupo alquiltio (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a11) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a12) un grupo alquilsulfonil (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a13) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno; o
- (b2) un átomo de halógeno;

R³ representa

- (c9) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);

R⁴ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

- (d1) un átomo de hidrógeno; o
- (d2) un átomo de halógeno;

R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

- (e1) un átomo de hidrógeno;
- (e2) un átomo de halógeno;
- (e3) un grupo ciano;
- (e5) un grupo formilo;
- (e6) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (e7) un grupo alquenilo (C₂-C₆);

(e8) un grupo alquínilo (C₂-C₆);

(e9) un grupo alcoxi (C₁-C₆);

(e10) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);

5 (e11) un grupo R⁸(R⁹)N (en el que R⁸ y R⁹ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆), o un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);

(e12) un grupo R⁸(R⁹)N carbonilo (en el que R⁸ y R⁹ son como se definen anteriormente);

(e13) un grupo carboxilo;

(e14) un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);

10 (e15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);

(e16) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);

(e17) un grupo alquiltio (C₁-C₆);

(e19) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);

(e21) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);

15 (e24) un grupo arilo;

(e26) un grupo heterocíclico;

(e28) un grupo hidroxialquilo (C₁-C₆);

(e29) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);

20 (e30) CH=NOR¹¹ (en el que R¹¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alquiltio (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆), un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆), o un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);

(e31) CH=NN(R¹¹)₂ (en el que los R¹¹ pueden ser iguales o diferentes, y son como se definen anteriormente); o

(e32) N=S(O)(R¹¹)₂ (en el que los R¹¹ pueden ser iguales o diferentes, y son como se definen anteriormente),

A y A¹ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa un átomo de nitrógeno, un N-óxido y

25 m representa 0, 1 o 2}, un N-óxido del mismo o una sal del mismo.

[2] El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrólo, el N-óxido o la sal del mismo según [1] anterior, en el que R¹ representa

(a1) un átomo de hidrógeno;

(a2) un grupo alquilo (C₁-C₆);

30 (a7) un grupo alcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);

(a8) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆);

(a9) un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);

(a10) un grupo alquiltio (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);

(a11) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);

35 (a12) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);

(a13) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆); o

(a14) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno; o

(b2) un átomo de halógeno,

R³ representa (c9) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R⁴ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

5 (d1) un átomo de hidrógeno; o

(d2) un átomo de halógeno,

R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

(e1) un átomo de hidrógeno;

(e2) un átomo de halógeno;

10 (e3) un grupo ciano;

(e5) un grupo formilo;

(e6) un grupo alquilo (C₁-C₆);

(e9) un grupo alcoxi (C₁-C₆);

(e10) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);

15 (e15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o

(e26) un grupo heterocíclico.

[3] El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrollo, el N-óxido o la sal del mismo según [1] anterior, en el que

R¹ representa

(a1) un átomo de hidrógeno;

20 (a8) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆); o

(a9) un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆),

R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno; o

(b2) un átomo de halógeno,

25 R³ representa (c9) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R⁴ y R⁷ cada uno representa (d1) un átomo de hidrógeno,

R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

(e1) un átomo de hidrógeno;

(e2) un átomo de halógeno;

30 (e10) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o

(e15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

[4] Uso del compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrollo, el N-óxido o la sal del mismo según cualquiera de los puntos [1] a [3] anteriores como insecticida agrícola u hortícola.

35 [5] Un método para usar un insecticida agrícola u hortícola, que comprende tratar las plantas o el suelo con un ingrediente activo del insecticida agrícola u hortícola especificado en el [4] anterior.

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

[7] Un agente de control de ectoparásitos animales que comprende el compuesto heterocíclico condensado con 1H-

pirrolo, el N-óxido o la sal del mismo según cualquiera de los puntos [1] a [3] anteriores como ingrediente activo.

[8] Un método para controlar ectoparásitos animales, que comprende tratar ectoparásitos animales con una cantidad eficaz del agente de control de ectoparásitos animales según lo anterior [7].

Efectos y ventajas de la invención

- 5 El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrolo de la presente invención, un N-óxido del mismo y una de sus sales no solo son altamente eficaces como insecticidas agrícolas y hortícolas, sino que también son eficaces contra plagas que viven en mascotas como perros y gatos y animales domésticos. como el ganado vacuno y ovino.

Descripción de las realizaciones

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

- 15 El "grupo alquilo (C_1-C_6)" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo terc-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo terc-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2,3-dimetilpropilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo 1-metilbutilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo n-hexilo, un grupo isohexilo, un grupo 2-hexilo, un grupo 3-hexilo, un grupo 2-metilpentilo, un grupo 3-metilpentilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilo, un grupo 3,3-dimetilbutilo o similar. El "grupo alqueno (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alqueno de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo vinilo, un grupo alilo, un grupo isopropenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-1-propenilo, un grupo pentenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 3,3-dimetil-1-butenilo o similar. El "grupo alquino (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alquino de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 3-metil-1-propinilo, un grupo 2-metil-3-propinilo, un grupo pentinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 3-metil-1-butenilo, un grupo 3,3-dimetil-1-butenilo o similar.

- 25 El grupo cicloalquilo (C_3-C_6) se refiere a un grupo alquilo cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo o similares. El "grupo alcoxi (C_1-C_6)" se refiere a un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo terc-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo terc-pentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo 2,3-dimetilpropiloxi, un grupo 1-etilpropiloxi, un grupo 1-metilbutiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo isohexiloxi, un grupo 1,1,2-trimetilpropiloxi o similares. El "grupo alquenoiloxi (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alquenoiloxi de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propeniloxi, un grupo buteniloxi, un grupo penteniloxi, un grupo hexeniloxi o similares. El "grupo alquinoiloxi (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alquinoiloxi de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propiniloxi, un grupo butiniloxi, un grupo pentiniloxi, un grupo hexiniloxi o similares.

- 40 El "grupo alquiltio (C_1-C_6)" se refiere a un grupo alquiltio de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo n-butiltio, un grupo sec-butiltio, un grupo terc-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo isopentiltio, un grupo terc-pentiltio, un grupo neopentiltio, un grupo 2,3-dimetilpropiltio, un grupo 1-etilpropiltio, un grupo 1-metilbutiltio, un grupo n-hexiltio, un grupo isohexiltio, un grupo 1,1,2-trimetilpropiltio o similares. El "grupo alquilsulfonilo (C_1-C_6)" se refiere a un grupo alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo sec-butilsulfonilo, un grupo terc-butilsulfonilo, un grupo n-pentilsulfonilo, un grupo isopentilsulfonilo, un grupo terc-pentilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfonilo, un grupo 1-etilpropilsulfonilo, un grupo 1-metilbutilsulfonilo, un grupo n-hexilsulfonilo, un grupo isohexilsulfonilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo o similares. El "grupo alquilsulfonilo (C_1-C_6)" se refiere a un grupo alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo sec-butilsulfonilo, un grupo terc-butilsulfonilo, un grupo n-pentilsulfonilo, un grupo isopentilsulfonilo, un grupo terc-pentilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfonilo, un grupo 1-etilpropilsulfonilo, un grupo 1-metilbutilsulfonilo, un grupo n-hexilsulfonilo, un grupo isohexilsulfonilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo o similares.

- 55 El "grupo alquenoiltio (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alquenoiltio de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propeniltio, un grupo buteniltio, un grupo penteniltio, un grupo hexeniltio o similares. El "grupo alquinoiltio (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alquinoiltio de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propiniltio, un grupo butiniltio, un grupo pentiniltio, un grupo hexiniltio o similares.

El "grupo alquenoilsulfonilo (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alquenoilsulfonilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propenilsulfonilo, un grupo butenilsulfonilo, un grupo pentenilsulfonilo, un grupo hexenilsulfonilo o similares. El "grupo alquinoilsulfonilo (C_2-C_6)" se refiere a un grupo alquinoilsulfonilo de cadena

lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propinilsulfínico, un grupo butinilsulfínico, un grupo pentinilsulfínico, un grupo hexinilsulfínico o similares.

El "grupo alqueniilsulfonilo (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alqueniilsulfonilo de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propeniilsulfonilo, un grupo buteniilsulfonilo, un grupo penteniilsulfonilo, un grupo hexeniilsulfonilo o similares. El "grupo alquiniilsulfonilo (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alquiniilsulfonilo de cadena lineal o de cadena ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propiniilsulfonilo, un grupo butiniilsulfonilo, un grupo pentiniilsulfonilo, un grupo hexiniilsulfonilo o similares.

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

El "grupo cicloalcoxi (C₃-C₆)" se refiere a un grupo alcoxi cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropoxi, un grupo ciclobutoxi, un grupo ciclopentiloxi, un grupo ciclohexiloxi o similares. El "grupo cicloalquiltio (C₃-C₆)" se refiere a un grupo alquiltio cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropiltio, un grupo ciclobutiltio, un grupo ciclopentiltio, un grupo ciclohexiltio o similares. El "grupo cicloalquilsulfínico (C₃-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfínico cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropilsulfínico, un grupo ciclobutilsulfínico, un grupo ciclopentilsulfínico, un grupo ciclohexilsulfínico o similares. El "grupo cicloalquilsulfonilo (C₃-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfonilo cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropilsulfonilo, un grupo ciclobutilsulfonilo, un grupo ciclopentilsulfonilo, un grupo ciclohexilsulfonilo o similares.

El “grupo alquilo (C₁-C₆)”, “grupo alquenilo (C₂-C₆)”, “grupo alquinilo (C₂-C₆)”, “grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆)”, “grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆)”, “grupo cicloalquilo (C₃-C₆)”, “grupo cicloalquiloxi (C₃-C₆)”, “grupo alcoxi (C₁-C₆)”, “grupo alqueniloxi (C₂-C₆)”, “grupo alquiniloxi (C₂-C₆)”, “grupo alquilitio (C₁-C₆)”, “grupo alquilsulfínilo (C₁-C₆)”, “grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆)”, “grupo alqueniltio (C₂-C₆)”, “grupo alquiniltio (C₂-C₆)”, “grupo alquenilsulfínilo (C₂-C₆)”, “grupo alquilsulfínilo (C₂-C₆)”, “grupo alquenilsulfonilo (C₂-C₆)”, “grupo alquilsulfonilo (C₂-C₆)”, “grupo cicloalquilitio (C₃-C₆)”, “grupo cicloalquilsulfínilo (C₃-C₆)” y “grupo cicloalquilsulfonilo (C₃-C₆)” mencionado anteriormente puede estar sustituido con uno o más átomos de halógeno en una posición o posiciones sustituibles, y en el caso donde cualquiera de los grupos enumerados anteriormente esté sustituido con dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes.

Los "grupos sustituidos con uno o más átomos de halógeno" mencionados anteriormente se expresan como un "grupo haloalquilo (C₁-C₆)", un "grupo haloalquenilo (C₂-C₆)", un "grupo haloalquinilo (C₂-C₆)", un "grupo haloalquilcarbonilo (C₁-C₆)", un "grupo haloalcoxycarbonilo (C₁-C₆)", un "grupo halocicloalquilo (C₃-C₆)", un "grupo halocicloalquiloxi (C₃-C₆)", un "grupo haloalcoxi (C₁-C₆)", un "grupo haloalqueniloxi (C₂-C₆)", un "grupo haloalquiniloxi (C₂-C₆)", un "grupo haloalquilitio (C₁-C₆)", un "grupo haloalquilsulfinito (C₁-C₆)", un "grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆)", un "grupo haloalquenilitio (C₂-C₆)", un "grupo haloalquinilitio (C₂-C₆)", un "grupo haloalquenilsulfinito (C₂-C₆)", un "grupo haloalquilsulfonilo (C₂-C₆)", un "grupo haloalquilcarbonilsulfinito (C₂-C₆)", un "grupo haloalquilcarbonilsulfonilo (C₂-C₆)", un "grupo halocicloalquilquilitio (C₃-C₆)", un "grupo halocicloalquilsulfinito (C₃-C₆)" y un grupo halocicloalquilsulfonilo (C₃-C₆)".

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

El "grupo de anillo alifático de 3 a 6 miembros" que R⁵ y R⁶ unidos al mismo átomo de carbono se unen entre sí para formar se ejemplifica por un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo. El "grupo de anillo aromático o grupo de anillo heterocíclico aromático" que R³ y R⁴ se combinan para formar se ejemplifica por un grupo quinolilo o naftilo que tiene un anillo fenilo formado por R³ y R⁴.

El "grupo arilo" se refiere a un grupo hidrocarbonado aromático de 6 a 10 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, un grupo 2-naftilo o similares. El grupo arilo es particularmente preferiblemente un grupo fenilo.

El "grupo heterocíclico" y el "anillo heterocíclico" se refieren a un grupo monocíclico aromático de 5 o 6 miembros o un grupo heterocíclico no aromático monocíclico de 4 a 6 miembros que contiene, como átomos del anillo, uno o más

átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno; y también se refieren a un grupo heterocíclico aromático condensado formado por la condensación de dicho heterociclo aromático monocíclico con un anillo de benceno o a un grupo heterocíclico aromático condensado formado por la condensación de dicho heterociclo aromático monocíclico con un anillo aromático monocíclico, por ejemplo, un anillo de benceno.

Los ejemplos del "grupo heterocíclico aromático" incluyen grupos heterocíclicos aromáticos monocíclicos tales como un grupo furilo, un grupo tienilo, un grupo piridilo, un grupo pirimidinilo, un grupo piridazinilo, un grupo pirazinilo, un grupo pirrolilo, un grupo imidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo triazolilo, un grupo tetrazolilo y un grupo triazinilo; y grupos heterocíclicos aromáticos condensados tales como un grupo quinolilo, un grupo isoquinolilo, un grupo quinazolilo, un grupo quinoxalilo, un grupo benzofuranilo, un grupo benzotienilo, un grupo benzoxazolilo, un grupo bencisoxazolilo, un grupo benzotiazolilo, un grupo bencimidazolilo, un grupo benzotriazolilo, un grupo indolilo, un grupo indazolilo, un grupo pirrolopirazinilo, un grupo imidazopiridinilo, un grupo imidazopirazinilo, un grupo pirazolopiridinilo, un grupo pirazolotienilo y un grupo pirazolotriazinilo.

Los ejemplos del "grupo heterocíclico no aromático" incluyen grupos heterocíclicos no aromáticos monocíclicos tales como un grupo oxetanilo, un grupo tietanilo, un grupo azetidilo, un grupo pirrolidinilo, un grupo pirrolidinil-2-ona, un grupo piperidinilo, un grupo morfolinilo, un grupo tiomorfolinilo, un grupo piperazinilo, un grupo hexametiliminilo, un grupo imidazolidinilo, un grupo tiazolidinilo, un grupo imidazolidinilo, un grupo oxazolinilo, un grupo tiazolinilo, un grupo isoxazolinilo, un grupo imidazolinilo, un grupo dioxolilo, un grupo dioxolanilo, un grupo dihidrooxadiazolilo, un grupo 2-oxo-pirrolidin-1-ilo, un grupo 2-oxo-1,3-oxazolidin-5-ilo, un grupo 5-oxo-1,2,4-oxadiazolin-3-ilo, un grupo 1,3-dioxolan-2-ilo, un grupo 1,3-dioxan-2-ilo, un grupo 1,3-dioxepan-2-ilo, un grupo piranilo, un grupo tetrahidropiranilo, un grupo tiopiranilo, un grupo tetrahidrotiopiranilo, un grupo 1-óxido tetrahidrotiopiranilo, un grupo 1,1-dióxido tetrahidrotiopiranilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo dioxanilo, un grupo pirazolidinilo, un grupo pirazolinilo, un grupo tetrahidropirimidinilo, un grupo dihidrotriazolilo y un grupo tetrahidrotriazolilo.

Los ejemplos preferibles del "grupo heterocíclico" incluyen un grupo isoxazolilo, un grupo pirimidinilo, un grupo pirazinilo, un grupo piridilo, un grupo pirazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo tienilo, un grupo pirrolilo, un grupo bencimidazolilo, un grupo benzofuranilo, un grupo benzotienilo y un grupo pirrolidinil-2-ona.

