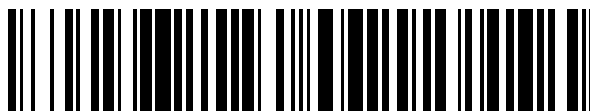


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 374 806**

51 Int. Cl.:
C07D 231/44 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **98917082 .4**
96 Fecha de presentación: **09.03.1998**
97 Número de publicación de la solicitud: **1007513**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **14.06.2000**

54 Título: **1-ARIL-3-IMINOPIRAZOLES PESTICIDAS.**

30 Prioridad:
10.03.1997 US 40135

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
22.02.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
22.02.2012

73 Titular/es:
Merial Limited
3239 Satellite Blvd
Duluth, GA 30096-4640, US

72 Inventor/es:
Manning, David Treadway y
Wu, Tai-Teh

74 Agente: **Ponti Sales, Adelaida**

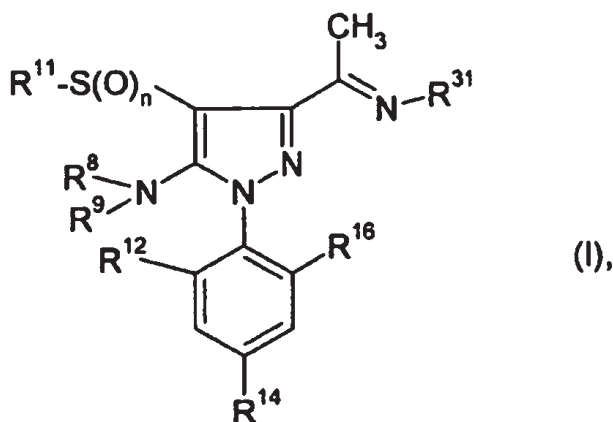
ES 2 374 806 T3

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

1-Aril-3-Iminopirazoles pesticidas

- [0001] La presente invención se refiere a nuevos derivados de arilpirazoles en la posición 1 que tienen algunas propiedades valiosas ya sea como pesticidas o como productos intermedios para hacer otros pesticidas. La invención se refiere además a composiciones de dichos compuestos y procedimientos, empleando dichos compuestos ya sea como productos intermedios para hacer otros pesticidas, o para el control de plagas de artrópodos, en particular para la aplicación de dichos compuestos o composiciones en procedimientos uso en agricultura o protección de animales, en particular como pesticidas, para controlar artrópodos.
- [0002] WO 87/03781 y EP-A 295117, EP-A 154115 y EP-A 201852 describen pirazoles sustituidos en la posición con fenilo insecticidas. También se encuentran otras técnicas anteriores en el texto de estas solicitudes de patentes o patentes concedidas a partir de estas.
- [0003] WO 93/06089 y WO 94/21606 también describen 1-heterociclos-(fenil sustituido por SF₅ en la posición 4) insecticidas que pueden ser pirroles así como imidazoles o pirazoles. Las enseñanzas de estas patentes no es sustancialmente diferente de WO 87/03781 o de EP-A 295117 en lo que respecta a los pirazoles.
- [0004] Se han descrito varios pirazoles pesticidas en varias patentes o solicitudes de patente: DE-A 195 18 054, EP-A 418016, EP-A 403309, EP-A 352944; US 5104994, US 5079370, US 5047550, US 5232940, US 4810720, US 4804675, US 5306694, US 4614533, US 5187185, US 5223525; WO 93/06089, WO 94/21606 y WO 97/28126.
- [0005] Debido a la gran cantidad de plagas y cultivos y a las condiciones de los ataques de cultivos por plagas, hay una necesidad de más compuestos pesticidas nuevos.
- [0006] Es un objeto de la presente invención proporcionar nuevos compuestos pesticidas de la familia de los arilpirazoles sustituidos en la posición 1 junto con procesos para su preparación.
- [0007] Un segundo objeto de la presente invención es proporcionar composiciones pesticidas y procedimientos de uso pesticida de los compuestos de pirazole pesticidas contra artrópodos, especialmente insectos, en particular en cultivos agrícolas u hortícolas, silvicultura, medicina veterinaria o cría de ganado, o en la salud pública.
- [0008] Un tercer objeto de la presente invención es proporcionar compuestos muy activos, con un amplio espectro de actividad pesticida, así como compuestos con actividad especial selectiva, por ejemplo, aficida, miticida, insecticida foliar, insecticida para el suelo, sistémica, antinutrición o actividad pesticida mediante tratamiento de las semillas.
- [0009] Estos y otros objetos, que se consiguen en parte o totalmente con esta invención, aparecerán fácilmente aparentes con la siguiente descripción de la invención.
- [0010] Esta invención abarca nuevos compuestos químicos que tienen actividad insecticida o miticida o nematicida o anti helmintos.
- [0011] La invención se refiere por lo tanto a compuestos que tienen la fórmula general (I)



