



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 356 640**

51 Int. Cl.:

C07D 401/04 (2006.01) **A01N 43/56** (2006.01)

A61K 31/4439 (2006.01) **A61P 33/02** (2006.01)

A61P 33/06 (2006.01) **A61P 33/10** (2006.01)

A61P 33/12 (2006.01) **A61P 33/14** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05710251 .9**

96 Fecha de presentación : **16.02.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1717237**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **02.11.2006**

54

Título: **Antranilamida, procedimiento para la producción de las mismas y agentes antiparasitarios que contienen la misma.**

30

Prioridad: **18.02.2004 JP 2004-41295**
28.04.2004 JP 2004-133722
08.09.2004 JP 2004-261507
08.10.2004 JP 2004-295778

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
11.04.2011

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
11.04.2011

73

Titular/es: **ISHIHARA SANGYO KAISHA, Ltd.**
3-15, Edobori 1-chome
Nishi-ku, Osaka-shi, Osaka 550-0002, JP

72

Inventor/es: **Koyanagi, Toru;**
Morita, Masayuki;
Nakamoto, Kenichi y
Hisamatsu, Akihiro

74

Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 356 640 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

CAMPO TÉCNICO

5 [0001] Los documentos de patente 1, 2, 3 y 4, respectivamente, describen compuestos de antranilamida que tienen determinadas estructuras químicas específicas. No obstante, en ninguna parte de dichos documentos de patente se describen compuestos que tengan un alquilo sustituido por un cicloalquilo de C₃-C₄ como sustituyente correspondiente a A en la fórmula (I) que se representa a continuación en la presente invención.

10 [0002] Asimismo, en el documento de patente 5 se describen compuestos de antranilamida que tienen un grupo ciano en la posición 4 del anillo de benceno. No obstante, en la definición de R¹ de la fórmula (I) que se representa a continuación de la presente invención, no está contenido un grupo ciano, y las estructuras químicas correspondientes son diferentes.

Documento de patente 1: Publicación internacional WO03/24222

Documento de patente 2: Publicación internacional WO03/15518

Documento de patente 3: Publicación internacional WO03/15519

Documento de patente 4: Publicación internacional WO01/70671

15 Documento de patente 5: Publicación internacional

DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

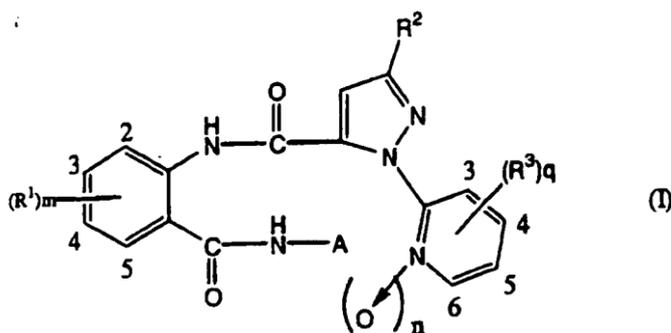
PROBLEMAS QUE SE RESUELVEN CON LA INVENCION

20 [0003] Durante muchos años, se han utilizado muchos plaguicidas, pero muchos de ellos conllevan diversos problemas, como por ejemplo que los efectos son inadecuados, su uso está restringido porque las plagas han adquirido resistencia, etc. Por consiguiente, es deseable desarrollar un nuevo plaguicida sustancialmente libre de estos problemas, como por ejemplo, un plaguicida capaz de controlar varias plagas que crean problemas en los campos de la agricultura y la horticultura y con el que se pueda controlar plagas parásitas en los animales.

MEDIOS PARA RESOLVER LOS PROBLEMAS

25 [0004] Los autores de la presente invención han llevado a cabo diversos estudios sobre compuestos de antranilamida en un esfuerzo por encontrar un plaguicida superior. Como resultado de ello, han observado que un nuevo compuesto de antranilamida o una sal del mismo tiene un efecto plaguicida extremadamente alto contra plagas a una dosis baja, y han completado la presente invención.

En concreto, la presente invención se refiere a un compuesto de antranilamida representado por la siguiente fórmula (I) o una sal del mismo:



30 en la que R¹ es un átomo de bromo sustituido en la posición 2- del anillo de benceno y un átomo de cloro sustituido en la posición 4- del anillo de benceno; cada R² es un átomo de bromo; R³ es un átomo de cloro sustituido en la posición 3- del anillo de piridina. A es -CH(Me)-Y; Y es ciclopropilo; m es 2; n es 0 ó 1; y q es 1; un proceso para su producción y un plaguicida que lo contiene.

EFFECTOS DE LA INVENCION

35 [0005] El plaguicida que contiene como ingrediente activo el nuevo compuesto de antranilamida representado por la fórmula (I) anterior posee un alto efecto plaguicida contra plagas a una dosis baja.

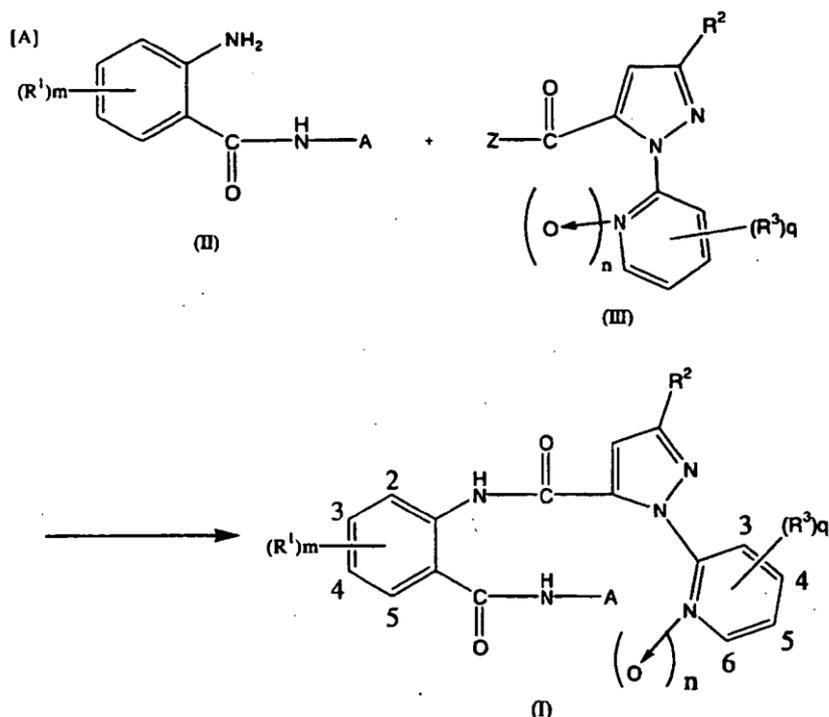
MEJOR MODO DE REALIZACION DE LA INVENCION

[0006] El número de sustituyentes Y en A es 1. El cicloalquilo de C₃ en Y está sin sustituir.

[0007] La sal del compuesto de antranilamida de la fórmula (I) anterior incluye todos los tipos, siempre y cuando sean aceptables agrícolamente. Por ejemplo, se pueden mencionar una sal de metal alcalino, como por ejemplo sal sódica o sal potásica; una sal de metal alcalinotérreo como sal de magnesio o una sal de calcio; una sal de amonio, como sal de dimetilamonio o una sal de trietilamonio, una sal de ácido inorgánico como por ejemplo un hidrocloreuro, un perclorato, un sulfato o un nitrato, o una sal de ácido orgánico, como por ejemplo un acetato o un metanosulfonato.

[0008] El compuesto de antranilamida de fórmula (I) puede tener isómeros ópticos o isómeros geométricos, y dichos isómeros y mezclas de los mismos quedan incluidos en la presente invención.

[0009] El compuesto de antranilamida de la fórmula (I) anterior, o su sal (en adelante denominado simplemente el compuesto de la presente invención) puede producirse a través de las siguientes reacciones (A) y (B) con arreglo a los métodos habituales para producir una sal.



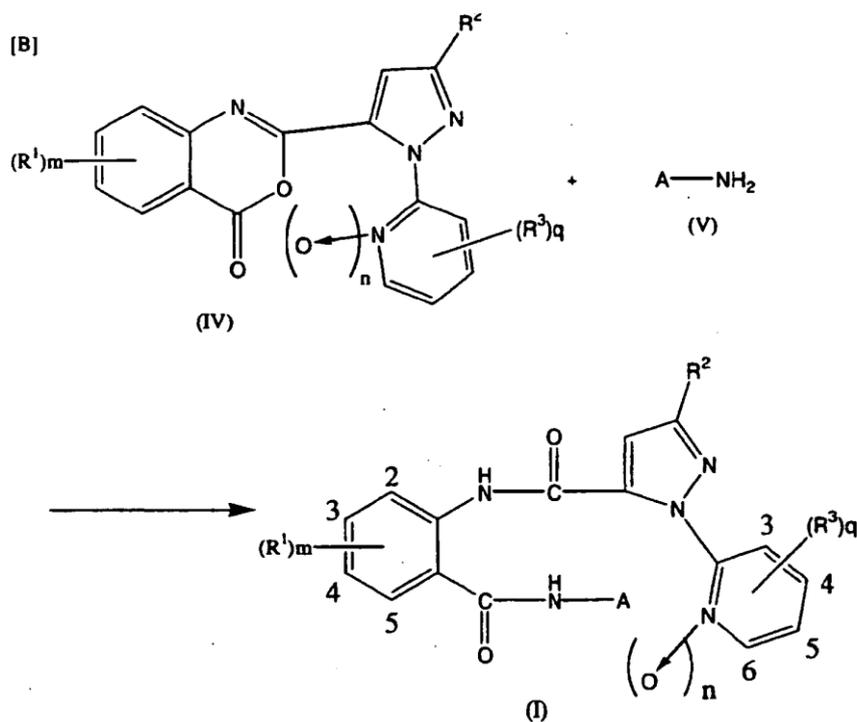
[0010] R^1 , R^2 , R^3 , A, m, n y q son como se han definido antes, y Z es un átomo de cloro, -OH o un alcoxi de C_1 - C_4 .

[0011] En el caso en el que Z sea cloro, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de una base.