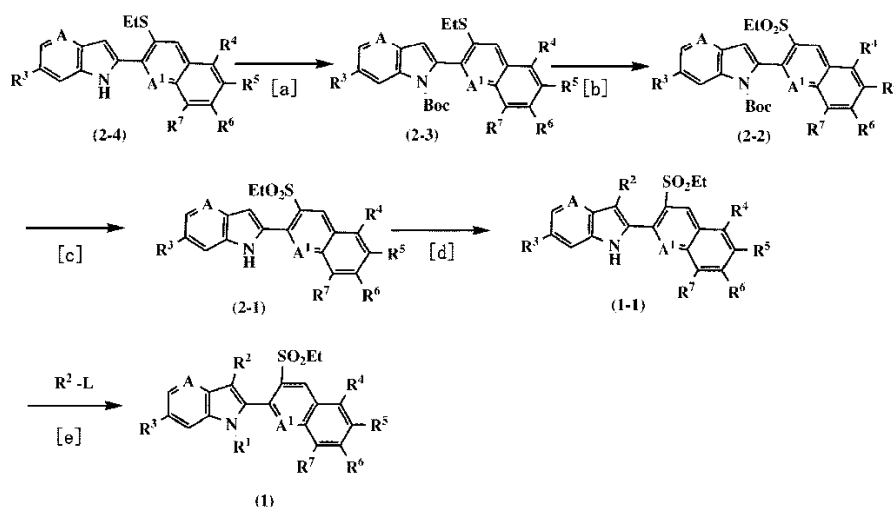
Los ejemplos de la sal del compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol representado por la fórmula general (1) de la presente invención o un N-óxido del mismo incluyen sales de ácidos inorgánicos, tales como clorhidratos, sulfatos, nitratos y fosfatos; sales de ácidos orgánicos, tales como acetatos, fumaratos, maleatos, oxalatos, metanosulfonatos, bencenosulfonatos y p-toluensulfonatos; y sales con una base inorgánica u orgánica tales como un ion de sodio, un ion de potasio, un ion de calcio y un ion de trimetilamonio.

El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol representado por la fórmula general (1) de la presente invención, un N-óxido del mismo y una sal del mismo pueden tener uno o más centros quirales en la fórmula estructural, y pueden existir como dos o más tipos de isómeros ópticos o diastereómeros. Todos los isómeros ópticos y las mezclas de los isómeros en cualquier proporción también están incluidos en la presente invención. Además, el compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención, un N-óxido del mismo y una sal del mismo pueden existir como dos tipos de isómeros geométricos debido a un doble enlace carbono-carbono o un doble enlace carbono-nitrógeno en la fórmula estructural. Todos los isómeros geométricos y las mezclas de los isómeros en cualquier proporción también están incluidos en la presente invención.

El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol de la presente invención, un N-óxido del mismo o una sal del mismo se puede producir según una combinación de métodos conocidos o métodos conocidos per se, por ejemplo, el método de producción descrito a continuación, que es un ejemplo no limitante. También se puede usar otra u otras reacciones bien establecidas según se requiera.

Método de producción 1

[Quím. 2]



En la fórmula, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, A y A¹ son como se definen anteriormente, Boc representa un grupo t-butoxicarbonilo y L representa un grupo saliente. El grupo saliente representado por L es, por ejemplo, un átomo de halógeno o similar.

5 Método de producción en [Etapa a]

El compuesto representado por la fórmula general (2-3) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2-4), que se produce según el método de producción intermedia 1 posterior o el método de producción descrito en el documento WO 2014/157600, según el método descrito en Greene's Protective Groups in Organic Synthesis (John Wiley & Sons Inc.).

10 Método de producción en [Etapa b]

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

Los ejemplos del agente oxidante usado en esta etapa incluyen peróxidos tales como una solución de peróxido de hidrógeno, ácido perbenzoico y ácido m-cloroperoxibenzoico. La cantidad del agente oxidante usado se selecciona según sea apropiado del intervalo de una cantidad molar de 2 a 5 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (2-3).

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba marcadamente la reacción, y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno y cloroformo; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico y ácido acético; y disolventes polares como el agua. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, y también se pueden usar dos o más de ellos como una mezcla.

La temperatura de reacción en esta reacción se selecciona apropiadamente del intervalo de -10°C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares y no es el mismo en todos los casos, sino que básicamente se selecciona según sea apropiado en el intervalo de unos pocos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el óxido resultante se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en [Etapa c]

El compuesto representado por la fórmula general (2-1) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2-2) según el método descrito en Greene's Protective Groups in Organic Synthesis (John Wiley & Sons Inc.).

Método de producción en [Etapa d]

El compuesto representado por la fórmula general (1-1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (2-1) con un agente halogenante en un disolvente inactivo.

Los ejemplos del agente halogenante (cloración, bromación o yodación) usado en esta etapa incluyen moléculas de halógeno tales como moléculas de cloro, bromo o yodo; agentes halogenantes tales como cloruro de tionilo, cloruro de sulfurilo y tribromuro de fósforo; succinimidas tales como N-clorosuccinimida (NCS), N-bromosuccinimida (NBS) y

N-yodosuccinimida (NIS); y hidantoínas tales como 1,3-dibromo-5,5-dimetilhidantoína (DBH) y 1,3-diiodo-5,5-dimetilhidantoína (DIH). La cantidad del agente halogenante usado se selecciona apropiadamente del intervalo de una cantidad molar de 1 a 5 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (2-1).

5 El disolvente inerte utilizado en la halogenación (cloración, bromación o yodación) puede ser cualquier disolvente que no inhiba marcadamente la reacción, y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno y cloroformo; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico y ácido acético; y disolventes polares tales como agua. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, y también se pueden usar dos o más de ellos como una mezcla.

10 La temperatura para la halogenación se selecciona apropiadamente del intervalo de -10°C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares y no es el mismo en todos los casos, sino que básicamente se selecciona según sea apropiado en el intervalo de unos pocos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el óxido resultante se aísla de la mezcla posterior a la reacción por el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en el [Etapa e]

El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirroló representado por la fórmula general (1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1-1) con R²-L en presencia de una base en un disolvente inerte.

20 El disolvente orgánico utilizado en esta reacción puede ser cualquier disolvente orgánico inerte para la reacción. Los ejemplos del disolvente orgánico incluyen disolventes de éter tales como dioxano, 1,2-dimetoxietano y tetrahidrofurano; disolventes de hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, benceno y xileno; disolventes de amida tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida y N-metilpirrolidona; y un disolvente mixto de dos o más tipos de ellos.

25 Los ejemplos de la base que se pueden usar incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, hidróxido de bario, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de cesio y fosfato de potasio; alcóxidos tales como t-butoxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; y aminas tales como trietilamina, piridina y piperidina. La cantidad de base utilizada es normalmente de 1 a 10 equivalentes molares con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (1-1).

Dado que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, el compuesto representado por la fórmula general (1-1) y R²-L se utilizan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos puede utilizarse en una cantidad en exceso.

35 La temperatura de reacción suele estar en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción suele ser de unos pocos minutos a decenas de horas. La reacción se realiza preferiblemente bajo la atmósfera de un gas inerte. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

40 En el caso en que el compuesto de interés sea el compuesto de fórmula general (1-1) en la que R¹ es un grupo alquilo, el compuesto de fórmula general (1-1) en el que R¹ es un átomo de yodo, un átomo de bromo o un átomo de cloro está sujeto a lo que se llama el acoplamiento de Negishi (Aldrichimica Acta 2005, 38, 71) para producir el compuesto de interés. En el caso en que el compuesto de interés sea el compuesto de fórmula general (1-1) en la que R¹ es un grupo alcóxicarbonilo o un grupo alquilcarbonilo, el compuesto de fórmula general (1-1) en el que R¹ es un átomo de yodo, un átomo de bromo o un átomo de cloro se somete a lo que se llama la reacción de Mizoroki-Heck (Modern Arylation Methods, Wiley-VCH) para producir el compuesto de interés.

En el caso en que el compuesto de interés sea el compuesto de fórmula general (1-1) en la que R¹ es un átomo de flúor, el compuesto de fórmula general (1-1) producido en la etapa d en el que R¹ es un átomo de yodo, un átomo de bromo o un átomo de cloro se hace reaccionar con un agente de fluoración en presencia de una base en un disolvente inerte para producir el compuesto de interés.

50 Los ejemplos del agente de fluoración que se puede usar en esta reacción incluyen bis(tetrafluoroborato) de N-fluoro-N'-(clorometil)trietilendiamina, Selectfluor, (PhSO₂)₂NF y triflato de N-fluoropiridinio. El preferido es Selectfluor. La cantidad de agente de fluoración utilizada suele ser de 1 a 5 equivalentes molares con respecto a 1 mol del compuesto de fórmula general (1-1) en la que R¹ es un átomo de yodo, un átomo de bromo o un átomo de cloro.

55 Ejemplos de la base que puede usarse en la fluoración incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, hidróxido de bario, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio y carbonato de cesio; y aminas tales como trietilamina,

piridina y piperidina. La cantidad de base utilizada es normalmente de 1 a 10 equivalentes molares con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula general (1-1).

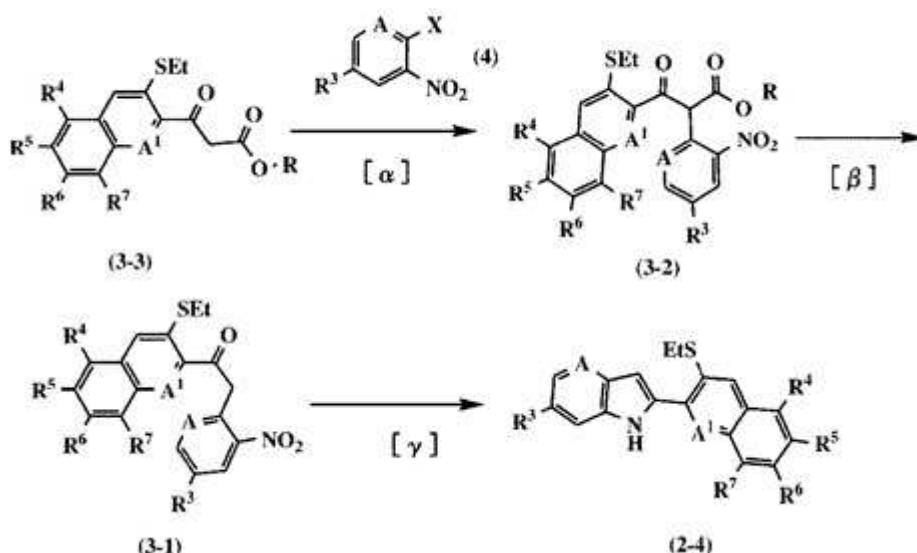
El disolvente orgánico utilizado en la fluoración no está particularmente limitado y puede ser cualquier disolvente orgánico inerte para la reacción. Los ejemplos del disolvente orgánico incluyen disolventes de nitrilo tales como acetonitrilo y benzonitrilo; agua; y un disolvente mixto de dos o más tipos de ellos.

La temperatura de reacción en esta reacción normalmente está en el intervalo de -20°C al punto de ebullición del disolvente usado. El tiempo de reacción suele ser de unos pocos minutos a decenas de horas. Una vez completada la reacción, la mezcla posterior a la reacción que contiene el compuesto de interés se trata con un agente reductor tal como tiosulfato de sodio, y luego el compuesto de interés se aísla de la misma mediante el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés.

El compuesto de fórmula general (1-1) en el que R¹ es un grupo alquilo, un átomo de flúor, un grupo alcóxicarbonilo o un grupo alquilcarbonilo se puede convertir en el compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrólo correspondiente representado por la fórmula general (1) según el método de producción en el [Etapa e].

Método de producción intermedio

[Quím. 3]



En la fórmula, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, A y A¹ son como se definen anteriormente, X representa un átomo de halógeno y R representa un grupo alquilo terciario tal como un grupo t-butilo y un grupo 1-fenil-2-metilpropil-2-ilo.

Método de producción en [Etapa α]

El compuesto β-cetoéster representado por la fórmula general (3-3) producido por condensación de Claisen (Org. React. 1942, 1, 266) de un éster de ácido carboxílico aromático y un éster de ácido acético y el intercambio de éster se hace reaccionar con el compuesto nitro halogenado representado por la fórmula general (4) en presencia de una base en un disolvente inerte para producir el compuesto representado por la fórmula general (3-2).

El disolvente orgánico usado no está particularmente limitado y puede ser cualquier disolvente orgánico inerte para la reacción. Los ejemplos del disolvente orgánico incluyen disolventes de éter tales como dioxano, 1,2-dimetoxietano y tetrahidrofurano; disolventes de hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, benceno y xileno; disolventes de amida tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida y N-metilpirrolidona; y un disolvente mixto de dos o más tipos de ellos.

Los ejemplos de la base que se puede usar incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, hidróxido de bario, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de cesio y fosfato de potasio; alcóxidos tales como t-butoxido de potasio, metóxido de sodio y etóxido de sodio; hidruros de metales alcalinos tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; y aminas tales como trietilamina, piridina y piperidina. La cantidad de base utilizada es normalmente de 1 a 10 equivalentes molares con respecto a 1 mol de compuesto (3-3).

Dado que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, el compuesto (3-3) y el compuesto (4) se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos puede usarse en una cantidad en exceso.

La temperatura de reacción suele estar en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente utilizado. El tiempo de reacción suele ser de unos pocos minutos a decenas de horas. La reacción se realiza preferiblemente bajo la atmósfera de un gas inerte. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear

5

Método de producción en [Etapa β]

El compuesto representado por la fórmula general (3-1) se puede producir tratando el compuesto representado por la fórmula general (3-2) con un ácido en presencia o ausencia de un disolvente.

10

Los ejemplos del ácido usado en esta reacción incluyen ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; y ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico y ácido trifluorometanosulfónico. La cantidad del ácido usado se selecciona apropiadamente del intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces con respecto al compuesto de éster representado por la fórmula general (3-2). En algunos casos, el ácido también se puede usar como disolvente para esta reacción.

15

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción, y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno y diclorobenceno; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; y disolventes polares tales como 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, y también se puede usar dos o más de ellos como una mezcla. En el caso en que el ácido se utilice también como disolvente, no es necesario utilizar otro disolvente.

20

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

25

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

Método de producción en [Etapa γ]

30

La reacción en esta etapa es la reducción y deshidratación del compuesto nitro representado por la fórmula general (3-1) para producir el compuesto 1H-pirrolopiridina representado por la fórmula general (2-4).

Para la reducción, pueden usarse las condiciones para la reducción de grupos nitro descritas en la literatura conocida (ver "New Lecture of Experimental Chemistry (Shin Jikken Kagaku Kouza)", vol. 15, Oxidation and Reduction II, 1977, editado por la Sociedad Química de Japón, publicado por Maruzen).

35

Los ejemplos del disolvente inerte que se puede usar en esta reacción incluyen alcoholes tales como metanol y etanol; éteres tales como tetrahidrofurano y dioxano; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico y ácido acético; y agua. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, y también se pueden usar dos o más de ellos como una mezcla. Una solución acuosa de un ácido usado como agente reductor en esta reacción puede usarse también como disolvente inerte para la reacción.