35 donde:

R³¹ puede ser:

H; CN; NO₂; NO; SH; Alquiltio C₁-C₆; NH₂; P(O)(OR⁸)(OR⁹) o R³⁸; o

mono(alquilo C₁-C₆)amino; di(alquilo C₁-C₆)amino; formilo ; (alquilo C₁-C₆); C₁C₂₀ alquilo; C₃C₈ cicloalquilo; o C₄-C₆ (cicloalquilo) alquilo; donde cada alquilo o cicloalilo está opcionalmente sustituido por uno o más R³⁵; o

naftilo o fenilo, cada uno de ellos opcionalmente sustituido por uno o más R³⁸ o R³⁷; o

NH-CO-NH-N=CR⁸R⁹; NH-CS-NH-N=CR⁸R⁹; NH-CO-NR⁸R⁹; NH-CS-NR⁸R⁹;

5 NH-CO-OR⁸; NH-CS-OR⁸; o NH-CO-NH-NH₂;

R³⁵ puede ser halógeno, amino, C₁-C₆ alquilamino, di(alquilo C₁-C₆)amino, NO₂, CN, alcoxi C₁-C₆, (alcoxi C₁-C₆) carbonilo, hidroxicarbonilo, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, metileno, metilidino, alquinilo C₁-C₆, alquilalquinilo (alquilo C₁-C₆ ;Alquinilo C₁-C₆); o R³⁵ puede ser fenilo opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶; o R³⁵ puede ser un anillo heterocíclico que tiene en total de 3 a 7 átomos en el anillo de los cuales 1 a 4 son heteroátomos, siendo dichos heteroátomos iguales o diferentes y seleccionándose del grupo formado por O, S y N, siendo dicho anillo heterocíclico saturado o insaturado y estando opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶; o R³⁵ puede ser OH, SH, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, aminocarbonilo, (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, di(alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, o P(O)(OR⁸)(OR⁹);

10

R³⁸ puede ser SF₅, halógeno, alquilo C₁-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, NO₂, CN, amino, alquilamino C₁-C₆, di(alquilo C₁-C₆) amino, di(alquilo C₁-C₆)aminocarbonilamino, (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilamino, aminocarbonilamino, (alquilo C₁-C₆) carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)carbonilamino, (alcoxi C₁-C₆)carbonilamino, aminocarbonilo, di (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, hidroxicarbonilo, aminocarbonilo, (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, di(alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfino C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, P(O)(OR⁸)(OR⁹), (alquilo C₁-C₆)[(alquilo C₁-C₆)carbonil]amino o fenilamino(alquilo C₁-C₆);

15

R³⁷ puede ser R³⁸ o fenilo opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶, fenoxi opcionalmente sustituido por uno o más R³⁸, o bencilo opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶;