[0012] Como base, se puede seleccionar adecuadamente uno o más tipos para su uso, como por ejemplo entre un hidróxido de metal alcalino, como hidróxido sódico o hidróxido potásico; un carbonato de metal alcalino, como carbonato sódico o carbonato potásico; un hidruro de metal alcalino como hidruro sódico o hidruro potásico; una amina terciaria como trimetilamina, trietilamina, triisopropilamina, diisopropilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina, 2,6-dimetilpiridina, 4-pirrolidinopiridina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, N-etil-N-metilalanilina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno o 1,4-diazabicyclo[2.2.2] octano. La base se puede utilizar en una cantidad comprendida entre 1 y 5 veces más por mol, preferiblemente entre 1 a 2,5 veces más por mol del compuesto de fórmula (II).

[0013] En el caso de que Z sea un átomo de cloro, la reacción (A) se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según lo requiera el caso. El disolvente puede consistir en cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más tipos de disolventes para su uso entre un éter como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano; un hidrocarburo halogenado como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano, tricloroetano o dicloroetileno; un hidrocarburo aromático como benceno, tolueno o xileno; un disolvente aprótico polar como acetonitrilo, propionitrilo, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, triamida hexametilfosfórica, sulfolano, dimetilacetamida o N-metilpirrolidona; un éster como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo; y una cetona como acetona, dietil cetona, metil etil cetona o metil isobutil cetona.

- 5 [0014] En el caso en el que Z sea un átomo de cloro, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente a entre -20 y +60°C, preferiblemente a entre 0 y 30°C. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 1 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 2 y 12 horas.
- 5 [0015] En el caso en el que Z sea -OH, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de un agente de deshidratación condensación y un disolvente.
- 10 [0016] El agente de deshidratación condensación puede consistir por ejemplo en una carbodimida, como N,N'-diciclohexilcarbodimida, 1,3-diisopropilcarbodiimida, o hidrocloreto de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida, u otros como 1,1'-carbonil-bis-1H-imidazol, diclorofosfato de fenilo, fosforocianidato de dietilo, 1,3,5-triaza-2,4,6-trifosforin-2,2,4,4,6,6-hexacloruro, cloruro cianúrico, cloroformato de isobutilo, isocianato de clorosulfonilo o anhídrido trifluoroacético.
- 15 [0017] El disolvente puede consistir en cualquier disolvente siempre y cuando sea inerte para la reacción. Por ejemplo, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más tipos para su uso entre un éter como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano; un hidrocarburo halogenado como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano, tricloroetano o dicloroetileno; un hidrocarburo aromático como benceno, tolueno o xileno; un disolvente aprótico dipolar como acetonitrilo, propionitrilo, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, triamida hexametilfosfórica, sulfolano, dimetilacetamida o N-metilpirrolidona; un éster como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo; una cetona como acetona, dietil cetona, metil etil cetona o metil isobutil cetona; un hidrocarburo alifático como pentano, hexano, heptano, octano o ciclohexano.
- 20 [0018] En el caso de que Z sea -OH, se puede llevar a cabo la reacción (A) normalmente a entre -20 y +60°C, preferiblemente entre 0 y 30°C. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 12 horas.
- 25 [0019] En el caso de que Z sea alcoxi de C₁-C₄, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de una base y un disolvente. Como base, se puede seleccionar adecuadamente una o más tipos para su uso por ejemplo entre un hidruro de metal alcalino como hidruro sódico o hidruro potásico; un alcóxido de metal alcalino como metóxido sódico, etóxido sódico o terc-butóxido potásico; y una amina terciaria como trimetilamina, trietilamina, triisopropilamina, diisopropiletilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina, 2,6-dimetilpiridina, 4-pirrolidinopiridina, N-metil morfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, N-etil-N-metilanilina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno o 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano. La base se puede utilizar en una cantidad comprendida entre 1 y 5 veces más por mol, preferiblemente entre 1 y 2,5 veces más por mol del compuesto de fórmula (II).
- 30 [0020] El disolvente puede consistir en cualquier disolvente siempre y cuando sea inerte para la reacción. Por ejemplo, se puede seleccionar adecuadamente uno o más tipos para su uso entre un éter como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano; un hidrocarburo aromático como benceno, tolueno o xileno; un disolvente aprótico polar como acetonitrilo, propionitrilo, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, triamida hexametilfosfórica, sulfolano, dimetilacetamida o N-metilpirrolidona y un alcohol como metanol, etanol, propanol, n-butanol o terc-butanol.
- 35 [0021] En el caso en el que Z sea alcoxi de C₁-C₄, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente a entre 0 y 120°C, preferiblemente entre 20 y 80°C. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 12 horas.
- 40 [0022] El compuesto de la fórmula (II) o (III) anteriores puede consistir en un compuesto conocido o se puede producir con arreglo a los materiales de referencia conocidos. Por ejemplo, se puede producir el compuesto de fórmula (II) a través o de acuerdo con el método descrito en Synthesis, 1980, p. 505. El compuesto de fórmula (III) puede producirse a través, o con arreglo al método descrito en los esquemas 9 a 22 de WO 03/24222.



[0023] R¹, R², R³, A, m, n y q son como se han definido antes.

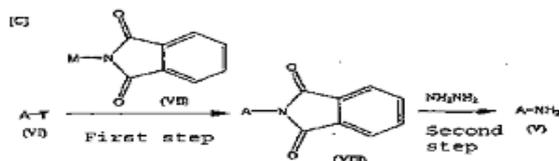
[0024] La reacción (B) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de un disolvente.

5 [0025] El disolvente puede consistir en cualquier disolvente siempre y cuando sea inerte para la reacción. Por ejemplo, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más tipos de disolvente para su uso entre un éter como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano; un hidrocarburo halogenado como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano, tricloroetano o dicloroetileno; un hidrocarburo aromático como benceno, tolueno o xileno; y un disolvente aprótico dipolar como acetonitrilo, propionitrilo, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, triamida hexametilfosfórica, sulfolano, dimetilacetamida, o N-metilpirrolidona.

10 [0026] La reacción (B) se puede llevar a cabo normalmente a entre 0 y 120°C, preferiblemente entre 20 y 80°C. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 12 horas.

15 [0027] El compuesto de la fórmula (IV) anterior puede consistir en un compuesto conocido o puede producirse con arreglo al material de referencia conocido. Por ejemplo, se puede producir el compuesto de fórmula (IV) a través de o de acuerdo con el método descrito en Org. Prep. Proceed Int. 1993, vol. 25 p. 585 o el método descrito en los esquemas 8 a 10 en WO03/24222.

[0028] El compuesto de la fórmula (V) anterior incluye un compuesto nuevo. Dicho compuesto se puede producir a través del método de Gabriel, y se puede producir por ejemplo con arreglo a la siguiente reacción (C):



20

[0029] En la reacción (C), A se define como anteriormente y T es un halógeno, -OSO₂G (G es un radical sulfonato) o -OH. Cuando T es halógeno u -OSO₂G, M es sodio o potasio, y cuando T es -OH, M es un átomo de hidrógeno. El

radical sulfonato mencionado puede consistir por ejemplo en un alquilo de C₁-C₆, como metilo o etilo, o fenilo que puede estar sustituido con un alquilo de C₁-C₆.

[0030] En el caso en el que T sea halógeno u –OSO₂G y M sea sodio o potasio, la primera etapa de la reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de un disolvente.

5 **[0031]** El disolvente puede consistir en cualquier disolvente siempre y cuando sea inerte para la reacción. Por ejemplo, se puede seleccionar adecuadamente uno o más tipos para su uso, como por ejemplo éter como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano, un hidrocarburo aromático, como benceno, tolueno o xileno; un disolvente aprótico dipolar, como acetonitrilo, propionitrilo, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, triamida hexametilfosfórica, sulfolano, dimetilacetamida o N-metilpirrolidona; y un alcohol como metanol, etanol, propanol, n-butanol o terc-butanol.

10 **[0032]** En el caso en el que T sea halógeno u –OSO₂G y M sea sodio o potasio, la primera etapa de la reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente a entre 0 y 150°C, preferiblemente entre 30 y 110°C. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 12 horas.

15 **[0033]** En el caso en el que T sea –OH y M sea un átomo de hidrógeno, la primera etapa de la reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente a través del método de Mitsunobu. Por ejemplo, se puede llevar a cabo utilizando un azo dicarboxilato de dialquilo y trifenílfosfina en presencia de un disolvente. Cada uno de dichos azo dicarboxilato de dialquilo y trifenílfosfina se pueden utilizar normalmente en una cantidad aproximadamente equimolar a la del compuesto de fórmula (VI). El azo dicarboxilato de dialquilo mencionado puede consistir por ejemplo en azo dicarboxilato de dietilo o azo dicarboxilato de diisopropilo.

20 **[0034]** El disolvente puede consistir en cualquier disolvente siempre y cuando sea inerte para la reacción. Por ejemplo, se puede seleccionar adecuadamente uno o más tipos para su uso entre éteres como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano; un hidrocarburo halogenado como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano, tricloroetano o dicloroetileno; un hidrocarburo aromático como benceno, tolueno o xileno.

25 **[0035]** En el caso en el que T sea –OH y M un átomo de hidrógeno, la primera etapa de reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente a una temperatura comprendida entre 0 y 80°C, preferiblemente entre 20 y 60°C. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 16 horas.

30 **[0036]** La segunda etapa de la reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente por descomposición del compuesto de fórmula (VIII) por medio de hidrazina en presencia de un disolvente. Dicha hidrazina puede utilizarse en una cantidad aproximadamente equimolar a la del compuesto de fórmula (VIII).

35 **[0037]** El disolvente puede consistir en cualquier disolvente siempre y cuando sea inerte para la reacción. Por ejemplo, se puede seleccionar adecuadamente uno o más tipos para su uso entre un éter como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano; un hidrocarburo aromático como benceno, tolueno o xileno; y un alcohol como metanol, etanol, propanol, n-butanol o terc-butanol.

[0038] La segunda etapa de reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente a entre 0 y 140°C, preferiblemente entre 30 y 100°C. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 2 y 12 horas.

40 **[0039]** A continuación, se describirán los modos de realización preferibles de los plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención. Los plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente útiles por ejemplo, como agentes para controlar diversas plagas que pueden llegar a ser problemáticas en los campos agrícola y hortícola, es decir, plaguicidas agrícolas y hortícolas, o como agentes para controlar plagas que son parásitos en los animales, es decir, plaguicidas contra parásitos en animales.