40

Los ejemplos del agente reductor que se puede usar en esta reacción incluyen ácido metálico y sal metálica. Los ejemplos del metal incluyen hierro, estaño y zinc, los ejemplos del ácido incluyen ácidos inorgánicos como el ácido clorhídrico y el ácido sulfúrico y ácidos orgánicos como el ácido acético, y los ejemplos de la sal incluyen cloruro de estaño y cloruro de amonio. Además, el metal puede ser una combinación de dos o más de estos ejemplos, y lo mismo se aplica al ácido ya la sal. En cuanto a la cantidad del agente reductor utilizado, la cantidad del metal se selecciona apropiadamente del intervalo de una cantidad molar de aproximadamente 1 a 10 veces en relación con el compuesto

45

nitro representado por la fórmula general (3-1), y la cantidad del ácido o la sal se selecciona apropiadamente del intervalo de aproximadamente 0,05 a 10 veces la cantidad molar con respecto al compuesto nitro representado por la fórmula general (3-1). La temperatura de reacción se puede seleccionar del intervalo de aproximadamente 0 a 150°C. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares, pero básicamente se selecciona según sea apropiado del intervalo de unos pocos minutos a aproximadamente 48 horas. La reducción en esta etapa también se puede realizar por hidrogenación catalítica en presencia de un catalizador. Los ejemplos del catalizador incluyen paladio sobre carbono. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante el método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, destilación, cromatografía en columna, etc. para la purificación del compuesto de interés. El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol representado por la fórmula general (2-4) producido según el esquema de producción

50

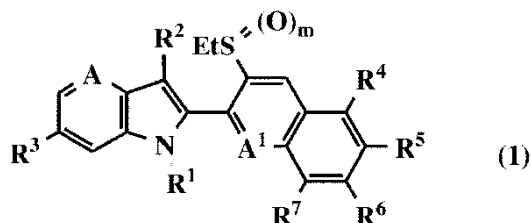
55

descrito anteriormente se somete a las reacciones en el método de producción 1 para producir el compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol representado por la fórmula general (1). El compuesto intermedio también se puede producir según el método de producción descrito en el documento WO 2014/157600.

A continuación se muestran ejemplos específicos del compuesto de la presente invención. En las siguientes tablas, Me representa un grupo metilo, Et representa un grupo etilo, n-Pr representa un grupo n-propilo, i-Pr representa un grupo isopropilo, c-Pr representa un grupo ciclopropilo y t-Bu representa un grupo terc-butilo. Ph representa un grupo fenilo, Dioxolan representa un grupo dioxolanilo y Triazol representa un grupo triazolilo. Ac representa un grupo acetilo.

5 En la columna de "Propiedad física" se muestra un punto de fusión (°C).

[Quím. 4]



[Tabla 1]

Tabla 1

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-1	H	F	CF ₃	H	H	H	H	2	
1-2	H	F	CF ₃	Cl	H	H	H	2	
1-3	H	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	132-135
1-4	H	F	CF ₃	H	H	Cl	H	2	
1-5	H	F	CF ₃	H	H	H	Cl	2	
1-6	H	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	199-200
1-7	H	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	120-121
1-8	H	F	CF ₃	H	c-Pr	H	H	2	104-105
1-9	H	F	CF ₃	H	H	c-Pr	H	2	
1-10	H	F	CF ₃	H	CF ₃	H	H	2	
1-11	H	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	120-121
1-12	H	F	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	H	H	2	
1-13	H	F	CF ₃	H	H	NHCO ₂ Et	H	2	190-191
1-14	H	F	CF ₃	H	NHCOMe	H	H	2	
1-15	H	F	CF ₃	H	H	NHCOMe	H	2	
1-16	H	F	CF ₃	H	CO ₂ H	H	H	2	
1-17	H	F	CF ₃	H	H	CO ₂ H	H	2	
1-18	H	F	CF ₃	H	CO ₂ Et	H	H	2	
1-19	H	F	CF ₃	H	H	CO ₂ Et	H	2	
1-20	H	F	CF ₃	H	CONHMe	H	H	2	
1-21	H	F	CF ₃	H	H	CONHMe	H	2	
1-22	H	F	CF ₃	H	CONH ₂	H	H	2	

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-23	H	F	CF ₃	H	H	CONH ₂	H	2	
1-24	H	F	CF ₃	H	CN	H	H	2	
1-25	H	F	CF ₃	H	H	CN	H	2	
1-26	H	F	CF ₃	H	Ac	H	H	2	
1-27	H	F	CF ₃	H	H	Ac	H	2	
1-28	H	F	CF ₃	H	CHO	H	H	2	

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Tabla 2]

Tabla 2

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-29	H	F	CF ₃	H	H	CHO	H	2	
1-30	H	F	CF ₃	H	CH=CH ₂	H	H	2	
1-31	H	F	CF ₃	H	H	CH=CH ₂	H	2	
1-32	H	F	CF ₃	H	C≡CH	H	H	2	
1-33	H	F	CF ₃	H	H	C≡CH	H	2	
1-34	H	F	CF ₃	H	OE _t	H	H	2	
1-35	H	F	CF ₃	H	H	OE _t	H	2	
1-36	H	F	CF ₃	H	OE _t	H	H	2	
1-37	H	F	CF ₃	H	H	OE _t	H	2	
1-38	H	F	CF ₃	H	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	H	2	
1-39	H	F	CF ₃	H	H	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	2	
1-40	H	F	CF ₃	H	1,3-Dioxolan-2-ilo	H	H	2	
1-41	H	F	CF ₃	H	H	1,3-Dioxolan-2-ilo	H	2	
1-42	H	Cl	CF ₃	H	H	H	H	2	
1-43	H	Cl	CF ₃	Cl	H	H	H	2	
1-44	H	Cl	CF ₃	H	Cl	H	H	2	262-263
1-45	H	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	2	
1-46	H	Cl	CF ₃	H	H	H	Cl	2	
1-47	H	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	166-167
1-48	H	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	119-120

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-49	H	Cl	CF ₃	H	c-Pr	H	H	2	191-192
1-50	H	Cl	CF ₃	H	H	c-Pr	H	2	88-89
1-51	H	Cl	CF ₃	H	CF ₃	H	H	2	
1-52	H	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	155-156
1-53	H	Cl	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	H	H	2	
1-54	H	Cl	CF ₃	H	H	NHCO ₂ Et	H	2	
1-55	H	Cl	CF ₃	H	NHCOMe	H	H	2	
1-56	H	Cl	CF ₃	H	H	NHCOMe	H	2	

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Tabla 3]

Tabla 3

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-57	H	Cl	CF ₃	H	CO ₂ H	H	H	2	
1-58	H	Cl	CF ₃	H	H	CO ₂ H	H	2	
1-59	H	Cl	CF ₃	H	CO ₂ Et	H	H	2	
1-60	H	Cl	CF ₃	H	H	CO ₂ Et	H	2	
1-61	H	Cl	CF ₃	H	CONHMe	H	H	2	
1-62	H	Cl	CF ₃	H	H	CONHMe	H	2	
1-63	H	Cl	CF ₃	H	CONH ₂	H	H	2	
1-64	H	Cl	CF ₃	H	H	CONH ₂	H	2	
1-65	H	Cl	CF ₃	H	CN	H	H	2	
1-66	H	Cl	CF ₃	H	H	CN	H	2	
1-67	H	Cl	CF ₃	H	Ac	H	H	2	
1-68	H	Cl	CF ₃	H	H	Ac	H	2	
1-69	H	Cl	CF ₃	H	CHO	H	H	2	
1-70	H	Cl	CF ₃	H	H	CHO	H	2	
1-71	H	Cl	CF ₃	H	CH=CH ₂	H	H	2	
1-72	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=CH ₂	H	2	
1-73	H	Cl	CF ₃	H	C≡CH	H	H	2	
1-74	H	Cl	CF ₃	H	H	C≡CH	H	2	
1-75	H	Cl	CF ₃	H	OEt	H	H	2	

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-76	H	Cl	CF ₃	H	H	OE _t	H	2	
1-77	H	Cl	CF ₃	H	OE _t	H	H	2	
1-78	H	Cl	CF ₃	H	H	OE _t	H	2	
1-79	H	Cl	CF ₃	H	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	H	2	
1-80	H	Cl	CF ₃	H	H	1,2,4-Triazol-1-ilo	H	2	
1-81	H	Cl	CF ₃	H	1,3-Dioxolan-2-ilo	H	H	2	
1-82	H	Cl	CF ₃	H	H	1,3-Dioxolan-2-ilo	H	2	

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Tabla 4]

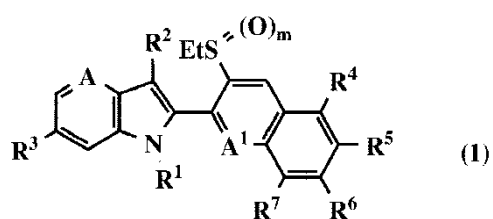
Tabla 4

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-83	H	Cl	CF ₃	H	Me	H	H	2	
1-84	H	Cl	CF ₃	H	NH ₂	H	H	2	
1-85	H	Cl	CF ₃	H	NHCH ₂ CF ₃	H	H	2	
1-86	H	Cl	CF ₃	H	CH=NOH	H	H	2	
1-87	H	Cl	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	H	2	
1-88	H	Cl	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₂ H	H	H	2	
1-89	H	Cl	CF ₃	H	CH=NOi-Pr	H	H	2	
1-90	H	Cl	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ SMe	H	H	2	
1-91	H	Cl	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ SOMe	H	H	2	
1-92	H	Cl	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ SO ₂ Me	H	H	2	
1-93	H	Cl	CF ₃	H	CH=NNHCH ₂ CF ₃	H	H	2	
1-94	H	Cl	CF ₃	H	N=S(O)Me ₂	H	H	2	
1-95	H	Cl	CF ₃	H	SMe	H	H	2	
1-96	H	Cl	CF ₃	H	SOMe	H	H	2	
1-97	H	Cl	CF ₃	H	SO ₂ Me	H	H	2	
1-98	H	Cl	CF ₃	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	H	2	
1-99	H	Cl	CF ₃	H	CH ₂ OH	H	H	2	
1-100	H	Cl	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	H	H	2	
1-101	H	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	2	
1-102	H	Cl	CF ₃	H	H	NH ₂	H	2	

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
1-103	H	Cl	CF ₃	H	H	NHCH ₂ CF ₃	H	2	
1-104	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOH	H	2	
1-105	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	2	113-114
1-106	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ CF ₂ H	H	2	
1-107	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOi-Pr	H	2	
1-108	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ SMe	H	2	
1-109	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ SOMe	H	2	
1-110	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ SO ₂ Me	H	2	
1-111	H	Cl	CF ₃	H	H	CH=NNHCH ₂ CF ₃	H	2	
1-112	H	Cl	CF ₃	H	H	N=S(O)Me ₂	H	2	
1-113	H	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	2	
1-114	H	Cl	CF ₃	H	H	SOMe	H	2	
1-115	H	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	2	
1-116	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	2	
1-117	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ OH	H	2	
1-118	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	2	

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Quím. 5]



5 [Tabla 5]

Tabla 5

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-1	Ac	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	100-103
2-2	CO ₂ Me	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-3	SO ₂ Me	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-4	Me	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-5	Et	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-6	CH ₂ OMe	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-7	CH ₂ OEt	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-8	CH ₂ SMe	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-9	CH ₂ S(O)Me	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-10	CH ₂ S(O) ₂ Me	F	CF ₃	H	Cl	H	H	2	
2-11	Ac	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	77-78
2-12	CO ₂ Me	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-13	SO ₂ Me	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-14	Me	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-15	Et	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-16	CH ₂ OMe	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-17	CH ₂ OEt	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-18	CH ₂ SMe	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-19	CH ₂ S(O)Me	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-20	CH ₂ S(O) ₂ Me	F	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-21	Ac	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	215-216
2-22	CO ₂ Me	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-23	SO ₂ Me	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-24	Me	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-25	Et	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Tabla 6]

Tabla 6

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-26	CH ₂ OMe	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-27	CH ₂ OEt	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-28	CH ₂ SMe	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-29	CH ₂ S(O)Me	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-30	CH ₂ S(O) ₂ Me	F	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	
2-31	Ac	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	88-89
2-32	CO ₂ Me	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	93-94
2-33	SO ₂ Me	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-34	Me	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-35	Et	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-36	CH ₂ OMe	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-37	CH ₂ OEt	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-38	CH ₂ SMe	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-39	CH ₂ S(O)Me	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-40	CH ₂ S(O) ₂ Me	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-41	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	Cl	H	H	0	95-97
2-42	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	Cl	H	H	2	128-130
2-43	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	0	94-95
2-44	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	109-110
2-45	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	Br	H	H	0	119-120
2-46	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	Br	H	H	2	111-112
2-47	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	c-Pr	H	H	2	123-124

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Tabla 7]

Tabla 7

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-48	CO ₂ -t-Bu	F	CF ₃	H	H	Br	H	2	90-91
2-49	CO ₂ -t-Bu	F	CF ₃	H	H	NHCO ₂ Et	H	2	RMN
2-50	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	H	Br	H	1	115-116
2-51	Ac	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-52	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-53	CO ₂ Me	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-54	SO ₂ Me	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-55	Me	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-56	CH ₂ OMe	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-57	CH ₂ SMe	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-58	CH ₂ S(O)Me	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-59	CH ₂ S(O) ₂ Me	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	2	
2-60	Ac	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	256-257
2-61	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	142-143
2-62	CO ₂ Me	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	241-242

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-63	SO ₂ Me	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	114-115
2-64	Me	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-65	CH ₂ OMe	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	167-168
2-66	CH ₂ SMe	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-67	CH ₂ S(O)Me	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-68	CH ₂ S(O) ₂ Me	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-69	Ac	Cl	CF ₃	H	H	NHCO ₂ Et	H	2	
2-70	CH ₂ OMe	Cl	CF ₃	H	H	NHCO ₂ Et	H	2	
2-71	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	c-Pr	H	2	62-63
2-72	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	Me	H	2	
2-73	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	NH ₂	H	2	
2-74	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	NHCH ₂ CF ₃	H	2	
2-75	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOH	H	2	

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Tabla 8]

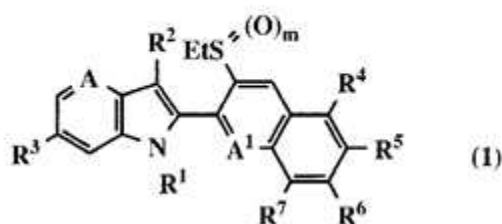
Tabla 8

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-76	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	2	109-110
2-77	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ CF ₂ H	H	2	
2-78	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOi-Pr	H	2	
2-79	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ SMe	H	2	
2-80	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ SOMe	H	2	
2-81	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NOCH ₂ SO ₂ Me	H	2	
2-82	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=NNHCH ₂ CF ₃	H	2	
2-83	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	N=S(O)Me ₂	H	2	
2-84	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	SMe	H	2	
2-85	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	SOMe	H	2	
2-86	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	2	
2-87	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	2	
2-88	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ OH	H	2	
2-89	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃	H	2	
2-90	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	NHCOMe	H	2	203-204

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
2-91	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CO ₂ H	H	2	
2-92	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CO ₂ Et	H	2	
2-93	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CONHMe	H	2	
2-94	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CONH ₂	H	2	
2-95	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CN	H	2	
2-96	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	Ac	H	2	
2-97	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CHO	H	2	173-174
2-98	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	CH=CH ₂	H	2	107-108
2-99	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	C≡CH	H	2	
2-100	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	OEt	H	2	
2-101	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	1,2,4-triazol-1-ilo	H	2	
2-102	CO ₂ -t-Bu	Cl	CF ₃	H	H	2,5-dioxolano-1-ilo	H	2	
2-103	CH ₂ CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-104	CH ₂ CHF ₂	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	74-75
2-105	CH ₂ -c-Pr	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	116-117
2-106	CH ₂ C≡CH	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	
2-107	CH ₂ CH=CH	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	2	

A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Quím. 6]



[Tabla 9]

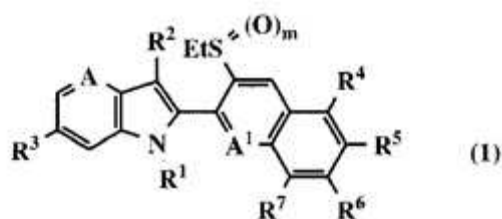
5

Tabla 9

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
3-1	CO ₂ -t-Bu	H	CF ₃	H	Cl	H	H	2	281-283
3-2	H	Cl	CF ₃	H	Cl	H	H	2	240-242

A representa un N-óxido, y A¹ representa un átomo de nitrógeno.