R³⁸ puede ser un radical heterocíclico derivado de un único anillo heterocíclico o de un sistema heterocíclico fusionado de dos anillos en el que al menos un anillo del cual es heterocíclico, teniendo cada anillo de 3 a 7 átomos en el anillo, teniendo cada anillo heterocíclico de 1 a 4 heteroátomos en el anillo, siendo dichos heteroátomos en el anillo iguales o diferentes y seleccionándose del grupo formado por O, S y N, siendo cada anillo saturado o insaturado; estos radicales heterocíclicos pueden ser, por ejemplo, radicales que se derivan de los siguientes compuestos: piridina, pirimidina, oxazol, oxadiazol, oxatriazole, isoxazol, tiazol, isotiazol, imidazol, pirano, pirona, pirazole, pirrol, tetrazol, furoxan, tetrahidrofuranilo, furanos, pirazina, piridazina, bencimidazol, quinolina, isoquinolina, triazina, tiofeno, furopiran, furopirone, tiatriazina, tiadiazol, pudiendo todos estos radicales heterocíclicos estar unidos al nitrógeno del grupo H₃C-C=N-R³¹ en cualquier posición posible del anillo heterocíclico y en los cuales todos los anillos pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más R³⁶ o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R³⁶;

R⁸ y R⁹ se seleccionan independientemente de entre H y alquilo C₁-C₆ que tienen opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, NO₂, CN, CHO, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, hidroxicarbonilo, y carbamoilo;

R¹¹ es metilo o etilo;

n es 0 o 1;

R¹² es cloro o bromo;

40 R¹⁴ es perhaloalquilo, perhaloalcoxi o SF₅;

R¹⁶ es cloro o bromo;

y sales de los mismos aceptables como pesticidas.

[0012] Todos los estereoisómeros, isómeros geométricos (formas E y Z para las iminas), isómeros y diaestereómeros ópticos que tienen la fórmula general (I), así como sus tautómeros si los hay, y mezclas de los mismos se incluyen en la invención.

[0013] Las sales de los compuestos anteriormente definidos también se incluyen en la invención, especialmente las sales de sodio, potasio o amonio o iminio.

[0014] A no ser que se especifique de otra manera, los radicales alquilo y porciones alquilo de otros radicales presentes contienen de 1 a 20, preferentemente 1 a 10, más preferentemente 1 a 6 átomos de carbono y pueden ser de cadena recta o ramificada. De manera similar, a menos que se especifique de otra manera, los radicales alcoxi y las porciones alcoxi de otros radicales contienen de 1 a 6 átomos de carbono y pueden ser de cadena recta o ramificada.

50

[0015] Las porciones alquilo de radicales dialquilamino y de otros radicales que tienen porciones dialquilamino pueden ser iguales o diferentes, por ejemplo, N, N-dimetilamino, N, N-dietilamino y (N-etil-N-metil)amino.

[0016] La palabra 'halo' empleada aquí delante del nombre de un radical significa que el radical está sustituido por uno o más átomos halógenos, que pueden ser iguales o diferentes. Así, el término 'haloalquilo' empleado aquí significa un alquilo que lleva como sustituyentes uno o más átomos halógenos, que pueden ser iguales o diferentes, e incluye de este modo monohaloalquilo y polihaloalquilo (es decir, que tiene más de un sustituyente halógeno), incluyendo el último término a su vez el perhaloalquilo (es decir, completamente sustituido por átomos halógenos). El término 'haloalcoxi' incluye de manera similar monohaloalcoxi y polihaloalcoxi, incluyendo este último a su vez perhaloalcoxi.

[0017] Las palabras 'halo' y 'halógeno' significan F, Cl, Br o I. Cuando hay más de un átomo halógeno presente como sustituyente, tal como en un anillo fenilo, entonces pueden ser iguales o diferentes.

[0018] La invención se refiere además a composiciones de dichos compuestos y procedimientos, que emplean a dichos compuestos, para el control de plagas de artrópodos, nemátodos, helmintos o protozoos. En particular, se refiere a la aplicación de compuestos o composiciones de los mismos en procedimientos de utilización agrícola, en particular como pesticidas.

[0019] En la presente especificación, la palabra iminas se utiliza para denominar compuestos que comprenden al grupo C=NR.

[0020] Según un aspecto, la presente invención proporciona compuestos para su uso en el control de plagas de artrópodos, nemátodos, helmintos y protozoos, teniendo dichos compuestos la fórmula general (I). Según otro aspecto, la presente invención proporciona una composición pesticida (es decir una composición artrópodoicida, nematocida, anti-helminto o anti-protozoo) que comprende una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida (es decir una cantidad eficaz contra artrópodos, nematodos, anti-helminto o anti-protozoo) de un compuesto de fórmula (I) y un portador inerte aceptable para agricultura. La expresión 'un compuesto de fórmula (I)' empleada aquí y a lo largo de esta solicitud incluye en su ámbito las diversas formas estereoisoméricas de los compuestos de fórmula (I).