45 **[0040]** Los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención son útiles como insecticidas, acaricidas, nematocidas y plaguicidas para el suelo, y resultan efectivos para controlar ácaros parásitos de las plantas, como arañuela roja (*Tetranychus urticae*), arañuela carmín (*Tetranychus cinnabarinus*), araña Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi*), ácaro ancho (*Polyphagotarsonemus latus*), ácaro de la roña de cítricos rosa (*Aculops pelekassi*), ácaro del bulbo (*Rhizoglyphus echinopus*), plagas de insectos agrícolas como palomilla dorso de diamante (*Plutella xylostella*), noctuido de la col (*Mamestra brassicae*), gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*), piral del manzano (*Laspeyresia pomonella*), gusano bellotero (*Heliothis zea*), gusano tabacalero (*Heliothis virescens*), palomilla gitana (*Lymantria dispar*), gusano doblador de hojas (*Cnaphalocrocis medinalis*), *Adoxophyes sp.* tortrix de frutas de hueso (*Adoxophyes orana fasciata*), polilla del melocotón (*Carposina niponensis*), polilla oriental del melocotonero (*Grapholita molesta*), gusano cortador (*Agrotis ipsilon*), gusano gris (*Agrotis segetum*), escarabajo rayado de la papa (*Leptinotarsa decemlineata*), escarabajo de las hojas (*Aulacophora femoralis*), picudo del algodónero (*Anthonomus grandis*), pulgones, saltamontes, grillos, chinches, moscas blancas, trips, langostas, moscas antromilidas, escarabajos, hormigas, barrenadores; nematodos parásitos de las plantas, como los nematodos de la raíz,

5 nematodos de quiste, nematodos que atacan las raíces, nematodos del arroz blanco (*Aphelenchoides besseyi*),
 nematodo de la fresa (*Nothotylenchus acris*), nematodo del pino (*Bursaphelenchus lignicolus*), gastrópodos como
 babosas y caracoles; plagas del suelo como isópodos como bicho bolita (*Armadilidium vulgare*), y bichos bola
 10 (*Portcellio scaber*), plagas de insectos higiénicas como ácaro de las ratas tropical (*Ornithonyssus bacoti*), mosca
 común (*Musca domestica*), mosquito común (*Culex pipiens*), y cucarachas; plagas de insectos del grano
 almacenado como palomita de los cereales (*Sitotroga cerealella*), gorgojo sureño del frijol (*Callosobruchus*
chinensis), gorgojo castaño de la harina (*Tribolium castaneum*) y gusanos de la harina; polillas, plagas domésticas y
 plagas de insectos de la casa, como polillas de las maletas (*Tinea pellionella*), escarabajo de las alfombras
 15 (*Anthrenus scrophularidae*) y termitas subterráneas; ácaros domésticos como ácaro del moho (*Tyrophagus*
putrescentiae), *Dermatophagoides farinae* y *Chelacaropsis moorei*. Entre ellos los plaguicidas agrícolas y hortícolas
 que contienen los compuestos de la presente invención resultan particularmente efectivos para controlar los ácaros
 parásitos de las plantas, plagas de insectos agrícolas, nematodos parásitos de las plantas y similares. Asimismo,
 son efectivos contra plagas de insectos que han adquirido resistencia contra organofósforo, insecticidas piretroides
 sintéticos y/o de carbamato. Asimismo, los compuestos de la presente invención presentan excelentes propiedades
 20 sistémicas, y a través de la aplicación de los compuestos de la presente invención para el tratamiento del suelo, no
 solamente se pueden controlar insectos nocivos, ácaros nocivos, nematodos nocivos, gastrópodos nocivos e
 isópodos nocivos en el suelo, sino también plagas de las hojas.

20 **[0041]** Otros modos de realización preferibles de plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención
 pueden ser plaguicidas agrícolas u hortícolas con los que se controlan de forma colectiva los ácaros parásitos de las
 plantas, las plagas de insectos agrícolas, los nematodos parásitos de las plantas, gastrópodos y plagas del suelo
 que se han mencionado antes.

25 **[0042]** El plaguicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención se formula
 normalmente mezclando el compuesto con varios adyuvantes agrícolas y se utiliza en forma de una formulación
 como, por ejemplo, polvos, granulados, granulados dispersables en agua, polvos humectables, concentrados en
 suspensión de base acuosa, concentrados en suspensión de base oleosa, granulados solubles en agua,
 30 concentrados emulsionables, concentrados solubles, pastas, aerosoles o una formulación de volumen ultra bajo. No
 obstante, siempre y cuando sea adecuado para los fines de la presente invención, puede formularse en cualquier
 tipo de formulación que se utilice comúnmente en este campo. Dichos adyuvantes agrícolas incluyen vehículos
 sólidos como tierra de diatomeas, cal muerta, carbonato cálcico, talco, carbón blanco, caolín, bentonita, una mezcla
 35 de caolinita y sericita, arcilla, carbonato sódico, bicarbonato sódico, mirabilita, zeolita y almidón; disolventes como
 agua, tolueno, xileno, nafta disolvente, dioxano, acetona, isoforona, metil isobutil cetona, clorobenceno, ciclohexano,
 dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona y alcohol; agentes de extensión y
 tensioactivos aniónicos como sal de ácido graso, benzoato, alquilsulfosuccinato, dialquilsulfosuccinato,
 policarboxilato, sal de éster de ácido alquilsulfúrico, sulfato de alquilo, sulfato de alquilarilo, sulfato de éter alquil
 40 diglicólico, sal de éster de ácido sulfúrico de alcohol, sulfonato de alquilo, sulfonato de alquilarilo, sulfonato de arilo,
 lignin sulfonato, disulfonato de éter alquildifenílico, sulfonato de poliestireno, sal de éster de ácido alquifosfórico,
 fosfato alquilarílico, fosfato de estirilarilo, sal de éster de ácido sulfúrico de éter de polioxietilen alquilo, sulfato de éter
 de polioxietilen alquil arilo, sal de éster de ácido sulfúrico de éter polioxietilen alquilarílico, fosfato de éter de
 polioxietilen alquilo, sal de éster de ácido fosfórico de éter polioxietilen alquil arílico, y una sal de condensado de
 45 sulfonato de naftaleno con formalina; agentes de extensión y tensioactivos no iónicos como éster de ácido graso de
 sorbitano, éster de ácido graso de glicerina, poliglicérido de ácido graso, éter poliglicólico de alcohol de ácido graso,
 acetilen glicol, acetilen alcohol, polímero de bloque de oxialquileno, éter de de polioxietilen alquilo, éter de
 polioxietilen alquilarilo, éter de polioxietilen estirilarilo, éter de polioxietilen glicol alquilo, polietilen glicol, éster de
 50 ácido graso de polioxietileno, éster de ácido graso de polioxietilen sorbitano, éster de ácido graso de polioxietilen
 glicerina, aceite de ricino hidrogenado de polioxietileno, éster de ácido graso de polioxipropileno, y aceites vegetales
 y minerales como aceite de oliva, aceite de ceiba pentandra, aceite de ricino, aceite de palma, aceite de camelia,
 aceite de coco, aceite de sésamo, aceite de maíz, aceite de salvado de arroz, aceite de cacahuete, aceite de semilla
 de algodón, aceite de soja, aceite de colza, aceite de linaza, aceite tung y parafinas líquidas. Cada uno de dichos
 componentes, como tales adyuvantes, puede consistir en uno o más de ellos seleccionados adecuadamente para su
 uso siempre y cuando el propósito de la presente invención se pueda cumplir. Asimismo, se pueden emplear
 también diversos aditivos como los utilizados comúnmente, como por ejemplo cargas, espesantes, agentes anti
 sedimentación, agentes anticongelantes, estabilizantes de la dispersión, agentes para reducir la fitotoxicidad, y
 agentes anti moho.

55 **[0043]** La relación en peso del compuesto de la presente invención y los diversos adyuvantes agrícolas está
 comprendida normalmente entre 0,001: 99,9999 y 95:5, preferiblemente entre 0,005: 99,995 y 90:10.

[0044] En la aplicación real de dicha formulación, se puede utilizar como tal o se puede diluir hasta una
 concentración determinada previamente con un diluyente como agua, y diversos agentes de extensión; v.g. se
 pueden añadir agentes tensioactivos, aceites vegetales o aceites minerales, según lo requiera el caso.

60 **[0045]** La aplicación del plaguicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención no se
 puede definir de forma general, ya que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, el tipo de formulación,
 la estación en la que se aplica, el lugar de aplicación o los tipos o grado de brote de los insectos plaga. No obstante,
 por lo general se aplica en una concentración del ingrediente activo comprendida entre 0,05 y 800.000 ppm,

preferiblemente entre 0,5 y 500.000 ppm, y la dosis por área unitaria es la adecuada para que el compuesto de la presente invención esté comprendido entre 0,05 y 50.000 g, preferiblemente entre 1 y 30.000 g, por hectárea. Por otra parte, los plaguicidas agrícolas y hortícolas, como otro modo de realización preferible de los plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención, se pueden aplicar con arreglo a los modos de aplicación de plaguicidas que se han descrito. La presente invención incluye dichos métodos para el control de plagas, en particular para el control de ácaros parásitos de plantas, plagas de insectos agrícolas o nematodos parásitos de las plantas a través de dichas formas de aplicación.

[0046] Se pueden aplicar varias formulaciones de plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención o sus composiciones diluidas a través de los métodos convencionales para su aplicación que se emplean comúnmente, como rociado (v.g., rociado, con pistola, nebulización, atomización, dispersión o extensión de polvos o granos en agua), aplicación sobre el suelo (v.g., mezclado o empapado), aplicación sobre la superficie (v.g., recubrimiento, pulverizado o recubrimiento) o impregnación para envenenar el alimento. Asimismo, es posible alimentar a los animales domésticos con comida que contenga el ingrediente activo mencionado y controlar el brote o desarrollo de la plaga, en particular plagas de insectos, con sus excrementos. Por otra parte, también se puede aplicar el ingrediente activo a través de lo que se denomina método de aplicación de volumen ultra bajo. En este método, la composición puede consistir en un 100% del ingrediente activo.