[Quím. 7]



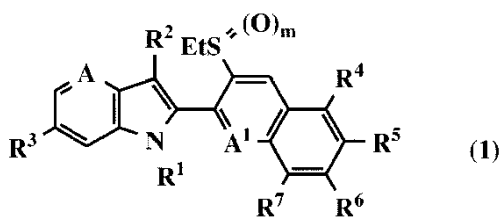
[Tabla 10]

Tabla 10

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
4-1	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	1	216-218
4-2	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	2	216-219
4-3	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	0	221-222 sal de CF ₃ CO ₂ H
4-4	H	H	CF ₃	H	H	Br	H	0	183-186
4-5	H	H	CF ₃	H	H	Br	H	0	129-130
4-6	H	H	CF ₃	H	H	CF ₃	H	2	107-108
4-7	H	H	CF ₃	H	c-Pr	H	H	2	230-231
4-8	H	H	CF ₃	H	Br	H	H	0	123-124
4-9	H	H	CF ₃	H	Br	H	H	2	125-127
4-10	H	H	CF ₃	H	H	Br	H	1	236-237

5 A y A¹ cada uno representa un átomo de nitrógeno.

[Quím. 8]



[Tabla 11]

Tabla 11

Compuesto núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	m	Propiedad física
5-1	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	2	156-158

10

A representa un N-óxido, y A¹ representa un átomo de nitrógeno.

[Tabla 12]

Tabla 12

Compuesto núm.	Datos de ¹ H-RMN
2-49	8,94 (s, 1H), 8,89 (s, 2H), 8,18 (s, 1H), 8,03 (s, 2H), 4,32 (q, 2H), 3,09 (q, 2H), 1,36 (t, 3H), 1,26 (t, 3H), 1,25 (s, 9H)

El insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto de 1H-pirrolopiridina representado por la fórmula general (1) de la presente invención, un N-óxido del mismo o una sal del mismo como ingrediente activo es adecuado para controlar una variedad de plagas que pueden dañar el arroz con cáscara, árboles frutales, hortalizas, otros cultivos y plantas ornamentales con flores. Las plagas objetivo son, por ejemplo, plagas agrícolas y forestales, plagas hortícolas, plagas de granos almacenados, plagas sanitarias, nematodos, etc.

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

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

Sesamia calamistis, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella zinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia includens*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*, *Grapholita molesta*, *Spulerina astaurola*, *Ectomyelois pyrivorella*, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, una especie de la familia Tortricidae (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*,

Lymantria dispar, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, *Bambalina sp.*, *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon sp.*, *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate* *poliographus*, *Phalera flavescens*, las especies de la familia Pieridae tales como *Pieris rapae crucivora* y *Pieris rapae*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phtheochroides clandestina*, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips brevipalpanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* y *Earias cupreoviridis*;

las especies del orden Hemiptera tales como *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptosaltria nigrofuscata*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwaskii*, *Aspidiotus destructor*, *Taylorilygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*, *Anacanthocoris striicornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *Trialeurodes vaporariorum*,

Aguriahana quercus, *Lygus spp.*, *Eucraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciicarina*, *Trioza camphorae*, *Leptocorisa chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhlerites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidiotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticicellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*, *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Gioica lucifuga*, *Numata muii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederarum*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigridorsalis*, *Sogatella furcifera*,

Megoura crassicauda,

Brevicoryne brassicae, *Aphis glicines*, *Leptocorisa oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroleucon formosanum*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stali*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparsus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*,

Eurydema rugosum, *Schizaphis pyricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lepholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nymphaeae*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhlirites debile*, *Laodelphax striatellus*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovius punctata*, *Empoasca* spp., *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocorisa acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*,

Aphrophora costalis, *Lygus disponis*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissimum*, *Eysarcoris guttiger*, *Lepidosaphes beekii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginella citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinose yanagicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonoguis*, *Orientus ishidaei*, *Ovatus malicollens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* y *Aphis gossypii*;

las especies del orden Coleoptera tales como *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tenebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotheta hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*, *Oxycetonia jucunda*, *Diabrotica* spp., *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus oryzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlineata*,

Diabrotica undecimpunctata howardi, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*, *Conotrachelus nenuphar*, *Ceuthorrhynchidius albosuturalis*, *Phaedon brassicae*, *Lasioderma serricorne*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolor japonicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*, *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*, *Tribolium confusum*, *Medythia nigrobilineata*, *Xylotrechus pyrrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*, *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *anthonomus pomorum*, *Linnaea aenea* y *Anthonomus grandis*;

las especies del orden Diptera tales como *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Chlorops oryzae*, *Hydrellia sasaki*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhagoletia japonica*, *Muscina stabulans*, las especies de la familia Phoridae tales como *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Formia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, *Asfondilia* sp., *Delia platyura*, *Delia antiqua*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens molestus* forskal, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinensis*, *Culex quinquefasciatus*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromiza nigriventris*, *Anastrepha ludens* y *Rhagoletis pomonella*;

las especies del orden Hymenoptera tales como *Pristomyrmex pungens*, la especie de la familia Bethyridae, *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, la especie de la subfamilia Vespinae, *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Argentina mali* y *Ochetellus glaber*;

las especies del orden Orthoptera tales como *Homorocoryphus lineosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricada*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* y *Teleogryllus emma*;

las especies del orden Thysanoptera tales como *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticulothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floricola*, *Thrips simplex*, *Thrips nigropilosus*, *Heliophis haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*, *Microcephalothrips abdominalis*, *Leeuwenia*

pasanii, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Frankliniella occidentalis*, *Trips palmi*, *Frankliniella lilivora* y *Liothrips vaneeckei*;

- 5 las especies del orden Acari tales como *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, las especies de la familia Ixodidae tales como *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanicus*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvarum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*,
10 *Sarcoptes scabiei*, *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moorei*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides pteronyssus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptruta citri*, *Aculus schlechtendali*, *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*, *Rhyzoglyphus robini* y *Sancassania* sp.;

- 15 las especies del orden Isoptera tales como *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes menor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes guangzhouensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* y *Reticulitermes speratus*;

- 20 las especies del orden Blattodea tales como *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* y *Periplaneta americana*;

las especies del orden Siphonaptera tales como *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* y *Ceratophyllus gallinae*;

las especies del filo Nematoda tales como *Nothotylenchus acris*, *Aphelenchoides besseyi*, *Pratylenchus penetrans*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Globodera rostochiensis*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycinis*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* y *Tylenchus semipenetrans*; y

- 25 las especies del filo Mollusca tales como *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* y *Acusta despecta sieboldiana*.

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

- Además, los ácaros y las garrapatas que parasitan a los animales también se incluyen en las plagas objetivo, y los
30 ejemplos incluyen las especies de la familia Ixodidae como *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinosa*, *Dermacentor reticulatus* y *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; la especie del género *Ornithonyssus* como *Ornithonyssus sylvarum* y
35 *Ornithonyssus bursa*; las especies de la familia Trombiculidae tales como *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* y *Helenicula miyagawai*; las especies de la familia Cheyletidae tales como *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* y *Cheyletiella blakei*; las especies de la superfamilia Sarcoptoidea tales como *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* y *Notoedres cati*; y las especies de la familia
40 Demodicidae tales como *Demodex canis*.

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

- Otras plagas objetivo incluyen ectoparásitos, por ejemplo, las especies del suborden Anoplura tales como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* y *Pediculus capitis*; las especies del suborden Mallophaga tales como *Trichodectes canis*; y plagas de insectos
50 dípteros hematófagos tales como *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* y *Simulium ornatum*. Además, los ejemplos de endoparásitos incluyen nematodos tales como gusanos pulmonares, tricocéfalos, gusanos nodulares, gusanos parásitos endogástricos, ascáridos y gusanos filariales; cestodos como *Spirometra erinacei*, *Diphylobothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* y *Echinococcus multilocularis*; trematodos tales como *Schistosoma japonicum* y *Fasciola hepatica*; y protozoos como coccidios, *Plasmodium*, *Sarcocystis* intestinal, *Toxoplasma* y *Cryptosporidium*.

- 55 El insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol representado por la fórmula general (1) de la presente invención, un N-óxido del mismo o una sal del mismo como ingrediente activo tiene un notable efecto de control sobre las plagas descritas anteriormente que dañan cultivos de tierras bajas, cultivos

- de campo, árboles frutales, hortalizas, otros cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. El efecto deseado se puede obtener cuando el insecticida agrícola y hortícola se aplica a viveros para plántulas, arrozales, campos, árboles frutales, hortalizas, otros cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. y sus semillas, agua de arrozal, follaje, medios de cultivo como tierra o similares alrededor del momento previsto de infestación de plagas, es decir, antes de la infestación o tras la confirmación de la infestación. En realizaciones particularmente preferibles, la aplicación del insecticida agrícola y hortícola utiliza la denominada penetración y translocación. Es decir, suelo de vivero, suelo en hoyos de trasplante, pie de planta, agua de riego, agua de cultivo en hidroponía, o similar se trata con el insecticida agrícola y hortícola para permitir que los cultivos, las plantas ornamentales con flores, etc. absorban el compuesto presente invención a través de las raíces a través del suelo o de otra manera.
- 10 Los ejemplos de plantas útiles a las que se puede aplicar el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención incluyen, entre otros, cereales (por ejemplo, arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, etc.), legumbres (por ejemplo, soja, judías azuki, habas, guisantes, judías, cacahuets, etc.), árboles frutales y frutas (por ejemplo, manzanas, cítricos, peras, uvas, melocotones, ciruelas, cerezas, nueces, castañas, almendras, plátanos, etc.), hortalizas de hoja y de fruto (p. ej., coles, tomates, espinacas, brócoli, lechuga, cebollas, cebollas verdes (cebolletas y cebollas galesas),
- 15 pimientos verdes, berenjenas, fresas, cultivos de pimientos, okra, cebolletas chinas, etc.), tubérculos (p. ej., zanahorias, patatas, boniatos, taros, rábanos japoneses, nabos, raíces de loto, raíces de bardana, ajo, cebolletas chinas, etc.), cultivos para procesamiento (p. ej., algodón, cáñamo, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha azucarera, aceitunas, caucho, café, tabaco, té, etc.), calabazas (por ejemplo, calabazas japonesas, pepinos, sandías, melones dulces orientales, melones, etc.), hierba de pasto (p. ej., pasto ovillo, sorgo, fleo, trébol, alfalfa, etc.), hierba de césped (p. ej., hierba coreana, pasto, etc.), especias y hierbas aromáticas y cultivos ornamentales (p. ej., lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.), plantas ornamentales con flores (p. ej., crisantemo, rosa, clavel, orquídea, tulipán, lirio, etc.), árboles de jardín (p. ej., árboles de ginkgo, cerezos, aucuba japonesa, etc.) y árboles forestales (por ejemplo, *Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, pino, cedro amarillo, cedro japonés, ciprés hinoki, eucalipto, etc.).
- 20 Las "plantas" mencionadas anteriormente también incluyen plantas dotadas de tolerancia a herbicidas mediante una técnica de cultivo clásica o una técnica de recombinación de genes. Ejemplos de dicha tolerancia a herbicidas incluyen tolerancia a inhibidores de HPPD, como isoxaflutol; inhibidores de ALS, como imazetapir y tifensulfurón-metilo; inhibidores de la EPSP sintasa, como el glifosato; inhibidores de la glutamina sintetasa, tales como glufosinato; inhibidores de acetil-CoA carboxilasa, tales como setoxidim; u otros herbicidas, como bromoxinil, dicamba y 2,4-D.
- 25 Ejemplos de plantas dotadas de tolerancia a los herbicidas mediante una técnica de cultivo clásica incluyen variedades de colza, trigo, girasol y arroz tolerantes a la familia de imidazolinona de herbicidas inhibidoras de ALS, como el imazetapir, y dichas plantas se venden bajo el nombre comercial de Clearfield (marca registrada). También se incluye una variedad de soja dotada de tolerancia a la familia de sulfonilureas de herbicidas inhibidoras de ALS, como el tifensulfurón-metilo mediante una técnica de cultivo clásica, y se vende con el nombre comercial de soja STS. También
- 30 se incluyen plantas dotadas de tolerancia a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa tales como herbicidas de triona oxima y herbicidas de ácido ariloxifenoxipropiónico mediante una técnica de cultivo clásica, por ejemplo, maíz SR y similares.
- Las plantas dotadas de tolerancia a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa se describen en Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990), y similares. Además, los mutantes de acetil-CoA carboxilasa resistentes a los inhibidores de acetil-CoA carboxilasa se informan en Weed Science, 53, 728-746 (2005), y similares, e introduciendo el gen de dicho mutante de acetil-CoA carboxilasa en plantas mediante una técnica de recombinación de genes, o introduciendo una mutación que confiere resistencia en la acetil-CoA carboxilasa de las plantas, las plantas tolerantes a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa pueden diseñarse. Alternativamente, introduciendo un ácido nucleico que causa una mutación por sustitución de base en células vegetales (un ejemplo típico de esta técnica es la técnica de quimeroplastia (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318)) para permitir la mutación de
- 40 sustitución específica del sitio en los aminoácidos codificados por un gen de acetil-CoA carboxilasa, un gen ALS o similar de las plantas, las plantas tolerantes a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa, inhibidores de ALS o similares pueden diseñarse. El insecticida agrícola y hortícola de la presente invención también se puede aplicar a estas plantas.
- Además, las toxinas ejemplares expresadas en plantas modificadas genéticamente incluyen proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; δ -endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 y Cry9C, y otras proteínas insecticidas, como VIP1, VIP2, VIP3 y VIP3A; proteínas insecticidas de nematodos; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de araña, toxinas de abeja y neurotoxinas específicas de insectos; toxinas de hongos filamentosos; lectinas vegetales; aglutinina; inhibidores de proteasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina y papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina y briodina; enzimas metabolizadoras de esteroides, tales como 3-hidroxi esteroide oxidasa, ecdisteroide-UDP-glucosiltransferasa y colesterol oxidasa; inhibidores de ecdisona; HMG-CoA reductasa; inhibidores de canales iónicos, tales como inhibidores de canales de sodio e inhibidores de canales de calcio; esterasa de hormona juvenil; receptores de hormonas diuréticas; estilbena sintasa; bibencil sintasa; quitinasa; y glucanasa.
- 50 También se incluyen toxinas híbridas, toxinas parcialmente deficientes y toxinas modificadas derivadas de lo siguiente: proteínas de endotoxina δ como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab y Cry35Ab, y otras proteínas insecticidas como VIP1, VIP2, VIP3 y VIP3A. La toxina híbrida se puede producir
- 60

combinando algunos dominios de estas proteínas de manera diferente a la combinación original en la naturaleza con el uso de una técnica de recombinación. Como toxina parcialmente deficiente, se conoce una toxina Cry1Ab en la que se elimina una parte de la secuencia de aminoácidos. En la toxina modificada, se sustituyen uno o más aminoácidos de una toxina que se da de forma natural.

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

- 10 Debido a las toxinas contenidas en dichas plantas genéticamente modificadas, las plantas exhiben resistencia a plagas, en particular, plagas de insectos coleópteros, plagas de insectos hemípteros, plagas de insectos dípteros, plagas de insectos lepidópteros y nematodos. Las tecnologías descritas anteriormente y el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención pueden usarse en combinación o usarse sistemáticamente.

- 15 Para controlar las plagas objetivo, el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención, con o sin dilución o suspensión apropiada en agua, etc., se aplica a las plantas potencialmente infestadas con las plagas de insectos o nematodos objetivo en una cantidad eficaz para el control de las plagas de insectos o nematodos. Por ejemplo, para controlar las plagas de insectos y nematodos que pueden dañar las plantas de cultivo tales como árboles frutales, cereales y hortalizas, se puede realizar la aplicación foliar y el tratamiento de semillas tales como inmersión, recubrimiento en polvo y recubrimiento con peróxido de calcio. Además, también se puede realizar el tratamiento o la aplicación al suelo o similar para permitir que las plantas absorban agroquímicos a través de sus raíces. Los ejemplos de dicho tratamiento incluyen la incorporación de todo el suelo, el tratamiento de filas de plantación, la incorporación del lecho del suelo, el tratamiento de plántulas en cepellón, el tratamiento de hoyos de plantación, el tratamiento de pie de planta, revestimiento superior, el tratamiento de cajas de vivero para arroz con cáscara y la aplicación sumergida. Además, también se puede realizar la aplicación a medios de cultivo en hidroponía, tratamiento de ahumado, inyección al tronco y similares.