[0021] Según otro aspecto adicional, la invención proporciona un procedimiento para controlar plagas de artrópodos, nemátodos, helmintos o protozoos en un lugar, comprendiendo dicho procedimiento aplicar a dicho lugar una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida (es decir una cantidad eficaz contra artrópodos, nematodos, anti-helminto o anti-protozoo) de un compuesto de fórmula (I) o de una composición pesticida tal como se definió anteriormente, con la condición de que el lugar no sea un animal.

[0022] Según otro aspecto adicional, la invención proporciona el uso de compuestos de fórmula (I), tal como se definió anteriormente, para la preparación de una composición para controlar plagas en un lugar:

[0023] Algunos de los compuestos preferidos de la presente invención tienen una o más de las siguientes características donde:

R^{14} es CF_3 , OCF_3 o SF_5 ;

n es 1; o

NR^8R^9 es NH_2 o NHR^9 .

[0024] Algunos de los compuestos preferidos de la presente invención incluyen uno o más de las características establecidas en relación con las siguientes clases de compuestos preferidos:

[0025] Una clase de compuestos preferidos comprende aquellos en los cuales:

R^{14} es CF_3 , OCF_3 , o SF_5 .

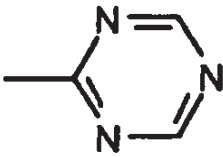
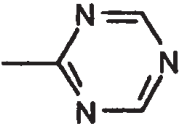
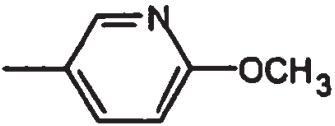
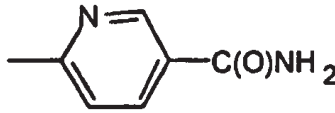
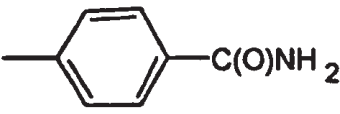
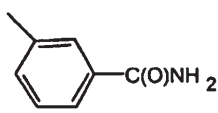
[0026] Una clase de compuestos preferidos comprende aquellos en los cuales:

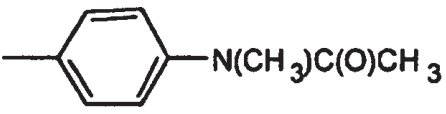
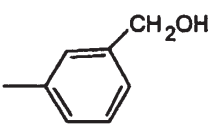
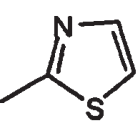
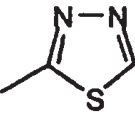
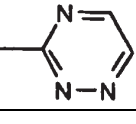
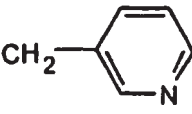
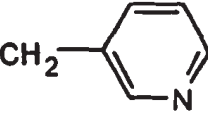
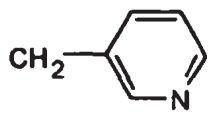
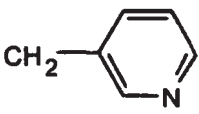
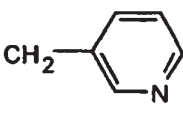
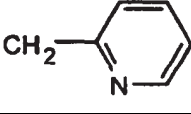
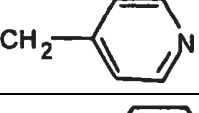
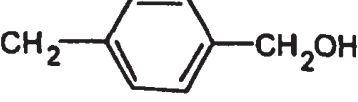
NR^8R^9 es amino o alquilamino, donde el alquilo es alquilo C_1 - C_6 con opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, NO_2 , CN, CHO, OH, alcoxi C_1 - C_6 , alquiltio C_1 - C_6 , alquilsulfinito C_1 - C_6 , alquilsulfonilo C_1 - C_6 , (alcoxi C_1 - C_6)carbonilo, hidroxicarbonilo, y carbamoil.