[0047] Asimismo, los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención se pueden mezclar o se pueden utilizar en combinación con otros productos químicos agrícolas, fertilizantes o agentes para reducir la fitotoxicidad, en virtud de lo cual se pueden conseguir efectos o actividades sinérgicas en ocasiones. Dichos productos químicos agrícolas incluyen por ejemplo herbicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, plaguicidas del suelo, fungicidas, agentes antiviricos, cebos, antibióticos, hormonas vegetales y agentes de regulación del crecimiento de las plantas. Especialmente, con un plaguicida mixto que tiene el compuesto de la presente invención mezclado o empleado en combinación con uno o más de los compuestos activos de otro producto químico agrícola, se pueden mejorar el intervalo de aplicación, el tiempo de aplicación, las actividades plaguicidas etc., en la dirección preferible. El compuesto de la presente invención y los compuestos activos de otros productos químicos agrícolas se pueden formular por separado con el fin de poder mezclarlos para su uso en el momento de su aplicación, o se pueden formular en combinación. La presente invención incluye dicha composición plaguicida mixta.

[0048] La relación de mezclado del compuesto de la presente invención y los compuestos activos de otros productos químicos agrícolas no se puede definir de forma general, ya que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, los tipos de formulaciones, el momento de aplicación, el lugar de aplicación, los tipos y el grado de brote de las plagas de insectos, etc. pero normalmente se encuentra comprendida dentro del intervalo de 1:300 a 300:1, preferiblemente entre 1:100 y 100:1, en peso. Asimismo, la dosis para la aplicación es la adecuada para que la cantidad total de los compuestos activos esté comprendida entre 0,1 y 50.000 g, preferiblemente entre 1 y 30.000 g por hectárea. La presente invención incluye un método para controlar plagas a través de la aplicación de dicha composición plaguicida mixta.

[0049] Los compuestos activos de los agentes de control de plagas para insectos como insecticidas, acaricidas, nematocidas o plaguicidas para el suelo en los productos químicos agrícolas distintos que se han mencionado incluyen por ejemplo (según los nombres comunes, algunos de ellos están aún en etapa de aplicación) compuestos de fosfato orgánicos como Profenofos, Diclorvos, Fenamifos, Fenitrotion, EPN, Diazinon, Clorpirifosmetilo, Acefato, Protiofos, Fostiazato, Fosfocarb, Cadusafos, Disulfoton, Clorpirifos, Demeton-S-metilo, Dimetoato, Metamidofos y Paration; compuestos de carbamato como Carbarilo, Propoxur, Aldicarb, Carbofurano, Tiodicarb, Metomilo, Oxamilo, Etiofencarb, Pirimicarb, Fenobucarb, Carbosulfan, y Benfuracarb; derivados de nereistoxina como Cartap y Tiociclam y Bensultap; compuestos de cloro orgánicos como Dicofol, Tetradifon y Endosulfan; compuestos organometálicos como óxido de Fenbutatina; compuestos piretroides como Fenvalerato, Permetrina, Cypermctrina, Deltametrina, Cihalotrina, Teflutrina, Etofenprox, Fenpropatrina y Bifentrina; compuestos de benzoil urea como Diflubenzuron, Clorfluazuron, Teflubenzuron, Flufenoxuron, Lufenuron, Novaluron, Bistrifluron y Noviflumuron; compuestos de tipo hormona juvenil como Metopreno, Piriproxifeno y Fenoxicarb; compuestos de piridazinona como Piridaben; compuestos de pirazol como Fenpiroximato, Fipronil, Tebufenpirad, Etiprol, Tolfenpirad, Acetoprol, Pirafluprol y Piriprol; neonicotinoides como Imidacloprid, Nitenpiram, Acetamiprid, Tiacloprid, Tiametoxam, Clotianidina y Dinotefuran; compuestos de hidrazina como Tebufenozida, metoxifenozida, Clomafenozida y Halofenozida, compuestos de dinitro; compuestos de azufre orgánicos; compuestos de urea; compuestos de triazina; compuestos de hidrazona; y otros compuestos como Flonicamid, Buprofezin, Hexitiazox, Amitraz, Clordimeform, Silafluofen, Triazamato, Pimetrozina, Pirimidifen, Clorfenapir, Indoxacarb, Acequinocilo, Etoxazol, Ciromazina, 1,3-dicloropreno, Diafentiuiron, Benclotiaz, Flufenerim, Piridalilo, Spirodiclofen, Bifenazato, Spiromesifen, Propargita, Clofentezina, Fluacipirim, Flubendiamida, Cifluometofen, Metaflumizona y Amidoflumet. Asimismo, se pueden utilizar mezclados o en combinación productos químicos agrícolas microbianos como agentes BT, virus de insectos, hongos entomopatógenos y hongos nematófagos, antibióticos como Avermectina, Emamectina-Benzato, Mibemectina, Spinosad, Ivermectina y Lepimectina o productos naturales como Azadiractina, y Rotenona.

[0050] Los compuestos activos de fungicidas entre los productos químicos agrícolas distintos mencionados incluyen por ejemplo (según los nombres comunes, algunos están todavía en la etapa de aplicación), compuestos de pirimidinamina como Mepanipirim, Pirimetanil y Cyprodinil; compuestos azol como Triadimefon, Bitertanol,

5 Triflumizol, Etaconazol, Propiconazol, Penconazol, Flusilazol, Miclobutanil, Ciproconazol, Terbuconazol, Hexaconazol, Furconazol-cis, Procloraz, Metconazol, Epoxiconazol, Tetraconazol, Oxpoconazol y Sipconazol; compuestos de quinoxalina como Quinometionato; compuestos de ditiocarbamato como Maneb, Zineb, Mancozeb, Policarbamato, Propineb; compuestos de cloro orgánicos como Ftalida, Clorotalonil, Quintozeno; compuestos de imidazol como Benomil, Tiofanato-Metilo, Carbendazim y Ciazofamid; compuestos de piridinamina como Fluazinam, compuestos de cianoacetamida como Cimoxanilo; compuestos de fenilamida como Metalaxilo, Oxadixilo, Ofurace, Benalaxilo, Furalaxilo, y Ciprofuram; compuestos de ácido sulfénico como Diclofluanid; compuestos de cobre como hidróxido cúprico y Cobre Oxina; compuestos de isoxazol como Hidroxiisoxazol; compuestos organofosforosos como Fosetyl-Al, Tolclofos-Metilo, O,O-diisopropilfosforotioato de S-bencilo, S,S-difenilfosforoditioacto de O-etilo, y hidrogen fosfonato de aluminometilo; compuestos de N-halogenotioalquilo como Captano, Captafol y Folpet; compuestos de dicarboximida como Procimidona, Iprodiona y Vinclozolina; compuestos de benzanilida como Flutolanil, Mepronil y Zoxamida; compuestos de piperazina como Triforina; compuestos de piridina como Pirifenox; compuestos de carbinol como Fenarimol; y Flutriafol; compuestos de piperidina como Fenpropidina; compuestos de morfolina como Fenpropimorfo; compuestos de órgano estaño como hidróxido de Fentin y acetato de Fentin; compuestos de urea como Pencicuron; compuestos de ácido cinámico como Dimetomorfo, compuestos de carbamato de fenilo como Dietofencarb; compuestos de ciano pirrol como Fludioxonil y Fenpiclonil; compuestos de Estrobilurina como Azoxistrobina, Kresoxim-metilo, Metominofen; Trifloxistrobina, Picoxistrobina y Piraclostrobina; compuestos de oxazolidindiona como Famoxadona; compuestos de tiazol carboxamida como Etaboxam; compuestos de silil amida como Siltiofam; compuestos de amidocarbamato de aminoácido como Iprovalicarb; compuestos de imidazolidina como Fenamidona; compuestos de hidroxianilida como Fenhexamid; compuestos de benceno sulfonamida como Flusulfamida; compuestos de antraquinona; compuestos de ácido crótónico; antibióticos y otros compuestos como Isoprotilano; Triciclazol, Piroquilon, Diclomezina, Probenazol, Quinoxifen; hidrócloruro de Propamocarb, Spiroxamina, Cloropicrin, Dazomet y Metam-Sodio.

25 **[0051]** Asimismo, los productos químicos agrícolas que se pueden utilizar mezclados o en combinación con los compuestos de la presente invención, pueden consistir por ejemplo en compuestos que son ingredientes activos de herbicidas como los descritos en Farm Chemicals Handbook (edición 2002), en particular los del tipo de tratamiento del suelo.

30 **[0052]** Los plaguicidas contra parásitos en animales son efectivos para controlar, v.g., parásitos externos que son parásitos de la superficie del cuerpo del animal huésped (como por ejemplo la espalda, las axilas, el abdomen inferior o por dentro del muslo) o parásitos internos que son parásitos en el cuerpo de los animales huésped (como el estómago, el tracto intestinal, los pulmones, el corazón, el hígado, los vasos sanguíneos, los tejidos subcutáneos o linfáticos), pero son especialmente efectivos para controlar los parásitos externos.

[0053] Los parásitos externos pueden consistir por ejemplo en ácaros o pulgas parásitas de animales. Sus especies son tantas que sería difícil enumerarlas todas por lo que se indican solamente los ejemplos típicos.

35 **[0054]** Los ácaros parásitos animales pueden consistir por ejemplo en garrapatas 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*; ácaros rojos comunes (*Dermanyssus gallinae*); ácaros de palomas silvestres como *Ornithonyssus syriarum* y *Ornithonyssus bursa*; trombidioides como *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*; *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* y *Helenicula miyagawai*; queilétidos como *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* y *Cheyletiella blakei*; ácaros de la sarna sarcóptica como *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* y *Notoedres cati*; y Demodicidae como *Demodex canis*. Los plaguicidas contra parásitos en animales que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente efectivos para el control de garrapatas entre ellos.

45 **[0055]** Las pulgas pueden consistir por ejemplo en insectos sin alas parásitos que pertenecen a los *Sifonápteros*, más específicamente las pulgas que pertenecen a *Pulicidae*, *Ceratophyllus*, etc. Las pulgas que pertenecen a los *Pulicidae* pueden consistir por ejemplo en *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptosylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* y *Monopsyllus anisus*. Los plaguicidas contra parásitos en animales que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente efectivos para el control de pulgas que pertenecen a los *Pulícidos*, en particular *Ctenocephalides canis* y *Ctenocephalides felis*, entre ellos.