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

- 30 Ejemplos de métodos de tratamiento de semillas incluyen inmersión de semillas en un fluido diluido o sin diluir de una formulación líquida o sólida para la penetración de productos agroquímicos en las semillas; mezcla o recubrimiento con polvo de las semillas con una formulación sólida o líquida para la adherencia de la formulación sobre las superficies de las semillas; recubrimiento de semillas con una mezcla de una formulación sólida o líquida y un vehículo adhesivo como resinas y polímeros; y aplicación de una formulación sólida o líquida en las inmediaciones de las semillas al mismo tiempo que se siembra.

- 35 El término "semilla" en el tratamiento de semillas mencionado anteriormente se refiere a un cuerpo vegetal que se encuentra en los primeros etapas de cultivo y se utiliza para la propagación de plantas. Los ejemplos incluyen, además de la denominada semilla, un cuerpo vegetal para la propagación vegetativa, tal como un bulbo, un tubérculo, una semilla de patata, un bulbillo, un propágulo, un tallo discoide y un tallo utilizado para propagación por partes cortadas.

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

- 45 Ejemplos de métodos de aplicación al follaje de cultivos o a plagas de granos almacenados, plagas domésticas, plagas sanitarias, plagas forestales, etc. incluyen la aplicación de una formulación líquida, como un concentrado emulsionable y una formulación fluida o sólida, como una formulación de polvo humectable y gránulos dispersables en agua, después de una adecuada dilución en agua; aplicación de polvo; y ahumado.

- 50 Ejemplos de métodos de aplicación al suelo incluyen la aplicación de una formulación líquida diluida en agua o sin diluir al pie de las plantas, viveros para plántulas o similares; aplicación de un gránulo al pie de las plantas, viveros para plántulas o similares; aplicación de un polvo, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar sobre el suelo y la posterior incorporación de la formulación en todo el suelo antes de la siembra o el trasplante; y aplicación de un polvo, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar a hoyos de plantación, hileras de plantación o similares antes de la siembra o plantación.

- 55 A las cajas de vivero para arroz de arrozal, por ejemplo, se les puede aplicar un polvo, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar, aunque la formulación adecuada puede variar según el momento de la aplicación, es decir, según la etapa del cultivo como tiempo de siembra, período de reverdecimiento y tiempo de plantación. Una formulación

como un polvo, un gránulo dispersable en agua y un gránulo se puede mezclar con suelo de vivero. Por ejemplo, una formulación de este tipo se incorpora al suelo del lecho, al suelo de cobertura o al suelo completo. Simplemente, la tierra de vivero y dicha formulación pueden colocarse alternativamente en capas.

En la aplicación a los arrozales, se aplica normalmente a los arrozales inundados una formulación sólida, tal como un jumbo, un paquete, un gránulo y un gránulo dispersable en agua, o una formulación líquida, tal como un concentrado fluido y emulsionable. En un período de siembra de arroz, se puede aplicar al suelo o inyectarse en el suelo una formulación adecuada, tal cual o después de mezclarla con un fertilizante. Además, se puede aplicar un concentrado emulsionable, fluido o similar a la fuente de suministro de agua para los arrozales, como una entrada de agua y un dispositivo de riego. En este caso, el tratamiento puede llevarse a cabo con el suministro de agua y lograrse así de forma que ahorre trabajo.

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

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

El insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se usa comúnmente como una formulación conveniente para su aplicación, que se prepara en el método habitual para preparar formulaciones agroquímicas.

Es decir, el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1) de la presente invención, un N-óxido del mismo o una sal del mismo y un vehículo inactivo apropiado, y si es necesario un adyuvante, se mezclan en una proporción apropiada, y a través dla etapa de disolución, separación, suspensión, mezcla, impregnación, adsorción y/o adhesión, se formulan en una forma adecuada para su aplicación, como un concentrado en suspensión, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo, un polvo, un comprimido y un paquete.

La composición (insecticida agrícola y hortícola o agente para el control de parásitos animales) de la presente invención puede contener opcionalmente un aditivo usado habitualmente para formulaciones agroquímicas o agentes para el control de parásitos animales además del ingrediente activo. Los ejemplos del aditivo incluyen vehículos tales como vehículos sólidos o líquidos, tensioactivos, dispersantes, agentes humectantes, aglutinantes, agentes de pegajosidad, espesantes, colorantes, esparcidores, agentes adherentes/esparcidores, agentes anticongelantes, agentes antiaglomerantes, desintegrantes y agentes estabilizantes. Si es necesario, también se pueden usar como aditivo conservantes, fragmentos de plantas, etc. Uno de estos aditivos puede usarse solo, y también dos o más de ellos pueden usarse en combinación.

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

Los ejemplos de vehículos líquidos incluyen alcoholes que incluyen alcoholes monohídricos, como metanol, etanol, propanol, isopropanol y butanol, y alcoholes polihídricos, como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol, hexilenglicol, polietilenglicol, polipropilenglicol y glicerina; compuestos de polioles, tales como éter de propilenglicol; cetonas, tales como acetona, metilacetona, metilisobutilcetona, diisobutilcetona y ciclohexanona; éteres, tales como éter etílico, dioxano, éter monoetílico de etilenglicol, éter dipropílico y tetrahidrofurano; hidrocarburos alifáticos, tales como parafina normal, nafteno, isoparafina, queroseno y aceite mineral; hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, nafta disolvente y alquil naftaleno; hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano, cloroformo y tetracloruro de carbono; ésteres, tales como acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo y adipato de dimetilo; lactonas, tales como γ -butirolactona; amidas, tales como dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida y N-alquilpirrolidinona; nitrilos, como acetónitrilo; compuestos de azufre, tales como sulfóxido de dimetilo; aceites vegetales, como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón y aceite de ricino; y agua. Uno de estos vehículos líquidos puede usarse solo y también dos o más de ellos pueden usarse en combinación.

Los tensioactivos ejemplares utilizados como el dispersante o agente humectante/difusor incluyen tensioactivos no iónicos, tales como éster de ácido graso de sorbitán, éster de ácido graso de polietilensorbitán, éster de ácido graso

- de sacarosa, éster de ácido graso de polioxietileno, éster de ácido de resina de polioxietileno, diéster de ácido graso de polioxietileno, polioxietileno alquiléter, polioxietileno alquilariléter, polioxietileno alquilfeniléter, polioxietileno dialquilfeniléter, condensados de polioxietileno alquilfeniléter-formaldehído, copolímeros de bloque de polioxietileno-polioxipropileno, polímeros de bloque de poliestireno-polioxietileno, éter de copolímero de bloque de alquil polioxietileno-polipropileno, polioxietilenalquilamina, amida de ácido graso de polioxietileno, bis(feniléter) de ácido graso de polioxietileno, polialquilenbencilfeniléter, polioxialquilenestirilfeniléter, diol de acetileno, diol de acetileno con adición de polioxialquilen, silicona de tipo éter de polioxietileno, silicona de tipo éster, tensioactivos fluorados, aceite de ricino de polioxietileno y aceite de ricino hidrogenado con polioxietileno; tensioactivos aniónicos, tales como sulfatos de alquilo, sulfatos de éter de polioxietilenalquilo, sulfatos de éter de polioxietilenalquilfenilo, sulfatos de éter de polioxietilenestirilfenilo, sulfonatos de alquilbenceno, sulfonatos de alquilarilo, lignosulfonatos, sulfosuccinatos de alquilo, sulfonatos de naftaleno, sulfonatos de alquilnaftaleno, sales de condensados de ácido naftalenosulfónico-formaldehído, sales de condensados de ácido alquilnaftalenosulfónico-formaldehído, sales de ácidos grasos, sales de ácidos policarboxílicos, poliácridatos, sarcosinatos de N-metil-ácidos grasos, resinatos, fosfatos de polioxietilenalquiléter y fosfatos de polioxietilenalquilfeniléter; tensioactivos catiónicos que incluyen sales de alquilamina, tales como clorhidrato de laurilamina, clorhidrato de estearilamina, clorhidrato de oleilamina, acetato de estearilamina, acetato de estearil aminopropilamina, cloruro de alquiltrimetilamonio y cloruro de alquildimetilbenzalconio; y tensioactivos anfóteros, tales como tensioactivos anfóteros de tipo aminoácido o tipo betaína. Uno de estos tensioactivos se puede usar solo, y también se pueden usar dos o más de ellos en combinación.
- Los ejemplos de aglutinantes o agentes de pegajosidad incluyen carboximetilcelulosa o sus sales, dextrina, almidón soluble, goma xantana, goma guar, sacarosa, polivinilpirrolidona, goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, poliácridato de sodio, polietilenglicoles con un peso molecular promedio de 6.000 a 20.000, óxidos de polietileno con un peso molecular promedio de 100.000 a 5.000.000, fosfolípidos (por ejemplo, cefalina, lecitina, etc.), polvo de celulosa, dextrina, almidón modificado, compuestos quelantes de ácido poliaminocarboxílico, polivinilpirrolidona reticulada, copolímeros de ácido maleico-estireno, copolímeros de ácido (met)acrílico, semiésteres de polímero de alcohol polihídrico y anhídrido dicarboxílico, sulfonatos de poliestireno solubles en agua, parafina, terpeno, resinas de poliamida, poliácridatos, polioxietileno, ceras, polivinilalquiléter, condensados de alquilfenol-formaldehído y emulsiones de resina sintética.
- Los ejemplos de espesantes incluyen polímeros solubles en agua, tales como goma de xantano, goma guar, goma de diutano, carboximetilcelulosa, polivinilpirrolidona, polímeros de carboxivinilo, polímeros acrílicos, compuestos de almidón y polisacáridos; y polvos finos inorgánicos, como bentonita de alto grado y sílice pirogénica (carbono blanco).
- Los ejemplos de colorantes incluyen pigmentos inorgánicos, como óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia; y tintes orgánicos, tales como tintes de alizarina, tintes azoicos y tintes de ftalocianina metálica.
- Ejemplos de agentes anticongelantes incluyen alcoholes polihídricos, tales como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol y glicerina.
- Los ejemplos de adyuvantes que sirven para evitar el apelmazamiento o facilitar la desintegración incluyen polisacáridos (almidón, ácido algínico, manosa, galactosa, etc.), polivinilpirrolidona, sílice pirogénica (carbono blanco), goma de éster, resina de petróleo, tripolifosfato de sodio, hexametafosfato de sodio, estearatos de metal, polvo de celulosa, dextrina, copolímeros de metacrilato, polivinilpirrolidona, compuestos quelantes de ácidos poliaminocarboxílicos, copolímeros de estireno-isobutileno-anhídrido maleico sulfonados y copolímeros de injerto de almidón-poliacrilonitrilo.
- Los ejemplos de agentes estabilizadores incluyen desecantes, tales como zeolita, cal viva y óxido de magnesio; antioxidantes, tales como compuestos fenólicos, compuestos de amina, compuestos de azufre y compuestos de ácido fosfórico; y absorbentes de ultravioleta, tales como compuestos de ácido salicílico y compuestos de benzofenona.
- Los ejemplos de conservantes incluyen sorbato de potasio y 1,2-benzotiazolin-3-ona.
- Además, si es necesario, también se pueden usar otros adyuvantes que incluyen agentes de extensión funcionales, potenciadores de la actividad tales como inhibidores metabólicos (butóxido de piperonilo, etc.), agentes anticongelantes (propilenglicol, etc.), antioxidantes (BHT, etc.) y absorbentes de ultravioleta.
- La cantidad del compuesto de ingrediente activo en el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se puede ajustar según sea necesario y, básicamente, la cantidad del compuesto de ingrediente activo se selecciona apropiadamente del intervalo de 0,01 a 90 partes en peso en 100 partes por peso del insecticida agrícola y hortícola. Por ejemplo, en el caso de que el insecticida agrícola y hortícola sea un polvo, un gránulo, un concentrado emulsionable o un polvo humectable, es adecuado que la cantidad del compuesto de ingrediente activo sea de 0,01 a 50 partes en peso (0,01 a 50% en peso relativo al peso total del insecticida agrícola y hortícola).
- La tasa de aplicación del insecticida agrícola y hortícola de la presente invención puede variar con varios factores, por ejemplo, el propósito, la plaga objetivo, las condiciones de crecimiento de los cultivos, la tendencia a la infestación de plagas, el clima, las condiciones ambientales, la forma de dosificación, el método de aplicación, el sitio de aplicación, el tiempo de aplicación, etc., pero básicamente, la tasa de aplicación del compuesto de ingrediente activo se selecciona apropiadamente del intervalo de 0,001 g a 10 kg, y preferiblemente de 0,01 g a 1 kg por 10 ares dependiendo del

propósito.

Además, para la expansión del intervalo de plagas objetivo y el momento apropiado para el control de plagas, o para la reducción de la dosis, el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se puede usar después de mezclarlo con otros insecticidas agrícolas y hortícolas, acaricidas, nematocidas, microbicidas, bioplaguicidas y/o similares.

- 5 Además, el insecticida agrícola y hortícola se puede usar después de mezclarlo con herbicidas, reguladores del crecimiento de plantas, fertilizantes y/o similares dependiendo de la situación.

Ejemplos de dichos insecticidas, acaricidas y nematocidas agrícolas y hortícolas adicionales utilizados para los fines mencionados anteriormente incluyen metilcarbamato de 3,5-xililo (XMC), toxinas proteicas cristalinas producidas por *Bacillus thuringiensis* como *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* y *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, compuestos insecticidas derivados de la toxina Bt, CPCBS (clorfensona), DCIP (éter diclorodiisopropílico), D-D (1,3-dicloropropeno), DDT, NAC, O,O-dietilfosforotioato de O-4-dimetilsulfamoiifenilo (DSP), O-4-nitrofenilfenilfosfonotioato de O-etilo (EPN), tripropilisocianurato (TPIC), acrinatrina, azadiractina, azinfos-metilo, acequinocilo, acetamiprid, acetoprol, acefato, abamectina, avermectina-B, amidoflomet, amitraz, alanycarb, aldicarb, aldoxicarb, aldrin, alfa-endosulfano, alfa-cipermetrina, albendazol, aletrina, isazofos, isamidofos, isoxatión de isoamidofos, isofenfos, isoprocarb (MIPC), ivermectina, imiciafos, imidacloprid, imiprotina, indoxacarb, esfenvalerato, etiofencarb, etiona, etiprol, etoxazol, etofenprox, etoprofos, etrimfos, emamectina, benzoato de emamectina, endosulfano, empentrina,

- oxamilo, oxidemetona-metilo, oxideprofos (ESP), oxibendazol, oxfendazol, oleato de potasio, oleato de sodio, cadusafos, cartap, carbarilo, carbosulfano, carbofurano, gamma-cihalotrina, xililcarb, quinalfos, quinopreno, quinometionato, cloetocarb, clotianidina, clofentezina, cromafenozida, clorantraniliprol, cloretoxifos, clordimeformo, clordano, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenapir, clorfensona, clorfenvinfos, clorfluazurona, clorobencilato, clorobenzoato, queltano (dicofol), salitión, cianofos (CYAP), diafentiurón, diamidafos, ciantraniliprol, theta-cipermetrina, dienocloro, cienopirafeno, dioxabenzofos, diofenolano, sigma-cipermitrina, diclofentiona (ECP), cicloprotrina, diclorvos (DDVP), disulfotona, dinotefurano, cihalotrina, cifenotrina, ciflutrina, diflubenzurona, ciflometofeno, diflovidazina, cihexatina, cipermetrina, dimetilvinfos dimetoato, dimeflutrina, silafluofeno, ciromazina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espirotetramat, espiromesifeno, sulfluramida, sulprofos, sulfoxaflor, zeta-cipermetrina,

- diazinona, tau-fluvalinato, dazomet, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiociclam, tiosultap, tiosultap-sodio, tionazina, tiometona, deet, dieldrina, tetraclorvinfos, tetradifona, tetrametilflutrina, tetrametrina, tebupirimfos, tebufenozida, tebufenpirad, teflutrina, teflubenzurona, demetona-S-metilo, temefos, deltametrina, terbufos, tralopirilo, tralometriona, transflutrina, triazamato, triazurona, triclamida, triclorfón (DEP), triflumurona, tolfenpirad, naled (BRP), nitiazina, nitenpiram, novalurona, noviflumurona, hidropreno, vaniliprol, vamidotona, paratión, paratión-metilo, halfenprox, halofenozida,

- bistriflurona, bisultap, hidrametilnona, hidroxipropilalmidón, binapacril, bifenazato, bifentrina, pimetrozina, piraclofos, pirafluprol, piridafentión, piridabén, piridalilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, pirimicarb, pirimidifeno, pirimfos-metilo, piretrinas, fipronilo, fenazaquina, fenamifos, bromopropilato, fenitrotiona (MEP), fenoxicarb, fenotiocarb, fenotrina, fenobucarb, fensulfotona, fentiona (MPP), fentoato (PAP), fenvalerato, fenpiroximato, fenpropatrina, fenbendazol, fostiazato, formetanato, butatofos, buprofezina, furatiocarb, praletrina, fluacripirim, fluazinam, fluazurona, fluensulfona, flucicloxurona, flucitrinato, fluvalinato, flupirazofos, flufenerim, flufenoxurona, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, flubrocitrinato, flubendiamida, flumetrina, flurimfeno, protiofos, protrifenbute, flonicamid, propafos, propargita (BPPS), profenofos, proflutrina, propoxur (PHC), bromopropilato,

beta-ciflutrina, hexaflumurona, hexitiazox, heptenofos, permetrina, benclotiaz, bendiocarb, bensultap, benzoximato, benfuracarb, foxima, fosadona, fostiazato, fostietano, fosfamidona, fosfocarb, fosmet (PMP), polinactinas, formetanato, formotiona, forato,

- aceite de máquina, malatión, milbemicina, milbemicina-A, milbemectina, mecarbam, mesulfenfos, metomilo, metaldehído, metaflumizona, metamidofos, metam-amonio, metam-sodio, metiocarb, metidationa (DMTP), metilisotiocianato, metilneodecanamida, metilparatión, metoxadiazona, metoxicloro, metoxifeno, metoflutrina, metopreno, metolcarb, meperflutrina, mevinfos, monocrotofos, monosultap, lambda-cihalotrina, rianodina, lufenurona, resmetrina, lepimectina, rotenona, clorhidrato de levamisol, óxido de fenbutatina, tartrato de morantel, bromuro de metilo, hidróxido de triciclohexilestaño (cihexatina), cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, azufre y sulfato de nicotina.

Ejemplos de microbicidas agrícolas y hortícolas utilizados para los mismos fines que los anteriores incluyen aureofungina, azaconazol, azitiram, acipetacs, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, azoxistrobina, anilazina, amisulbrom, ampropilfos, ametocradina, alcohol alílico, aldimorfo, amobam, isotianilo, isovalediona, isopirazam, isoprotilano, ipconazol, iprodiona, iprovalicarb, iprobenfos, imazalilo, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, eclomezol, edifenfos, etaconazol, etaboxam, etirimol, etem, etoxiquina, etridiazol, enestroburina, epoxiconazol, oxadixilo, oxicarboxina, 8-quinolinolato de cobre, oxitetraciclina, oxinato de cobre, oxpoconazol, fumarato de oxpoconazol, ácido oxolínico, octilinona, ofurace, orisastrobina,

- metam-sodio, kasugamicina, carbamorf, carpropamida, carbendazim, carboxina, carvona, quinazamid, quinacetol, quinoxifeno, quinometionato, captafol, captano, kiralaxilo, quinconazol, quintoceno, guazatina, cufraneb, cuprobam, gliodina, griseofulvina, climbazol, cresol, kresoxim-metilo, clozolinato, clotrimazol, clobentiazona, cloraniformetano, cloranilo, clorquinox, cloropicrina, clorfenazol, clorodinitronaftaleno, clorotalonilo, cloroneb, zarilamida, salicilanilida,
- 5 ciazofamida, pirocarbonato de dietilo, dietofencarb, ciclafuramida, diclocimet, diclozolina, diclobutrazol, diclofluanida, cicloheximida, diclomezina, diclorano, diclorofeno, diclona, disulfiram, ditalimfos, ditianona, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinocetona, dinosulfona, dinoterbona, dinobutona, dinopentona, dipiritiona, difenilamina, difenoconazol, ciflufenamida, diflumetorim, ciproconazol, ciprodinilo, ciprofuram, cipendazol, simeconazol, dimetirimol, dimetomorfo, cimonaxilo, dimoxistrobina, bromuro de metilo, ziram, siltiofam,
- 10 estreptomicina, espiroxamina, sultropeno, sedaxano, zoxamida, dazomet, tiadiazina, tiadinilo, tiadifluor, tiabendazol, tioximida, tioclorfenim, tiofanato, tiofanato-metilo, ticiofeno, tioquinox, quinometionato, tifluzamida, tiram, decafentina, tecnaceno, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, ácido deshidroacético, tebuconazol, tebufloquina, dodicina, dodina, dodecylbencenosulfonato bis-etilendiamina de cobre (II) (DBEDC), dodemorfo, drazoxolona, triadimenol, triadimefona, triazbutilo, triazóxido, triamifos, triarimol, triclamida, triciclazol, triticonazol, tridemorfo, óxido de
- 15 tributilestaño, triflumizol, trifloxistrobina, triforina, tolilfluánida, tolclofos-metilo, natamicina, nabam, nitroal-isopropilo, nitroestireno, nuarimol, nonilfenolsulfonato de cobre, halacrinato, validamicina, valifenalato, proteína harpina,
- bixafeno, picoxistrobina, picobenzamida, bitionol, bitertanol, hidroxiiisoxazol, hidroxiiisoxazol-potasio, binapacril, bifenilo, piperalina, himexazol, piraxistrobina, piracarbolid, piraclostrobina, pirazofos, pirametostrobina, pirifenona, piridinitrilo, pirifenox, piribencarb, pirimetanilo, piroxifurona, piroxicloro, piroxifur, piroquilona, vinclozolina,
- 20 famoxadona, fenapanilo, fenamidona, fenaminosulf, fenarimol, fenitropano, fenoxanilo, ferimzone, ferbam, fentina, fencipclonilo, fenciprazamina, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidina, fenpropimorfo, fenhexamida, ftalida, butiobato, butilamina, bupirimato, fuberidazol, blastidina-S, furametpir, furalaxilo, fluacipirim, fluazinam, fluoxastrobina, fluotrimazol, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, furcarbanilo, fluxapiroxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonilo, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, furfural, furmeciclox, flumetover, flumorfo,
- 25 proquinazid, procloraz, procimidona, protiocarb, protioconazol, propamocarb, propiconazol, propineb, furofanato, probenazol, bromuconazol,
- hexaclorobutadieno, hexaconazol, hexiltiofos, betoxazina, benalaxilo, benalaxilo-M, benodanilo, benomilo, pefurazoato, benquinox, penconazol, benzamorf, pencicurona, ácido benzohidroxámico, bentalurona, bentiazol, bentiavalicarb-isopropilo, pentiopirad, penflufeno, boscalid, fosdifeno, fosetilo, fosetilo-Al, polioxinas, polioxorim,
- 30 policarbamato, folpet, formaldehído, aceite de máquina, maneb, mancozeb, mandipropamid, miclozolina, miclobutanilo, mildiomicina, milneb, mecarbinzid, metasulfocarb, metazoxolona, metam, metam-sodio, metalaxilo, metalaxilo-M, metiram, isotiocianato de metilo, meptildinocap, metconazol, metsulfovax, metfuroxam, metominostrobina, metrafenona, mepanipirim, mafenoxam, meptildinocap, mepronilo, mebenilo, yodometano, rabenzazol, cloruro de benzalconio, cloruro de cobre básico, sulfato de cobre básico, microbicidas inorgánicos como
- 35 plata, hipoclorito de sodio, hidróxido cúprico, azufre humectable, polisulfuro de calcio, carbonato ácido de potasio, carbonato ácido de sodio, azufre, anhídrido de sulfato de cobre, dimetilditiocarbamato de níquel, compuestos de cobre como 8-quinolinolato de cobre (oxina de cobre), sulfato de zinc y sulfato de cobre pentahidratado.
- Ejemplos de herbicidas utilizados para los mismos fines que los anteriores incluyen 1-naftilacetamida, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP,
- 40 MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, ioxinilo, acclonifeno, azafenidina, acifluorfen, aziprotina, azimsulfurona, asulam, acetocloro, atrazina, atratona, anisurona, anilofos, aviglicina, ácido abscísico, amicarbazona, amidosulfurona, amitrol, aminociclopiracloro, aminopiridil, amibuzina, amiprofos-metilo, ametrindona, ametrina, alacloro, alidocloro, alloxidim, alorac, isourona, isocarbamida, isoxaclorol, isoxapirifop, isoxaflutol, isoxabeno, isocilo, isonorurona, isoproturona, isopropalina, isopolinato, isometiozina, inabefide, ipazina, ipfencarbazona, iprimidam, imazaquina, imazapic,
- 45 imazapir, imazametapir, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazetapir, imazosulfurona, indaziflam, indanofano, ácido indolbutírico, uniconazol-P, eglinaquina, esprocarb, etametsulfurona, etametsulfurona-metilo, etalfuralina, etiolato, eticlozato de etilo, etidimurona, etinofeno, etefona, etoxisulfurona, etoxifeno, etnipromid, etofumesato, etobenzanida, epronaz, erbon, endotal, oxadiazona, oxadiargilo, oxaziclomefona, oxasulfurona, oxapirazona, oxifluorfen, orizalina, ortobensulfamurona, orbencarb,
- 50 cafenstrol, cambendicloro, carbasulam, carfentrazona, carfentrazona-etilo, carbutilato, carbetamida, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etilo, xilacloro, quincloclamina, quincloclorac, quincloclorac, quincloclorac, cumilurona, clodinato, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, credazina, cletodim, cloxifonac, clodinafop, clodinafop-propargilo, clorotolurona, clorpiralid, cloproxiidim, cloprop, clorbromurona, clofop, clomazona, clometoxinilo, clometoxifeno, clomeprop, clorazifop, clorazina, cloransulam, cloranocrilo, cloramben, cloransulam-metilo, cloridazona, clorimurona,
- 55 clorimurona-etilo, clorsulfurona, clortal, clortiamida, clortolurona, clornitrofen, clorfenac, clorfenprop, clorbufam, clorflurazol, clorflurenol, clorprocarb, clorprofam, clormequat, cloreturona, cloroxinilo, cloroxurona, cloropona,
- saflufenacilo, cianazina, cianatrina, dialato, diurona, dietamquat, dicamba, ciclurona, cicloato, cicloxiidim, diclosulam, ciclosulfamurona, diclorprop, diclorprop-P, diclobenilo, diclofop, diclofop-metilo, diclormato, dicloralurea, diquat, cisanilida, disul, sidurona, ditiopir, dinitramina, cinidona-etilo, dinosam, cinosulfurona, dinoseb, dinoterb, dinofenato, dinoprop, cihalofop-butilo, difenamida, difenoxurona, difenopenteno, difenzoquat, cibutrina, ciprazina, ciprazol,
- 60

diflufenican, diflufenzopir, dipropetrina, cipromid, ciperquat, giberelina, simazina, dimexano, dimetacoloro, dimidazona, dimetametrina, dimetenamida, simetrina, simetona, dimepiperato, dimefurona, cinmetilina, swep, sulglicapina, sulcotriona, sulfalato, sulfentrazona, sulfosulfurona, sulfometurona, sulfometurona-metilo, sebumetona, setoxidim, sebutilazina,

- 5 terbacil, daimurona, dazomet, dalapona, tiazafurona, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tiocarbazilo, tioclorim, tiobencarb, tidiazimina, tidiazurona, tifensulfurona, tifensulfurona-metilo, desmedifam, desmetrina, tetraflurona, tenilcloro, tebutam, tebutiurona, terbumetona, tepraloxidim, tefuriltriona, tembotriona, delacloro, terbacilo, terbucarb, terbucloro, terbutilazina, terbutrina, topamezona, tralcoxidim, triaziflam, triasulfurona, trialato, trietazina, tricamba, triclopir, tridifano, tritac, tritosulfurona, triflusulfurona, triflusulfurona-metilo, trifluralina, trifloxisulfurona,
- 10 tripropindano, tribenurona-metilo, tribenurona, trifop, trifopsima, trimeturona, naftalam, naproanilida, napropamida, nicosulfurona, nitralina, nitrofenol, nitrofluorfenol, nipiraclofenol, neburona, norflurazona, norurona,

- barbano, paclobutrazol, paraquat, paraflurona, haloxidina, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-metilo, halosafeno, halosulfurona, halosulfurona-metilo, picloram, picolinafeno, biciclopirona, bispiribac, bispiribac-sodio, pidanona, pinoxadeno, bifenox, piperofos, himexazol, piraclonilo, piraclonilol, pirazoxifeno, pirazosulfurona, pirazosulfurona-etilo, pirazolato, bilanafos, piraflufeno-etilo, pircoloro, piridafol, piritiobac, piritiobac-sodio, piridato, pirifitalida, piributicarb, piribenzoxim, pirimisulfano, primisulfurona, piriminopiroxác-metilo, piroxasulfona, piroxsulam,
- 15

- fenasulam, fenisofam, fenurona, fenoxasulfona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenotiol, fenoprop, fenobenzurona, fentiafop, fenteracol, fentrazamida, fenmedifam, fenmedifam-etilo, butacloro, butafenacilo, butamifos, butiurona, butidazol, butilato, buturona, butenacoloro, butroxidim, butralina, flazasulfurona, flamprop, furiloxifeno, prinacoloro, primisulfurona-metilo, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazolato, fluroxipir, fluotiurona, fluometurona, fluoroglicofeno, flurocloridona, fluorodifeno, fluoronitrofenol, fluoromidina, flucarbazona, flucarbazona-sodio, fluclopiridina, flucetosulfurona, flutiacet, flutiacet-metilo, flupirsulfurona, flufenacet, flufenicano, flufenpir, flupropacilo, flupropacilato, flupropacilol, flumioxazina, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumipropina, flumetazina, fluometurona, flumetsulam, fluridona, flurtamona, fluroxipir,
- 20

- pretilacloro, proxano, proglinazina, prociazina, prodiamina, prosulfalina, prosulfurona, prosulfocarb, propaquizafop, propacloro, propazina, propanilo, propizamida, propisocoloro, prohidrojasmona, propirisulfurona, profam, profluazol, profluralina, prohexadiona cálcica, propoxicarbazona, propoxicarbazona sódica, profoxidim, bromacilo, brompirazona, prometrina, prometona, bromoxinilo, bromofenoxim, bromobutide, bromobonilo, florasulam,
- 25

- hexacloroacetona, hexazinona, petoxamida, benazolina, penoxsulam, pebulato, beflubutamida, vernolato, perfluidona, bencarbazona, benzadox, benzipram, bencilaminopurina, benztiaturona, benzfendizona, bensulida, bensulfurona-metilo, benzoilprop, benzobiciclona, benzofenap, benzofluor, bentazona, pentanocoloro, bentiocarb, pendimetilina, pentoxazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, fomesafeno, foramsulfurona, forclorfenurona, hidrazida maleica, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfurona, mesosulfurona-metilo, mesotriona, mesoprazina, metoprotina, metazacloro, metazol, metazosulfurona, metabenztiaturona, metamitrona, metamifop, metam, metalpropalina, metiurona, metiozolina, metiobencarb, metildimrona, metoxurona, metosulam, metsulfurona, metsulfurona-metilo, metflurazona, metobromurona, metobenzurona, metometona, metolacloro, metribuzina, mepiquat-cloruro, mefenacet, mefluidida, monalida, monisourona, monurona, ácido monocloroacético, monolinurona, molinato, morfamquat, yodosulfurona, yodosulfurona-metilo-sodio, yodobonilo, yodometano, lactofeno, linurona, rimsulfurona, lenacilo, rodetanilo, peróxido de calcio y bromuro de metilo.
- 30

- Los bioplaguicidas ejemplares usados para los mismos fines que los anteriores incluyen formulaciones virales tales como virus de polihedrosis nuclear (NPV), virus de granulosis (GV), virus de polihedrosis citoplasmática (CPV) y virus de entomopox (EPV); plaguicidas microbianos utilizados como un insecticida o un nematocida, como *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* y *Pasteuria penetrans*; plaguicidas microbianos utilizados como microbicida, tales como *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, *Erwinia carotovora* avirulento y *Bacillus subtilis*; y bioplaguicidas utilizados como un herbicida, como *Xanthomonas campestris*. Puede esperarse que dicho uso combinado del insecticida agrícola y hortícola de la presente invención con el bioplaguicida anterior como una mezcla proporcione el mismo efecto que el anterior.
- 35

- Otros ejemplos de bioplaguicidas incluyen depredadores naturales como *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* y *Orius sauteri*; plaguicidas microbianos como *Beauveria brongniartii*; y feromonas tales como acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo, acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona y 14-metil-1-octadeceno.
- 40

- La presente invención también incluye un agente de control de ectoparásitos animales que comprende el compuesto de la presente invención, un N-óxido del mismo o una sal del mismo como ingrediente activo; y un método para controlar ectoparásitos animales, que comprende tratar ectoparásitos animales con una cantidad eficaz del agente de control de ectoparásitos animales. El compuesto de la presente invención se puede utilizar mediante aplicación puntual o por vertido, normalmente en uno o dos sitios de la piel de un animal, como un gato o un perro. El área de aplicación suele ser de 5 a 10 cm². Una vez aplicado, el compuesto de la presente invención preferiblemente se difunde por todo el cuerpo del animal y luego se seca sin cristalización o cambios en la apariencia visual o textura. La cantidad preferible
- 45

del compuesto utilizado se selecciona del intervalo de 0,1 a 10 mL según el peso del animal y, en particular, es de aproximadamente 0,5 a 1 mL para un gato y de aproximadamente 0,3 a 3 mL para un perro.