55 **[0056]** Otros parásitos externos pueden consistir por ejemplo en piojos masticadores (*Anoplura*) como por ejemplo piojos chupadores (*Haematopinus eurytarnus*), piojo chupador equino (*Haematopinus asini*), piojo nariz larga del ganado (*Linognathus vituli*), y piojo de la cabeza (*Pediculus capitis*); piojos mordedores, como por ejemplo piojo mordedor del perro (*Trichodectes canis*); e insectos dípteros chupadores, como tábano común (*Tabanus trigonus*), moscas mordedoras (*Culicoides schultzei*) y mosca negra (*Simulium ornatum*). Asimismo, los parásitos internos pueden consistir por ejemplo en nematodos como gusanos del pulmón, tricocéfalo (*Trichuris*), gusanos de los tubérculos, parásitos gástricos, áscaris, y filarioideos; cestodos como *Spirometra erinacei*, *Diphyllobothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Taenia multiceps*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, trematodos como

Schistosoma japonicum, *Fasciola hepatica* y protozoos como coccidios, parásitos de la malaria (*Plasmodium malariae*), sarcoquistes intestinales, toxoplasma y criptosporidio.

- 5 [0057] Los animales pueden consistir por ejemplo en animales mascotas, animales domésticos y aves de corral, por ejemplo perros, gatos, ratones, ratas, hámsters, cobayas, ardillas, conejos, hurones, aves (como palomas, loros, mainatá beo, gorrión de Java, loros, tórtolas y canarios), vacas, caballos, cerdos, ovejas, patos y pollos. Los plaguicidas contra los parásitos en los animales que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente efectivos para el control de parásitos plaga sobre animales mascotas o animales domésticos, especialmente para el control de parásitos externos, entre ellos. Entre los animales mascota y los animales domésticos son particularmente efectivos para perros, gatos, vacas y caballos.
- 10 [0058] Cuando se utiliza el compuesto de la presente invención como plaguicida contra parásitos en animales, se puede utilizar como tal o se puede utilizar con un adyuvante adecuado, tal como se formula en diversas formulaciones como polvos, granulados, tabletas, polvos, cápsulas, concentrados solubles, concentrados emulsionables, un concentrado en suspensión de base acuosa y un concentrado en suspensión de base oleosa. Además de dichas formulaciones, se puede formular en cualquier tipo de formulación que se utilice comúnmente en este campo, siempre y cuando sea adecuada para los propósitos de la presente invención. Los adyuvantes que se utilizan en las formulaciones pueden consistir por ejemplo en agentes tensioactivos aniónicos o agentes tensioactivos no iónicos, cuyos ejemplos se han mencionado anteriormente como adyuvantes para la formulación de plaguicidas agrícolas y hortícolas; un agente tensioactivo catiónico como bromuro de cetil trimetilamonio; un disolvente como agua, acetona, acetonitrilo, monometilacetamida, dimetilacetamida, dimetilformamida, 2-pirrolidona, N-metil-2-pirrolidona, queroseno, triacetina, metanol, etanol, isopropanol, alcohol bencílico, etilen glicol, propilen glicol, polietilen glicol, polioxietilen glicol líquido, butil diglicol, éter monometílico de etilen glicol, éter monoetilico de etilen glicol, éter monoetilico de dietilen glicol, éter n-butílico de dietilen glicol, éter monometílico de dipipilen glicol, éter n-butílico de dipipilen glicol; un antioxidante como butilhidroxianisol, butilhidroxitolueno, ácido ascórbico, hidrogenmetanosulfato sódico, galato de propilo o tiosulfato de sodio; un agente para formar película de recubrimiento como polivinil pirrolidona, polialcohol vinílico o un copolímero de acetato de vinilo y vinil pirrolidona; aceites vegetales y aceites minerales como los que se han indicado como ejemplos antes como adyuvantes para la formulación y plaguicidas agrícolas y hortícolas; y un vehículo como lactosa, sacarosa, glucosa, almidón, harina de trigo, harina de maíz, torta de soja y harina; salvado de arroz desgrasado, carbonato cálcico y otros materiales alimenticios comercialmente disponibles. Se puede seleccionar adecuadamente uno o más de los componentes correspondientes de estos adyuvantes para su uso siempre y cuando no se alejen del propósito de la presente invención. Asimismo, se pueden seleccionar adecuadamente para su uso otros adyuvantes distintos a los mencionados entre los conocidos en este campo, y también se pueden seleccionar adecuadamente para su uso algunos de los distintos adyuvantes utilizados en el campo de la agricultura y la horticultura antes mencionados.
- 20 [0059] La proporción de mezclado del compuesto de la presente invención y los distintos adyuvantes está comprendida normalmente entre 0,1:99,9 y 90:1,0. En el uso real de dicha formulación, se puede utilizar como tal o se puede diluir hasta una concentración determinada previamente con un diluyente como agua, y se pueden añadir diversos agentes de extensión (v.g., agentes tensioactivos, aceites vegetales y aceites minerales), según lo requiera el caso.
- 25 [0060] La administración del compuesto de la presente invención a un animal huésped se lleva a cabo por vía oral o parenteral. Como método de administración oral, se puede mencionar un método de administración de una tableta, un agente líquido, una cápsula, una oblea, una galleta, carne triturada u otro alimento, que contenga el compuesto de la presente invención. Como método de administración parenteral se puede mencionar por ejemplo un método en el que se formula el compuesto de la presente invención en una formulación adecuada e introducirse después en el cuerpo v.g. por administración intravenosa, administración intramuscular, administración intradérmica, administración hipodérmica, etc.; un método en el que se administra en la superficie del cuerpo por tratamiento en un punto, tratamiento de vertido o tratamiento por rociado; o un método de embebido de un fragmento de resina o similar que contenga el compuesto de la presente invención bajo la piel del animal huésped.
- 30 [0061] La dosis del compuesto de la presente invención en el animal huésped varía dependiendo del método de administración, el propósito de la administración, el síntoma de la enfermedad, etc., pero normalmente se administra en una proporción comprendida entre 0,01 mg y 100 g, preferiblemente entre 0,1 mg y 10 g, por cada 1 kg de peso corporal del animal huésped.
- 35 [0062] La presente invención incluye también un método de control de una plaga a través del método de administración que se ha mencionado o a través de la dosis citada, en particular un método de control de parásitos externos o parásitos internos.
- 40 [0063] Asimismo, en la presente invención, puede darse el caso en el que al controlar las plagas parásitas en los animales, tal como se ha descrito, es posible prevenir o curar las distintas enfermedades del animal huésped causadas por ellas. Por lo tanto, la presente invención incluye también un agente preventivo o terapéutico para una enfermedad animal causada por un parásito que contiene el compuesto de la presente invención como ingrediente activo, y un método para prevenir o curar una enfermedad animal causada por un parásito.
- 45 [0064] La presente invención incluye también un método de control de una plaga a través del método de administración que se ha mencionado o a través de la dosis citada, en particular un método de control de parásitos externos o parásitos internos.
- 50 [0065] La presente invención incluye también un método de control de una plaga a través del método de administración que se ha mencionado o a través de la dosis citada, en particular un método de control de parásitos externos o parásitos internos.
- 55 [0066] La presente invención incluye también un método de control de una plaga a través del método de administración que se ha mencionado o a través de la dosis citada, en particular un método de control de parásitos externos o parásitos internos.

[0064] Cuando se utiliza el compuesto de la presente invención como plaguicida contra parásitos en animales, se pueden utilizar varias vitaminas, minerales, aminoácidos, nutrientes, enzimas, antipiréticos, sedantes, antiflogísticos, fungicidas colorantes, sustancias aromáticas, conservantes, etc, mezcladas o en combinación con los adyuvantes. Asimismo, según lo requiera el caso, se pueden mezclar o combinar para su uso otros fármacos para animales o productos agrícolas, tales como vermícidias, agentes anti-coccidium, insecticidas, acaricidas, pulicidas, nematocidas, bactericidas o agentes antibacterianos, en virtud de lo cual se pueden obtener a veces mejores efectos. La presente invención incluye dicha composición plaguicida mixta que tiene los distintos componentes que se han mencionado mezclados o combinados para su uso, así como un método para controlar una plaga a través de su uso, en particular, un método para controlar parásitos externos o parásitos internos.

[0065] A continuación, se ilustrarán varios modos de realización preferibles de los compuestos de la presente invención. En los ejemplos, se pueden combinar dos o más adecuadamente, y los compuestos que se basan en dichas combinaciones también son modos de realización preferibles de los compuestos de la presente invención. Asimismo, son también modos de realización preferibles de la presente invención plaguicidas, plaguicidas para agricultura y horticultura, insecticidas, acaricidas, nematocidas, plaguicidas contra parásitos en animales, plaguicidas contra parásitos externos en animales y agentes preventivos o terapéuticos para enfermedades animales causadas por parásitos, que contienen los siguientes compuestos como ingredientes activos. Por otra parte, los métodos para controlar las plagas aplicando así cantidades efectivas de los siguientes compuestos también con modos de realización preferibles de la presente invención.

EJEMPLOS

[0066] A continuación, se describirá la presente invención haciendo referencia a los ejemplos, pero debe entenderse que la presente invención no queda limitada en absoluto con ellos. En primer lugar se describirán los ejemplos de preparación del compuesto de la presente invención.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 1 (Referencia)

Preparación de N-[6-[[ciclopropilmetil]amino]carbonil]-2-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridil)-3-trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (en adelante denominado compuesto N°1)

[0067] Se añadieron gota a gota gradualmente 1,49 g de trietilamina a una solución mixta que comprendía 0,8 g de hidrocloreuro de ciclopropilmetilamina y 40 ml de tetrahidrofurano, con enfriamiento con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, se añadió gota a gota gradualmente una solución mixta que comprendía 1 g de 2-[1-(3-cloro-2-piridil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona y 10 ml de tetrahidrofurano. Una vez completada la adición gota a gota, se hizo reaccionar la solución mixta durante 4 horas a reflujo. Una vez completada la reacción, se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se añadió al residuo acetato de etilo y agua para extracción. Se lavó la capa orgánica con agua y solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se purificó el residuo por cromatografía de columna sobre gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 0,54 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 199,4°C.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 2 (Referencia)

Preparación de N-[4-cloro-2-metil-6-[[α -metil-(ciclopropilmetil)amino]carbonil]-fenil]-3-(trifluorometil)-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida (en adelante denominado compuesto N° 3)

[0068] Se añadieron gota a gota gradualmente 1,37 g de trietilamina a una solución mixta que comprendía 0,82 g de hidrocloreuro de α -metil-ciclopropilmetilamina y 40 ml de tetrahidrofurano, con enfriamiento con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, se añadió gota a gota gradualmente una solución mixta que comprendía 1 g de 2-[1-(3-cloro-2-piridil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona y 10 ml de tetrahidrofurano. Una vez completada la adición gota a gota, se hizo reaccionar la solución mixta durante 4 horas a reflujo. Una vez completada la reacción, se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se añadieron al residuo acetato de etilo y agua para extracción. Se lavó la capa orgánica con agua y solución acuosa saturada de cloruro sódico, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se eliminó el disolvente a presión reducida y se purificó el residuo por cromatografía de columna sobre gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 0,45 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 210,0°C.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 3 (Referencia)

Preparación de N-[4-cloro-2-metil-6-[[α -metil-(ciclopropilmetil)amino]carbonil]-fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida (en adelante denominado compuesto N°9)

[0069] Se añadieron gota a gota gradualmente 1,07 g de trietilamina a una solución mixta que cp,`remdçoa 0,65 g de hidrocloreuro de α -metil-ciclopropilmetilamina y 40 ml de tetrahidrofurano, con enfriamiento con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, se añadió gota a gota gradualmente una solución mixta que comprendía 0,8 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-il]6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona y 10 ml de tetrahidrofurano. Una vez completada la adición gota a gota, se hizo reaccionar la solución mixta durante 4 horas a reflujo. Una vez completada la reacción, se eliminó por destilación el disolvente a

presión reducida y se añadió al residuo acetato de etilo y agua para extracción. Se lavó la capa orgánica con agua y una solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se purificó el residuo por cromatografía de columna sobre gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 0,33 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 183,6°C.