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

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

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

Los parásitos hemípteros incluyen las especies del género *Cimex* como *Cimex lectularius* y *Cimex hemipterus*; la especie del género *reduvius* como *reduvius senilis*; la especie del género *Arilus* como *Arilus Critatus*; la especie del género *Rhodnius* como *Rhodnius prolixus*; la especie del género *Triatoma* como *Triatoma rubrofasciata*; y *Panstrongylus* spp.

Los parásitos Acarina incluyen las especies del género *Amblyomma* como *Amblyomma americanum* y *Amblyomma maculatum*; la especie del género *Boophilus* como *Boophilus microplus* y *Boophilus annulatus*; la especie del género *Dermacentor* como *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor taiwanicus* y *Dermacentor andersoni*; la especie del género *Haemaphysalis* como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava* y *Haemaphysalis campanulata*; la especie del género *Ixodes* como *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes pacificus* e *Ixodes holociclus*; la especie del género *Rhipicephalus* como *Rhipicephalus sanguineus* y *Rhipicephalus appendiculatus*; la especie del género *Argas* como *Argas persicus*; la especie del género *Ornithodoros* como *Ornithodoros hermsi* y *Ornithodoros turicata*; la especie del género *Psoroptes* como *Psoroptes ovis* y *psoroptes equi*; la especie del género *Knemidocoptes* como *Knemidocoptes mutans*; la especie del género *Notoedres* como *Notoedres cati* y *Notoedres muris*; la especie del género *Sarcoptes* como *Sarcoptes scabiei*; la especie del género *Otodectes* como *Otodectes cynotis*; la especie del género *Listrophorus* como *Listrophorus gibbus*; *coriotes* spp.; *hipodectes* spp.; *Pterolichus* spp.; *Cytodites* spp.; *Laminosioptes* spp.; la especie del género *Dermanyssus* como *Dermanyssus gallinae*; la especie del género *Ornithonyssus* como *Ornithonyssus sylviae* y *Ornithonyssus bacoti*; la especie del género *Varroa* como *varroa jacobsoni*; la especie del género *Cheyletiella* como *Cheyletiella yasguri* y *Cheyletiella blakei*; *ornitoqueiletia* spp.; la especie del género *Demodex* como *Demodex canis* y *Demodex cati*; *Miobia* spp.; *Psorergates* spp.; y las especies del género *Trombicula* como *Trombicula akamushi*, *Trombicula pálida* y *Trombicula scutellaris*. Se prefieren los parásitos Siphonaptera, los parásitos Siphunculata y los parásitos Acarina.

Los animales a los que se les puede administrar el agente de control de ectoparásitos de la presente invención pueden ser animales huéspedes de los ectoparásitos animales antes mencionados. Dichos animales suelen ser homeotermos y poiquilotermos que se crían como animales domésticos o mascotas. Dichos homeotermos incluyen mamíferos tales como vacas, búfalos, ovejas, cabras, cerdos, camellos, ciervos, gamos, renos, caballos, burros, perros, gatos, conejos, hurones, ratones, ratas, hámsteres, ardillas y monos; animales de peletería como visones, chinchillas y mapaches; y aves tales como pollos, gansos, pavos, patos domésticos, palomas, loros y codornices. Los poiquilotermos mencionados anteriormente incluyen reptiles como tortugas, tortugas marinas, tortugas acuáticas, tortugas acuáticas japonesas, lagartijas, iguanas, camaleones, geckos, pitones, serpientes colúbridas y cobras. Se prefieren los homeotermos, y más se prefieren los mamíferos tales como perros, gatos, vacas, caballos, cerdos, ovejas y cabras.

Los compuestos de la presente invención tienen excelentes características biológicas como se describe anteriormente y, además, tienen una baja carga medioambiental, como se ejemplifica por ser fácilmente degradables en el medio ambiente y tener menos impacto en organismos útiles como las abejas.

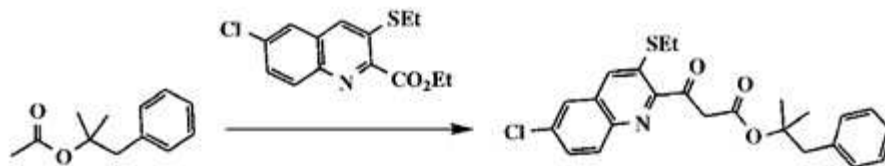
A continuación, se describirán con más detalle los ejemplos de producción de compuestos representativos de la presente invención y sus intermedios, pero la presente invención no se limita únicamente a estos ejemplos.

Ejemplos

Ejemplo de Referencia 1

Método de producción de 1,1-dimetil-2-feniletilester del ácido 3-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-3-oxi-propiónico

[Quím. 9]

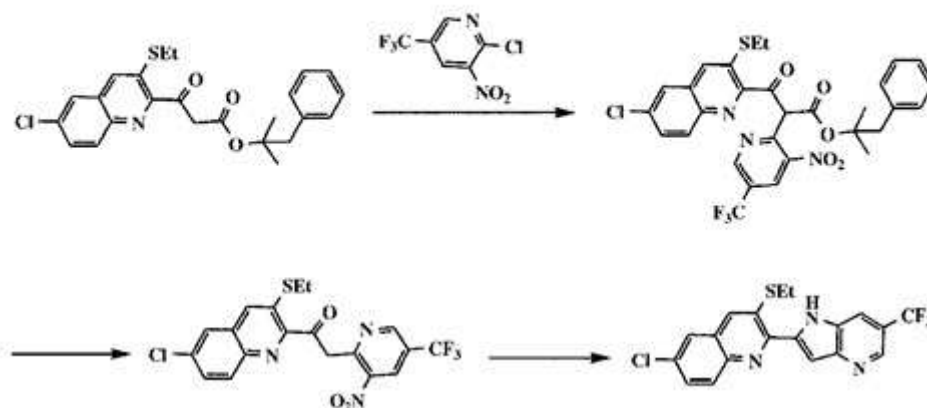


Se disolvió 1,1-dimetil-2-feniletéster de ácido acético (461 mg) en tetrahidrofurano (THF) (10 ml). En atmósfera de argón, la solución se enfrió en un baño de acetona seca y se añadió diisopropilamida de litio (solución 2,6 M en THF, 2,2 ml). Después de 15 minutos de agitación, el éster etílico del ácido 6-cloro-3-etiltio-quinolina-2-carboxílico (594 mg), que se sintetizó mediante el método descrito en el documento WO 2016/091731, fue añadido. Después de 1 hora de agitación, se añadió ácido clorhídrico 3 N y la mezcla se calentó a temperatura ambiente. Se añadieron agua y acetato de etilo a la mezcla de reacción y se realizó la extracción. La fase orgánica se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 1,1-dimetil-2-feniletéster de ácido 3-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-3-oxi-propiónico (849 mg).

Ejemplo de referencia 2

Método de producción de 2-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirroló[3,2-b]piridina

[Quím. 10]



Se disolvió 1,1-dimetil-2-feniletéster de ácido 3-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-3-oxi-propiónico (750 mg) en dimetilformamida (DMF) (5 ml), y se añadió hidruro de sodio (136 mg) enfriando con hielo. Después de 30 minutos de agitación, se añadió 2-cloro-3-nitro-5-trifluorometilpiridina (462 mg) y la mezcla se agitó durante 2 horas. A la mezcla de reacción se añadieron sucesivamente agua, ácido clorhídrico 3 N y acetato de etilo y se realizó la extracción. La fase orgánica se concentró, se añadió ácido trifluoroacético (5 ml) al residuo y la mezcla se agitó a 50°C durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió polvo de hierro (500 mg) y la mezcla se agitó a 80°C durante 2 horas. A la mezcla de reacción se añadieron agua y acetato de etilo y la mezcla se filtró a través de Celite. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo y la fase orgánica se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 2-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirroló[3,2-b]piridina (446 mg).

Ejemplo 1

Método de producción de 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirroló[3,2-b]piridina (compuesto número 2-41)

[Quím. 11]



Se disolvió 2-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirroló[3,2-b]piridina (250 mg) en THF (2 ml) y se añadieron N,N-dimetilaminopiridina (10 mg) y dicarbonato de di-terc-butilo (158 mg). Después de 30 minutos de agitación, la mezcla de reacción se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirroló[3,2-b]piridina.

b]piridina (244 mg).

Ejemplo 2

Método de producción de 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (compuesto número 2-42)

[Quím. 12]

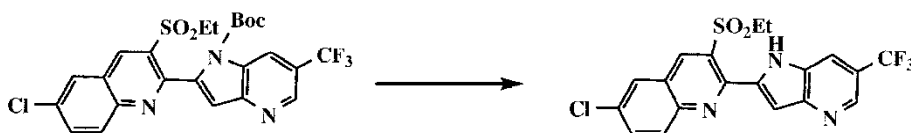


Se disolvió 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(6-cloro-3-etiltio-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (233 mg) en acetato de etilo (10 ml). A esto se añadió ácido metacloroperbenzoico (233 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos. La mezcla de reacción se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (149 mg).

Ejemplo 3

Método de producción de trifluoroacetato de 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (compuesto número 4-3)

[Chem. 13]



Se disolvió 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (135 mg) en ácido trifluoroacético (2 ml), y la solución se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, trifluoroacetato de 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (144 mg).

Ejemplo 4

Método de producción de 3-cloro-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (compuesto número 1-44)

[Quím. 14]



Se disolvió trifluoroacetato de 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (134 mg) en acetonitrilo (5 ml) y DMF (1 ml). A esto se le añadió cloruro de sulfurilo (1 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos. A la mezcla de reacción se añadieron una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y una solución acuosa saturada de tiosulfato de sodio y la mezcla se agitó durante 30 minutos. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo y la fase orgánica se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 3-cloro-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (104 mg).

Ejemplo 5

Método de producción de 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (compuesto número 1-3)

[Quím. 15]

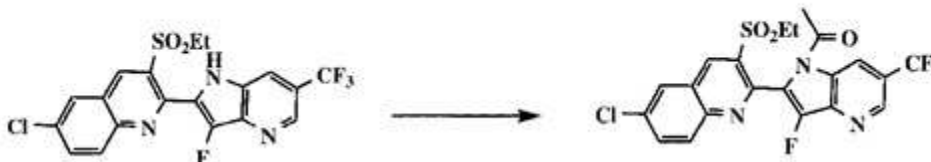


Se disolvió 3-cloro-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (74 mg) en acetonitrilo (5 ml). A esto, se añadieron bicarbonato de sodio (40 mg) y Selectfluor (160 mg), y la mezcla se agitó a 60°C durante 1 hora. Se añadió a la mezcla de reacción una solución acuosa saturada de tiosulfato de sodio y la mezcla se agitó durante 10 minutos y luego se dejó enfriar a temperatura ambiente. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo y la fase orgánica se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (25 mg).

Ejemplo 6

Método de producción de 1-acetil-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (compuesto número 2-1)

[Quím. 16]

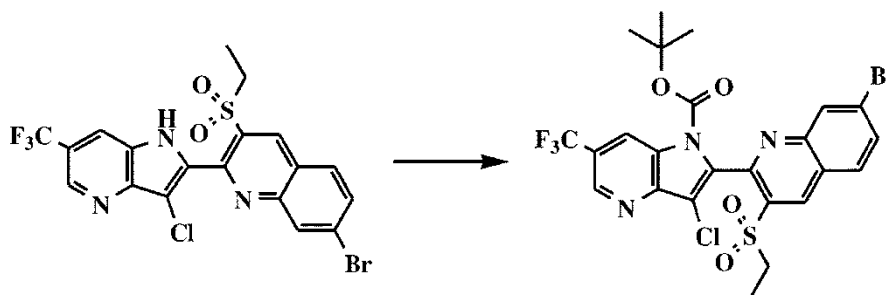


Se disolvió 2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (16 mg) en THF (2 ml). A esto se añadieron anhídrido acético (0,3 ml) y N,N-dimetilaminopiridina (50 mg), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos. La mezcla de reacción se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 1-acetil-2-(6-cloro-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (18 mg).

Ejemplo 7

Método de producción de 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-bromo-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (compuesto número 2-61)

[Quím. 17]

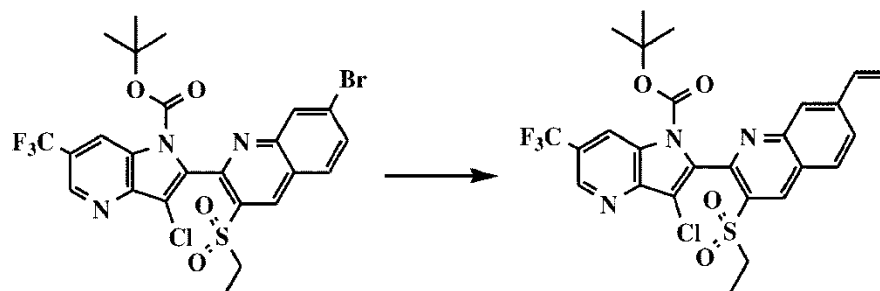


A una solución en THF (0,4 ml) de 2-(6-bromo-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (62 mg, 0,12 mmoles), se añadieron dicarbonato de di-terc-butilo (25 mg, 0,12 mmoles) y DMAP (14 mg, 0,12 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una vez completada la reacción, se añadió agua y se realizó la extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica lavada se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se evaporó al vacío. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (73 mg, 99%).

Ejemplo 8

Método de producción de 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-vinil-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (compuesto número 2-98)

[Quím. 18]

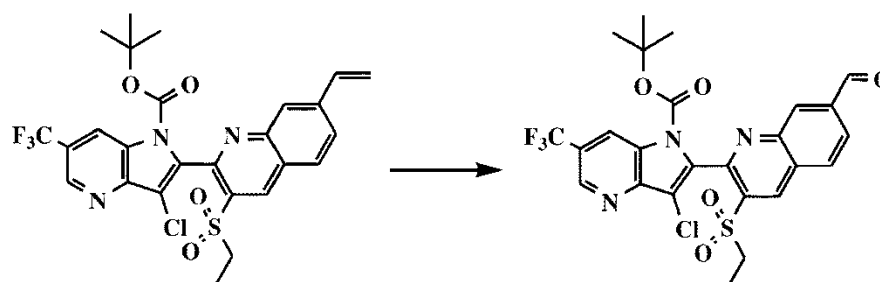


A 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-bromo-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (73 mg, 0,12 mmoles), tolueno (1,2 ml), agua (0,3 ml), viniltrifluoroborato de potasio (32 mg, 0,24 mmoles), un complejo de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio con acetona (18 mg, 0,024 mmoles) y fosfato de potasio (51 mg, 0,24 mmoles) y la mezcla se agitó a 90°C durante 3 horas. Se añadió gel de sílice a la mezcla de reacción y se realizó una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (68 mg, 96%).