5

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 4

Preparación de N-[2-bromo-4-cloro-6-[[α -metil-(ciclopropilmetil)-amino]carbonil]-fenil]-3-bromo-1-(5-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida (en adelante denominado compuesto N° 16)

10

[0070] Se añadió gota a gota gradualmente 1 g de trietilamina a una solución mixta que comprendía 0,6 g de hidrocloreuro de α -metil-ciclopropilmetilamina y 40 ml de tetrahidrofurano con enfriamiento con hielo, seguido de agitación durante 1 hora a temperatura ambiente. A continuación, se añadió gota a gota gradualmente una solución mixta que comprendía 0,85 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-bromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona y 10 ml de tetrahidrofurano. Una vez completada la adición gota a gota, se hizo reaccionar la solución mixta durante 4 horas a reflujo. Una vez completada la reacción, se eliminó por destilación el disolvente y se añadieron al residuo acetato de etilo y agua para extracción. Se lavó la capa orgánica con agua y solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se purificó el residuo por cromatografía de columna sobre gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/2) para obtener 0,7 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 260,6°C.

15

20

[0071] A continuación, se exponen ejemplos típicos del compuesto de la presente invención representado por la fórmula (I) anterior en la tabla 1. Dichos compuestos se pueden preparar como en los ejemplos de preparación que se han descrito o a través de los diversos procesos de producción del compuesto de la presente invención que se han mencionado anteriormente.

25

[0072] En la tabla 1, N° representa compuesto N°. Asimismo, en la tabla 1, Me representa un grupo metilo, Et un grupo etilo, iPr un grupo isopropilo, CPr un grupo ciclopropilo, CBU un grupo ciclobutilo, y pH un grupo fenilo. Asimismo, en la tabla 1, A1 representa -CH₂-[CPr], A2 -CH(Me)-[CPr], A3 -CH₂-[2-Me-CPr], A4 -CH₂-[2,2-Cl₂-1-Me-CPr], A5 -CH₂-[1-Me-CPr] y A6 -CH(Me)-[CBu]. Asimismo, en la tabla 1, 2-Me-CPr representa un grupo ciclopropilo que tiene un grupo metilo sustituido en la posición -2 y CO₂Ph(4-Cl) representa un grupo fenoxicarbonilo que tiene un átomo de cloro sustituido en la posición 4- del grupo fenilo. Lo mismo se aplica en otras descripciones similares.

[0073] Por otra parte, en la tabla 1, n es 0 a no ser que se especifique de otra forma.

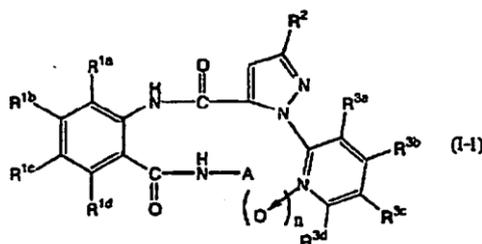


TABLA 1

N°	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{1c}	R ^{1d}	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: °C)
1*	Me	H	H	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A1	199,4
2*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A1	216,4
3*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	210,0
4*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A3	
5*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A4	219,3
6*	Me	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A1	
7*	Me	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A1	
8*	Me	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	186,7

9*	Me	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	183,6
10*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A5	161,2
11*	Br	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	158,2
12*	I	H	Br	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	145,5
13*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	230,9
14*	Cl	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	238,8
15*	Cl	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	236,8
16	Br	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	260,6
17*	I	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	251,4
18*	Br	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	220,1
19*	I	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	241,0
20*	Cl	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	214,0
21*	I	H	I	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	251,9
22*	Br	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	219,2
23*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Br	H	H	H	A2	162-164
24*	Me	H	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	H	A2	154-156
25*	Me	H	Cl	H	Br	Br	H	H	H	A2	128-132
26*	Cl	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
27*	I	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
28*	F	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
29*	F	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
30*	I	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	

Nº	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{1c}	R ^{1d}	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: °C)
31*	F	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
32*	F	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
33*	Me	H	F	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
34*	Me	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
35*	Me	H	CO ₂ Me	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
36*	Me	H	CO ₂ -iPr	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
37*	Me	H	CO ₂ Ph	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
38*	Br	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	233,2
39*	Br	H	F	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	179,1
40*	Me	H	COCH ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	143,4
41*	Me	H	CHO	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	152,3
42*	Me	H	CHF ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	212,9
43*	Me	H	CHF ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	

44*	Me	H	CHF ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
45*	Et	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	215,4
46*	Et	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
47*	Et	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
48*	Me	H	NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	197,9
49*	Me	H	NO ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
50*	Me	H	NO ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
51*	Me	H	CF ₃	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
52*	Me	H	CF ₃	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
53*	Me	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
54*	CF ₃	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
55*	Me	H	OMe	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
56*	Me	H	OMe	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
57*	Me	H	OMe	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
58*	OCHF ₂	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
59*	OCHF ₂	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
60*	OCHF ₂	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
61*	CHF ₂	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	

Nº	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{1c}	R ^{1d}	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: °C)
62*	CHF ₂	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
63*	CHF ₂	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
64*	Me	H	CH=CH ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
65*	Me	H	C≡CH	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
66*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
67*	Me	H	COCF ₃	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
68*	Me	H	CH=CCl ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
69*	Me	H	C≡Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
70*	Me	H	CO ₂ Ph(4-Cl)	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
71*	Me	H	CO ₂ Ph(4-Me)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
72*	Me	H	CO ₂ Ph(4-NO ₂)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
73*	Me	H	CO ₂ Ph(4-CN)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
74*	Me	H	CO ₂ Ph(4-SMe)	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
75*	Et	H	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
76*	Me	H	NO ₂	H	OCH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
77*	Me	H	CHF ₂	H	CF ₃	H	H	Cl	H	A2	
78*	Et	H	Cl	H	Br	H	H	F	H	A2	

79*	I	H	Cl	H	Br	F	H	F	H	A2	
80*	I	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	220,6
81*	Me	H	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	Cl	H	H	H	A2	175,1
82*	Br	H	CHF ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
83*	Br	H	CHF ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
84*	Br	H	CHF ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
85*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	A2	
86*	Me	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	F	H	A2	
87*	Br	H	NO ₂	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
88*	Br	H	NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
89*	Br	H	NO ₂	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
90*	I	H	Br	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	222,9
91*	I	H	Br	H	Br	Cl	H	H	H	A2	221,0
92*	Me	H	Me	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	172,3

Nº	R ^{1a}	R ^{1b}	R ^{1c}	R ^{1d}	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	R ^{3c}	R ^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: °C)
93*	Me	H	CO ₂ -iPr	H	Br	Cl	H	H	H	A2	176-179
94*	Et	H	Br	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	175,2
95*	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	116,8
96*	Me	H	CO ₂ Me	H	Br	Cl	H	H	H	A2	190-198
97*	CF ₃	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
98*	CF ₃	H	Br	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	234,8
99*	CF ₃	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	230,0
100*	Cl	H	CF ₃	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
101*	Br	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
102*	Cl	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	H	A2	
103*	N-óxido del compuesto N°1 (n = 1)										
104*	N-óxido del compuesto N°3 (n = 1)										
105*	N-óxido del compuesto N°9 (n = 1)										
106	N-óxido del compuesto N°16 (n = 1)										
107*	N-óxido del compuesto N°22 (n = 1)										
108*	N-óxido del compuesto N°42 (n = 1)										
* Ejemplo de referencia											

[0074] A continuación, se describirán ejemplos de ensayo

EJEMPLO DE ENSAYO 1

5 Ensayo sobre el control de los efectos contra la oruga común (*Spodoptera litura*)

5 **[0075]** Se sumergió un segmento de hoja de calabaza durante aproximadamente 10 segundos en una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 50 ppm o 3,1 ppm y se secó al aire. Se colocó un papel de filtro mojado en una placa petri que tenía un diámetro de 9 cm, y se colocó encima el segmento de hoja de calabaza seca. Se liberaron 10 larvas en el segundo- tercer instar de orugas comunes en ella y después de colocar una cubierta, se dejaron en una cámara a temperatura constante a 25°C, con iluminación. Se hizo el recuento de las larvas muertas 5 días después de haberlas soltado y se calculó la mortalidad con la siguiente ecuación. En este punto, se hizo el recuento de los insectos moribundos como insectos muertos. Se obtuvo el índice de mortalidad a 50 ppm en relación con los compuestos antes indicados N° 8, 20 a 22, 25, 41, 91 a 93 y 96, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con una mortalidad de al menos un 90%, y se obtuvo la mortalidad a 3,1 ppm en relación con los compuestos antes indicados N° 1 a 3, 5, 9 a 19, 23, 24, 38 a 40, 42, 80, 81 y 90, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con una mortalidad de al menos un 90%.

Mortalidad (%) = (número de insectos muertos / número de insectos soltados) x 100

15 EJEMPLO DE ENSAYO 2

Ensayo para controlar los efectos contra la mosca blanca (*Bermisia argentifoli*)

20 **[0076]** Se soltaron adultos de mosca blanca en un pepino con sólo la primera hoja principal habiéndose cortado las demás hojas y plantado en un tiesto permitiendo que pusieran los huevos durante 8 horas. A continuación, se dejó durante 7 a 10 días en una cámara a temperatura constante, a 25°C con iluminación. Se hizo el recuento de las eclosiones y después, se sumergió la hoja infestada durante aproximadamente 10 segundos en una solución insecticida preparada para conseguir una concentración del compuesto de la presente invención de 200 ppm o 50 ppm y se secó al aire. Después del tratamiento, se dejó en una cámara a temperatura constante a 25°C con iluminación durante 10 a 14 días, tras lo cual se hizo el recuento del número de larvas de último instar y el número de pupas y se obtuvo el valor de protección con la ecuación que se indica a continuación. Se obtuvo el valor de protección a 200 ppm con respecto a los compuestos antes mencionados N° 11 y 21, en virtud de lo cual se demostró unos altos efectos de control con un valor de protección de al menos un 80% y se obtuvo un valor de protección de 50 ppm con respecto a los compuestos antes mencionados N° 3, 9, 12, 14 a 20, 22, 38 y 39, en virtud de lo cual los compuestos presentaron un alto efecto de control con un valor de protección de al menos 80%.

Valor de protección (%) = (1-((TaxCb)/(TbxCa)))x100

30 Ta: número de larvas en último instar + número de pupas después del tratamiento en la sección tratada

Tb: número de eclosiones antes del tratamiento en la sección tratada

Ca: Número de larvas en último instar + número de pupas tras el tratamiento en la sección tratada

Cb: Número de eclosiones antes del tratamiento en la sección tratada

EJEMPLO DE ENSAYO 3

35 Ensayo para controlar los efectos contra el pulgón del melocotón verde (*Myzus persicae*)

40 **[0077]** Se recubrió el pecíolo de una berenjena en la que se había dejado sólo la hoja principal y plantada en un tiesto, con una sustancia pegajosa y después se soltaron aproximadamente 2-3 hembras vivíparas ápteros de pulgón del melocotón verde sobre la hoja principal. Al cabo de dos días desde que se soltaron, se quitaron los insectos adultos y se hizo el recuento del número de larvas. A continuación, se sumergió la hoja de la berenjena infestada con las larvas en una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención a 800 ppm, durante aproximadamente 10 segundos, después se secó al aire y se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Se hizo el recuento de los insectos que sobrevivieron 5 días después del tratamiento y se calculó la mortalidad con la ecuación que se indica a continuación. Se obtuvo el índice de mortalidad en relación con los compuestos antes mencionados N° 2, 9, 11, 14 a 18, 20, 22, 23, 38, 39, 42 y 90, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron unos altos efectos de control con una mortalidad de al menos 90%.

Mortalidad (5) = (1-(número de insectos supervivientes /número de insectos tratados)) x 100

EJEMPLO DE ENSAYO 4

Ensayo para controlar los efectos contra el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*)

50 **[0078]** Se recubrió con una sustancia pegajosa el pecíolo de una berenjena que tenía solamente la hoja principal y se plantó en un tiesto; a continuación se soltaron aproximadamente 3-4 hembras vivíparas ápteras del pulgón del algodón sobre la hoja principal. Al cabo de dos días desde que se soltaron, se quitaron los insectos adultos y se hizo el recuento del número de larvas. Se sumergió la hoja de la berenjena infestada con las larvas en una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 50 ppm, durante

aproximadamente 10 segundos, a continuación se secó al aire y se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Se hizo el recuento del número de insectos supervivientes 5 días después del tratamiento y se obtuvo el índice de mortalidad de la misma manera que en el ensayo del ejemplo 3 anterior. Se obtuvo el índice de mortalidad en relación con los compuestos antes mencionados N° 16, 18 y 22, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con una mortalidad de al menos un 90%.

EJEMPLO DE ENSAYO 5

Ensayo para controlar los efectos contra la mosca minadora (*Liriomyza trifolii*)

[0079] Se sumergió un segmento de hoja de alubia roja que tenía huevos de mosca minadora uniformemente colocados sobre ella, durante aproximadamente 10 segundos, en una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 25 ppm o de 12,5 ppm, y a continuación se secó al aire. Se colocó el papel de filtro mojado sobre un vaso de plástico que tenía un diámetro de 9 cm y una altura de 4 cm, y se colocó encima el segmento de hoja de alubia roja seca. A continuación, después de colocar una cubierta encima, se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Se hizo el recuento del número de larvas en último instar y el número de pupas durante 6 a 8 días tras el tratamiento y se calculó el valor de protección a través de la ecuación que se indica a continuación. Se obtuvo el valor de protección a 25 ppm con respecto a los compuestos antes mencionados N° 9, 14 y 23, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con un valor de protección de al menos 90%, y se obtuvo el valor de protección de 12,5 ppm en relación con los compuestos mencionados n° 2, 3, 11, 12, 15 a 18 y 22, en virtud de lo cual los compuestos presentaron altos efectos de control con un valor de protección de al menos 90%.

Valor de protección (%) = $(1 - ((\text{número de larvas en último instar} + \text{número de pupas en la sección tratada}) / (\text{número de larvas en último instar} + \text{número de pupas en la sección sin tratar}))) \times 100$

EJEMPLO DE ENSAYO 6

Ensayo para controlar los efectos contra *Thrips palmi*

[0080] Se cortaron todas las hojas de un pepino plantado en un tiesto excepto la hoja principal. Se sumergió la hoja que quedaba durante aproximadamente 10 segundos en una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención a 50 ppm y se secó al aire. A continuación, se colocó un segmento de la hoja de pepino con larvas en primer instar sobre la hoja tratada anterior. Al día siguiente, se quitó el segmento de la hoja de pepino y se hizo el recuento del número de larvas trasladadas a la hoja tratada. Se colocó un papel de filtro mojado en un vaso de plástico que tenía un diámetro de 9 cm y una altura de 4 cm, y se colocó encima la hoja tratada cortada. A continuación, después de colocar una cubierta encima, se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Se hizo el recuento del número de insectos supervivientes durante 12 a 15 días después del tratamiento y se obtuvo el valor de protección de la misma manera que en el ejemplo de ensayo 2 anterior. Se obtuvo el valor de protección en relación con los compuestos anteriores N° 11, 12, 16, 22, 38, y 39 en virtud de lo cual los compuestos presentaron altos efectos de control con un valor de protección de al menos 90%.

EJEMPLO DE ENSAYO 7

Ensayo sobre el control de los efectos contra mariquita (*Epilachna vigintioctopunctata*)

[0081] Se sumergió un segmento de hoja de berenjena durante aproximadamente 10 segundos en una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención a 25 ppm o 12,5 ppm y se secó al aire. Se colocó un papel de filtro mojado sobre un vaso de plástico que tenía un diámetro de 9 cm y una altura de 4 cm y se colocó encima el segmento de hoja de berenjena seca. Se soltaron cinco larvas en primer-segundo instar de mariquitas encima y después de colocar una cubierta se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Se hizo el recuento de los insectos muertos durante 4 a 6 días después de soltarlas y se obtuvo el índice de mortalidad de la misma manera que la del ejemplo de ensayo 1 anterior. En este punto, se contó como insectos muertos a los insectos moribundos. Se obtuvo el índice de mortalidad a 25 ppm en relación con los compuestos mencionados N° 9 y 11, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con una mortalidad de al menos 90%; y se obtuvo el índice de mortalidad a 12,5 ppm en relación con los compuestos mencionados N° 3, 16, 22, 38 y 39, en virtud de lo cual los compuestos presentaron altos efectos de control con un índice de mortalidad de al menos 90%.

EJEMPLO DE ENSAYO 8

Ensayo sobre los efectos de control contra mosca (*Musca domestica*)

5 [0082] Se colocaron 10 g de medio de cultivo en un vaso de plástico que tenía un diámetro de 6 cm y una altura de 3 cm y a continuación, se añadieron 10 ml de una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 200 ppm, y se mezcló. Se soltaron de 20 a 30 larvas de 4 días de vida, y después de colocar una cubierta encima, se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación durante 15 a 16 días. A continuación se hizo el recuento del número de adultos y se obtuvo el porcentaje de inhibición de la emergencia siguiendo la ecuación que se indica a continuación. Se obtuvo el porcentaje de inhibición de la emergencia en relación con los compuestos mencionados N° 3, 9, 11, 12 y 14 a 20, en virtud de lo cual los compuestos presentaron altos efectos de control con un porcentaje de inhibición de emergencia de al menos 90%.

Porcentaje de inhibición de emergencia (%) = $(1 - (\text{número de adultos} / \text{número de larvas soltadas})) \times 100$

EJEMPLO DE ENSAYO 9

Ensayo sobre los efectos contra termita subterránea (*Coptotermes formosanus*)

15 [0083] Se colocó un papel de filtro en una placa petri de vidrio que tenía un diámetro de 9 cm, y 1 ml de solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 500 ppm. A continuación, se soltaron 10 obreras y un soldado de termitas subterráneas y después de colocar una cubierta, se dejaron en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación.

20 Se hizo el recuento del número de obreras muertas 6 días después del tratamiento y se obtuvo el índice de mortalidad a través de la ecuación que se muestra a continuación. Se obtuvo la mortalidad en relación con los compuestos anteriores N° 3, 9, 11, 12, 14 a 16 y 22, en virtud de lo cual, los compuestos presentaron altos efectos de control con un índice de mortalidad de al menos 90%.

Mortalidad (%) = $(\text{número de obreras muertas} / 10) \times 100$

EJEMPLO DE ENSAYO 10

Ensayo de los efectos sistémicos contra el gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*)

25 [0084] Se aplicaron 10 ml de una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 800 ppm y 200 ppm, al pie de una calabaza en el estadio de la hoja 5° a 6° plantada en un tiesto. Se colocó un papel de filtro mojado en una placa petri que tenía un diámetro de 9 cm, y se colocó encima un segmento de la hoja de la calabaza cortada diez días después del tratamiento. Se soltaron larvas en el segundo-tercer instar de gusano gris del tabaco y después de colocar una cubierta se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Se hizo el recuento de las larvas muertas durante 4 a 5 días después de soltarlas y se obtuvo el índice de mortalidad de la misma manera que la del ejemplo de ensayo 1 anterior. En este punto, se contó como insectos muertos, los insectos moribundos. Se obtuvo el índice de mortalidad a 800 ppm en relación con el compuesto mencionado anteriormente N° 8, en virtud de lo cual presentó altos efectos de control con un índice de mortalidad de al menos 90% y se obtuvo el índice de mortalidad a 200 ppm en relación con los compuestos anteriores mencionados N° 3, 9, 11, 16, 18 y 22, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con una mortalidad de al menos 90%.