Ejemplo 9

Método de producción de 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-formil-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (número compuesto 2-97)

[Quím. 19]

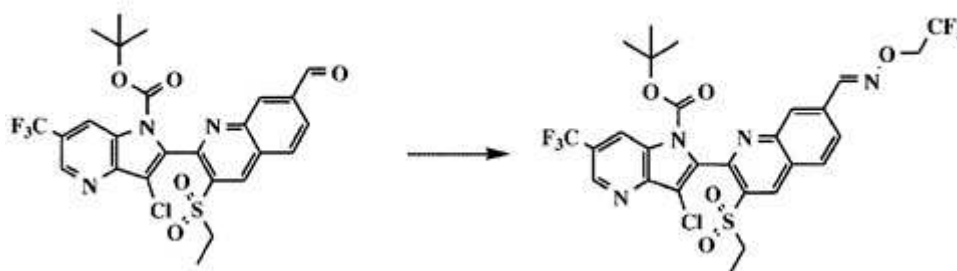


A 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-vinil-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (68 mg, 0,12 mmoles), se añadieron THF (0,6 mL), agua (0,3 mL), óxido de N-metilmorfolina (78 mg, 0,61 mmoles) y tetróxido de osmio (solución 0,04 M en t-BuOH, 0,2 mL, 0,06 mmoles) y se la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de confirmar por TLC el progreso exitoso de la reacción, se añadió peryodato de sodio (99 mg, 0,46 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una vez completada la reacción, se añadió una solución acuosa de tiosulfato de sodio y se realizó la extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica lavada se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se evaporó al vacío. El residuo se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (47 mg, 67%).

Ejemplo 9

Método de producción de 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-(2,2,2-trifluoroetoxiimino)-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (compuesto número 1-105)

[Quím. 20]



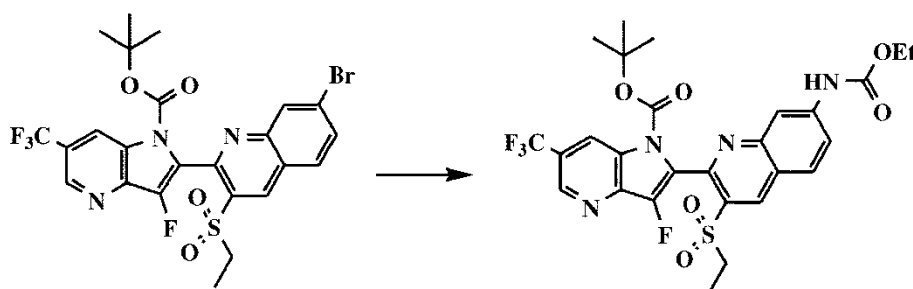
A 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-formil-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (47 mg,

0,09 mmoles), se añadieron cloroformo (0,8 ml), clorhidrato de trifluoroetilhidroxiamina (22 mg, 0,14 mmoles) y piridina (11 mg, 0,14 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una vez completada la reacción, se añadió una solución acuosa de cloruro de amonio y se realizó la extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica lavada se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se evaporó al vacío. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (45 mg, 76%).

Ejemplo 9

Método de producción de 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-etoxicarbonilamino-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (compuesto número 2-49)

[Quím. 21]

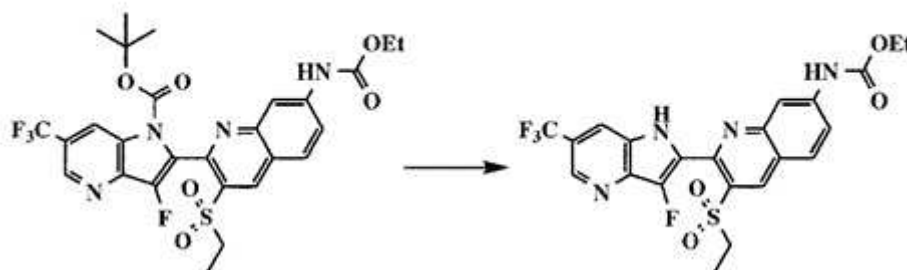


Se disolvió 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-bromo-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (79 mg, 0,13 mmoles) en tolueno (1,3 ml). A esto, se añadieron carbamato de etilo (23 mg, 0,03 mmoles), carbonato de cesio (85 mg, 0,26 mmoles), tris(dibencilidenacetona)dipaladio (12 mg, 0,01 mmoles) y Xantfos (17 mg, 0,03 mmoles), y la mezcla se agitó a 90°C bajo una atmósfera de argón durante 2 horas. La mezcla de reacción se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (69 mg, 87%).

Ejemplo 10

Método de producción de 2-(7-etoxicarbonilamino-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (compuesto número 1-13)

[Quím. 22]

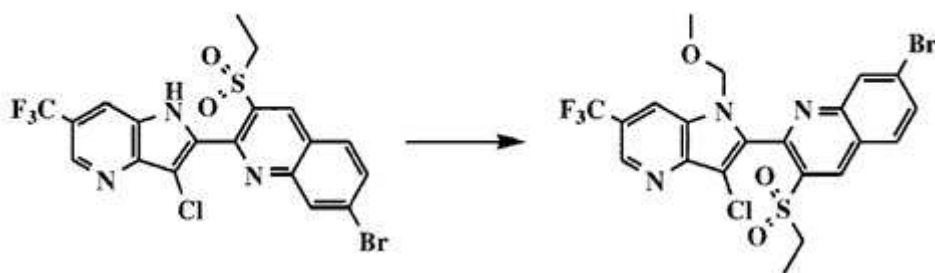


Se disolvió 1-(terc-butoxicarbonil)-2-(7-etoxicarbonilamino-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-fluoro-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (69 mg, 0,11 mmoles) en ácido trifluoroacético (0,4 ml) y la solución se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (21 mg, 38%).

Ejemplo 11

Método de producción de 1-metoximetil-2-(7-bromo-3-etilsulfonil-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrollo[3,2-b]piridina (compuesto número 2-65)

[Quím. 23]



A una solución en DMF (0,6 ml) de 2-(7-bromo-3-etilsulfonyl-quinolin-2-il)-3-cloro-6-trifluorometil-1H-pirrol[3,2-b]piridina (30 mg, 0,06 mmoles), se añadieron clorometilmetiléter (6,0 mg, 0,07 mmoles) y carbonato de cesio (30 mg, 0,09 mmoles), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Una vez completada la reacción, se añadió agua y se realizó la extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica lavada se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se evaporó al vacío. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado (16 mg, 47%).

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

Ejemplo de formulación 1

Compuesto de la presente invención	10 partes
xileno	70 partes
N-metilpirrolidona	10 partes
Mezcla de polioxietilen-nonilfeniléter y alquilbencenosulfonato de calcio	10 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan uniformemente para su disolución para dar una formulación concentrada emulsionable.

Ejemplo de formulación 2

Compuesto de la presente invención	3 partes
polvo de arcilla	82 partes
polvo de diatomeas	15 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan uniformemente y luego se pulverizan para dar una formulación en polvo.

Ejemplo de formulación 3

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

Los ingredientes anteriores se mezclan uniformemente. Después de la adición de un volumen apropiado de agua, la mezcla se amasa, se granula y se seca para dar una formulación granular.

Ejemplo de formulación 4

Compuesto de la presente invención	20 partes
------------------------------------	-----------

Caolín y ácido silícico sintético de alta dispersión

75 partes

Mezcla de polioxitilen-nonifeniléter y alquilbencenosulfonato de calcio

5 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan uniformemente y luego se pulverizan para dar una formulación en polvo humectable.

A continuación, se muestran ejemplos de prueba en relación con la presente invención, pero la presente invención no se limita a ellos.

Ejemplo de prueba 1

Prueba para la eficacia de control en *Myzus persicae*

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

[Mat. 1]

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

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

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

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

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

Criterios

A: la tasa de control es del 100%.

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

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

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

Como resultado, los compuestos 1-3, 1-6, 1-7, 1-8, 1-11, 1-13, 1-44, 1-47, 1-48, 1-48, 1-50, 1-52, 1-105, 2-1, 2-11, 2-21, 2-31, 2-32, 2-41, 2-42, 2-43, 2-44, 2-45, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-65, 2-71, 2-76, 2-90, 2-97, 2-98, 2-104, 2-105, 3-1, 3-2, 4-1, 4-2, 4-3, 4-4, 4-5, 4-6, 4-7, 4-8, 4-9, 4-10 y 5-1 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Ejemplo de prueba 2

Prueba insecticida en *Laodelphax striatellus*

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

[Mat. 2]

Tasa de mortalidad corregida (%)

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

Tasa de mortalidad corregida

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

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

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

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

10 Como resultado, los compuestos 1-3, 1-6, 1-7, 1-8, 1-11, 1-13, 1-44, 1-47, 1-48, 1-48, 1-50, 1-52, 1-105, 2-1, 2-11, 2-21, 2-31, 2-32, 2-41, 2-42, 2-43, 2-44, 2-45, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-65, 2-71, 2-76, 2-90, 2-97, 2-98, 2-104, 2-105, 3-1, 3-2, 4-1, 4-2, 4-3, 4-4, 4-5, 4-6, 4-7, 4-8, 4-9, 4-10 y 5-1 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Ejemplo de prueba 3

Prueba insecticida en *Plutella xylostella*

15 Adultos de *Plutella xylostella* se liberaron en plántulas de col china y se les permitió poner huevos en ellas. Dos días después de la liberación de los adultos, las plántulas de col china con huevos puestos se sumergieron durante aproximadamente 30 segundos en dispersiones agroquímicas diluidas a 500 ppm, cada una de las cuales contenía un compuesto heterocíclico condensado diferente representado por la fórmula general (1) de la presente invención como ingrediente activo. Después del secado al aire, las plántulas se mantuvieron en una cámara termostática a 25°C. Seis días después del tratamiento de inmersión, se contó el número de larvas incubadas por maceta, se calculó la

20 tasa de mortalidad según la fórmula que se muestra a continuación y se evaluó la eficacia insecticida según los criterios del Ejemplo de prueba 2. Esta prueba se realizó por triplicado usando 10 adultos de *Plutella xylostella* por maceta.

[Mat. 3]

Tasa de mortalidad corregida (%)

$$= 100 \times (\text{Número de larvas incubadas en una maceta sin tratamiento} - \text{Número de larvas incubadas en una maceta de tratamiento}) / \text{Número de larvas incubadas en una maceta sin tratamiento}$$

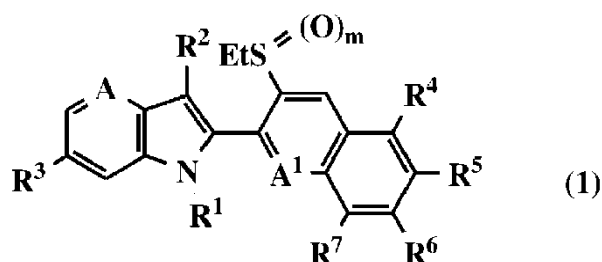
25 Como resultado, los compuestos 1-3, 1-6, 1-7, 1-8, 1-11, 1-13, 1-44, 1-47, 1-48, 1-48, 1-50, 1-52, 1-105, 2-1, 2-11, 2-21, 2-31, 2-32, 2-41, 2-42, 2-43, 2-44, 2-45, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-65, 2-71, 2-76, 2-90, 2-97, 2-98, 2-104, 2-105, 3-1, 3-2, 4-1, 4-2, 4-3, 4-4, 4-5, 4-6, 4-7, 4-8, 4-9, 4-10 y 5-1 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Aplicabilidad industrial

Los compuestos de la presente invención son altamente eficaces para el control de una amplia gama de plagas agrícolas y hortícolas y, por tanto, son útiles.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrólo representado por la fórmula general (1):



{en el que

5 R¹ representa

- (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a4) un grupo alquenoilo (C₂-C₆);
- (a5) un grupo alquinoilo (C₂-C₆);
- 10 (a6) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alcoxicarbonilo (C₁-C₆);
- (a10) un grupo alquiltio (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- 15 (a11) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a12) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a13) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² representa

- 20 (b1) un átomo de hidrógeno; o
- (b2) un átomo de halógeno,

R³ representa

- (c9) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R⁴ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

- 25 (d1) un átomo de hidrógeno; o
- (d2) un átomo de halógeno,

R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

- (e1) un átomo de hidrógeno;
- (e2) un átomo de halógeno;
- 30 (e3) un grupo ciano;
- (e5) un grupo formilo;
- (e6) a grupo alquilo (C₁-C₆);

- (e7) a grupo alqueno (C₂-C₆);
- (e8) a grupo alquino (C₂-C₆);
- (e9) a grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (e10) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- 5 (e11) un grupo R⁸(R⁹)N (en el que R⁸ y R⁹ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆), o un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆));
- (e12) un grupo R⁸(R⁹)N carbonilo (en el que R⁸ y R⁹ son como se definen anteriormente);
- (e13) un grupo carboxilo;
- 10 (e14) un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);
- (e15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (e16) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
- (e17) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
- (e19) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
- 15 (e21) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
- (e24) un grupo arilo;
- (e26) un grupo heterocíclico;
- (e28) un grupo hidroxialquilo (C₁-C₆);
- (e29) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- 20 (e30) CH=NOR¹¹ (en el que R¹¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁-C₆), un grupo haloalquilo (C₁-C₆), un grupo alquiltio (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆), un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆), o un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆));
- (e31) CH=NN(R¹¹)₂ (en el que R¹¹s pueden ser iguales o diferentes, y son como se definen anteriormente); o
- (e32) N=S(O)(R¹¹)₂ (en el que R¹¹s pueden ser iguales o diferentes, y son como se definen arriba),
- 25 A y A¹ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa un átomo de nitrógeno, un N-óxido), y m representa 0, 1 o 2}, un N-óxido del mismo o una sal del mismo.
2. El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrólo, el N-óxido o la sal del mismo según la reivindicación 1, en el que
- R¹ representa
- 30 (a1) un átomo de hidrógeno;
- (a2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a7) un grupo alcoxi (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a8) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆);
- (a9) un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);
- 35 (a10) un grupo alquiltio (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a11) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a12) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) alquilo (C₁-C₆);
- (a13) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆); o
- (a14) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno; o

(b2) un átomo de halógeno,

R³ representa (c9) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

5 R⁴ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

(d1) un átomo de hidrógeno; o

(d2) un átomo de halógeno,

R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

(e1) un átomo de hidrógeno;

10 (e2) un átomo de halógeno;

(e3) un grupo ciano;

(e5) un grupo formilo;

(e6) un grupo alquilo (C₁-C₆);

(e9) un grupo alcoxi (C₁-C₆);

15 (e10) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);

(e15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o

(e26) un grupo heterocíclico.

3. El compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol, el N-óxido o la sal del mismo según la reivindicación 1, en el que

20 R¹ representa

(a1) un átomo de hidrógeno;

(a8) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆); o

(a9) un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆),

R² representa

25 (b1) un átomo de hidrógeno; o

(b2) un átomo de halógeno,

R³ representa (c9) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R⁴ y R⁷ cada uno representa (d1) un átomo de hidrógeno,

R⁵ y R⁶ pueden ser iguales o diferentes, y cada uno representa

30 (e1) un átomo de hidrógeno;

(e2) un átomo de halógeno;

(e10) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o

(e15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆).

35 4. Uso del compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol, el N-óxido o la sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 como insecticida agrícola u hortícola.

5. Un método para usar un insecticida agrícola u hortícola, que comprende tratar las plantas o el suelo con un ingrediente activo del insecticida agrícola u hortícola según se especifica en la reivindicación 4.

6. Un método para controlar plagas agrícolas u hortícolas, que comprende tratar las plantas o el suelo con una

cantidad eficaz del insecticida agrícola u hortícola según se especifica en la reivindicación 4.

7. Un agente de control de ectoparásitos animales que comprende el compuesto heterocíclico condensado con 1H-pirrol, el N-óxido o la sal del mismo según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 como ingrediente activo.
 8. Un agente de control de ectoparásitos animales según la reivindicación 7 para el uso en un método para controlar ectoparásitos animales.
- 5