EJEMPLO DE ENSAYO 11

Ensayo sobre el control contra *Hemaphysalis longicornis*

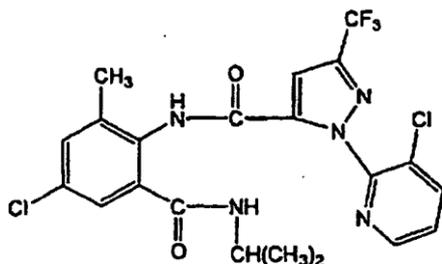
40 [0085] Se aplicó sobre la superficie interior de una placa petri que tenía un diámetro de 9 cm, 1 ml de solución en acetona de un compuesto de muestra (concentración: 10 µg/ml), gota a gota con una micropipeta. Por otra parte, como sección de control, se aplicó 1 ml de acetona gota a gota de la misma manera. Se secó la superficie interior de la placa petri y después se colocaron aproximadamente 100 garrapatas larvales y se cubrió la placa petri con una lámina de polietileno y se selló con una banda elástica. A continuación, a excepción del tiempo de observación, se dejó la placa petri en reposo a una temperatura constante de 25°C bajo una humedad relativa de 100% y en condiciones de oscuridad constante. Se llevó a cabo la observación cada vez que se ponían las garrapatas larvales en la placa petri (al cabo de 5 minutos, 10 minutos, 15 minutos, 20 minutos, 30 minutos, 45 minutos, 1 hora, 2 horas, 4 horas, 6 horas y 24 horas). Se registró el número de garrapatas abatidas tras el contacto con el compuesto insecticida. Se repitió esta operación dos veces.

50 [0086] Se corrigió el índice de abatimiento en cada tiempo de observación con la fórmula de corrección de Abbott que se indica a continuación. A continuación, se trazó una línea probit –tiempo y se obtuvo el tiempo de abatimiento medio (valor KT_{50}). En relación con los valores KT_{50} de los compuestos de muestra correspondientes, fueron 9 minutos y 8 minutos con el compuesto N°3 anterior y 7,5 minutos y 6 minutos con el compuesto anterior N° 9, mientras que fueron 80 minutos y 40 minutos con el siguiente compuesto comparativo A y 120 minutos y 80 minutos con el siguiente compuesto comparativo B.

Índice de abatimiento corregido (%) = [(índice de no abatimiento en la sección de control – índice de no abatimiento en la sección tratada)/ índice de no abatimiento en la sección de control] x 100

[0087] El compuesto comparativo A es el compuesto siguiente que es el compuesto 484 en WO 3/24222, compuesto 497 en WO 03/15518 y compuesto 2 en WO 03/15519.

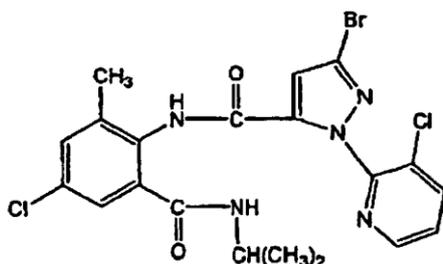
5 Compuesto comparativo A



Compuesto comparativo A

[0088] Compuesto comparativo B es el compuesto que se representa a continuación 509 en WO 03/24222, compuesto 530 en WO 03/15518 y compuesto 27 en WO 03/15519.

Compuesto comparativo B



Compuesto comparativo B

10

EJEMPLO DE ENSAYO 12

Ensayo sobre los efectos de control contra la pulga felina (*Ctenocephalides felis*)

15

[0089] Se sumergieron 0,5 ml de una solución en acetona del compuesto de la presente invención preparada para que fuera 5,3 ppm en un tubo de vidrio que tenía el fondo plano (diámetro interior: 2,6 cm, área inferior: 5,3 cm², altura 12 cm). Se evaporó acetona a temperatura ambiente para obtener una película seca que contenía el compuesto de la presente invención formado sobre la superficie del fondo. Se soltaron diez adultos de pulga felina (adultos que aún no habían succionado sangre dentro de los cinco días tras la emergencia del adulto) y se expusieron al compuesto de la presente invención. Se llevó a cabo el ensayo de forma continua tres veces.

20

[0090] Se hizo el recuento de las pulgas muertas 48 horas después de la exposición y se obtuvo el índice de mortalidad de la misma manera que la del ejemplo de ensayo 1 anterior. Se obtuvo el índice de mortalidad en relación con el compuesto anterior nº 16, en virtud de lo cual se demostraron altos efectos de control con una mortalidad de al menos 90%.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 1

[0091]

- 25
- | | |
|--|-------------------|
| (1) Compuesto de la presente invención | 20 partes en peso |
| (2) Arcilla | 72 partes en peso |
| (3) Lignin sulfonato sódico | 8 partes en peso |

[0092] Se mezclan uniformemente los compuestos indicados para obtener un polvo humectable.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 2

30

[0093]

- | | |
|--|------------------|
| (1) Compuesto de la presente invención | 5 partes en peso |
|--|------------------|

(2) Talco 95 partes en peso

[0094] Se mezclan uniformemente los componentes indicados para obtener un polvo fino.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 3

[0095]

5 (1) Compuesto de la presente invención 20 partes en peso
 (2) N,N'-dimetilacetamida 20 partes en peso
 (3) Éter polioxietilenaquilfenilo 10 partes en peso
 (4) Xileno 50 partes en peso

10 **[0096]** Se mezclan uniformemente los componentes indicados y se disuelven para obtener un concentrado emulsionable.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 4

[0097]

(1) Arcilla 68 partes en peso
 (2) Lignin sulfonato sódico 2 partes en peso
 15 (3) Sulfato de polioxietilenaquilarilo 5 partes en peso
 (4) Polvo de sílice fino 25 partes en peso

[0098] Se combina una mezcla de los componentes indicados con el compuesto de la presente invención en una relación en peso de 4:1 para obtener un polvo humectable.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 5

20 **[0099]**

(1) Compuesto de la presente invención 50 partes en peso
 (2) Fosfato de polialquilfenilo oxilado –
 trietanolamina 2 partes en peso
 (3) Silicona 0,2 partes en peso
 25 (4) Agua 47,8 partes en peso

[0100] Se mezclan uniformemente los componentes indicados y se pulverizan para obtener un líquido base y se añaden

(5) Policarboxilato sódico 5 partes en peso
 (6) Sulfato sódico anhidro 42,8 partes en peso

30 y se combina uniformemente la mezcla, se granula y se seca para obtener un granulado dispersable en agua.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 6

[0101]

(1) Compuesto de la presente invención 5 partes en peso
 (2) éter polioxietilenoctilfenilo 1 parte en peso
 35 (3) éster de ácido polioxietilen fosfórico 0,1 partes/peso
 (4) Carbonato cálcico granular 93,9 partes/peso

[0102] Se mezclan preliminarmente los componentes (1) a (3) indicados de forma uniforme y se diluyen con una cantidad apropiada de acetona y, a continuación, se rocía la mezcla sobre el componente (4), y se separa la acetona para obtener un granulado.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 7

[0103]

- (1) Compuesto de la presente invención 2,5 partes en peso
- (2) N-metil-2-pirrolidona 2,5 partes en peso
- (3) Aceite de soja 95,0 partes en peso

5 **[0104]** Se mezclan uniformemente los componentes indicados y se disuelven para obtener una formulación de volumen ultra bajo.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 8

[0105]

- (1) Compuesto de la presente invención 40 partes en peso
- 10 (2) Polialquilfenilfosfato oxilado –
trietanolamina 2 partes en peso
- (3) Silicona 0,2 partes en peso
- (4) Goma de Xanthan 0,1 partes en peso
- (5) Etilen glicol 5 partes en peso
- 15 (6) Agua 52,7 partes en peso

[0106] Se mezclan uniformemente los componentes indicados y se pulverizan para obtener un concentrado en suspensión de base acuosa.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 9

[0107]

- 20 (1) Compuesto de la presente invención 10 partes en peso
- (2) Éter monoetílico de dietilen glicol 90 partes en peso

[0108] Se mezclan uniformemente los componentes indicados para obtener un concentrado soluble.

REIVINDICACIONES

1. N-[2-bromo-4-cloro-6-[[α -metil-(ciclopropilmetil) amino]carbonil]fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida o su sal o el N-óxido del mismo.
2. Un proceso para producir N-[2-bromo-4-cloro-6-[[α -metil-(ciclopropilmetil) amino]carbonil]fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida o su sal, que comprende:
 - 5 (1) la reacción de cloruro de N-[α -metil-(ciclopropilmetil)2-amino-3-bromo-5-cloro benzamida con cloruro de 3-bromo 1-(3-cloro-piridin-2-il)-1H-5-pirazol-carbonilo, o
 - (2) la reacción de 2-[3-bromo-1(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-bromo-4H-3,1-benzoxazina-4-ona con un hidrocioruro de α -metil-ciclopropilmetilamina.
- 10 3. Un plaguicida que contiene el compuesto antranilamida o su sal o un N-óxido del mismo, tal como se ha definido en la reivindicación 1, como ingrediente activo.
4. Un plaguicida según la reivindicación 3
 - (i) para su uso como plaguicida en agricultura u horticultura.
 - (ii) para su uso como insecticida, acaricida o nematocida,
 - (iii) para su uso como plaguicida contra parásitos en animales, o
 - 15 (iv) para su uso como plaguicida contra parásitos externos en animales.
5. Un agente preventivo o terapéutico para una enfermedad animal causada por un parásito que contiene el compuesto de antranilamida o una sal o N-óxido del mismo tal como se ha definido en la reivindicación 1, como ingrediente activo.
- 20 6. Un método para controlar una plaga que comprende la aplicación de una cantidad efectiva del compuesto antranilamida o una sal o N-óxido del mismo, tal como se ha definido en la reivindicación 1, excepto para un método para el tratamiento de un organismo humano u animal a través de terapia.