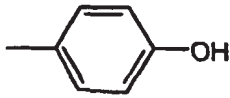
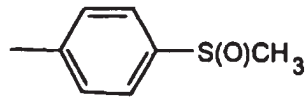
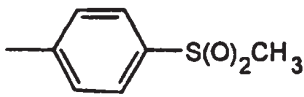
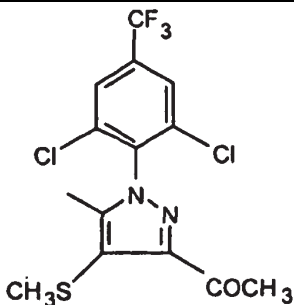
[0027] Algunos compuestos que son particularmente valiosos en la invención son compuestos en los que $R^{12} = R^{16} = Cl$; $R^{14} = CF_3$; $NR^8R^9 = NH_2$ y $S(O)_nR^{11}$ y R^{31} son según se indica en la siguiente tabla:

ES 2 374 806 T3

$S(O)_nR^{11}$	R^{31}
SOCH ₃	CH ₃
SOCH ₃	C ₂ H ₅
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ Ph
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)NH ₂
SOCH ₃	CH ₂ C(O)CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ C(O)OCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH ₂ C(O)OC ₂ H ₅
SOCH ₃	CH ₂ OCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ NO ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅
SOCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH ₂ COOH
SCH ₃	CH ₂ COOH
S(O)C ₂ H ₅	CH ₂ COOH
S(O) ₂ C ₂ H ₅	CH ₂ COOH
SC ₂ H ₅	CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH(CH ₃)COOCH ₃
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ CON ₂
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ SCH ₃
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CONH ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ -4-imidazole
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)-4-imidazole
SOCH ₃	CH(COOC ₂ H ₅)CH(CH ₃)CH ₂ -C ₂ H ₅
SOCH ₃	CH(COOC ₂ H ₅)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
SOCH ₃	(CH ₂) ₄ CH(NH ₂)COOH
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ CH ₂ SCH ₃
SOCH ₃	CH(COOH)(CH ₂) ₃ CH ₃
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
S(O) ₂ CH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH(NH ₂)COOCH ₃

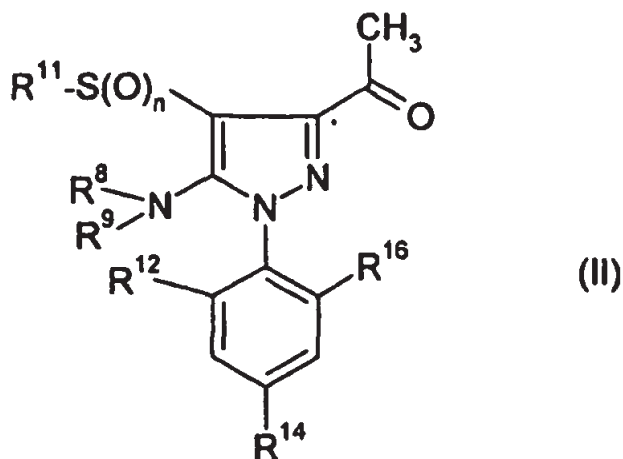
SOCH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH(NH ₂)(COOCH ₃)
SOCH ₃	C(COOCH ₃)(SH)CH(CH ₃) ₂
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ C ₆ H ₅
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ OH
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)(OH)CHCH ₃
SOCH ₃	CH(COOC ₂ H ₅)CH ₂ C ₆ H ₄ (4-OH)
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH(CH ₃) ₂
SOCH ₃	(CH ₂) ₄ COOH
SOCH ₃	(CH ₂) ₅ COOH
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH(OH)CH ₃
SOCH ₃	2- piridilo
SCH ₃	2- piridilo
S(O)C ₂ H ₅	2- piridilo
S(O) ₂ C ₂ H ₅	2- piridilo
SC ₂ H ₅	2- piridilo
SOCH ₃	3- piridilo
SOCH ₃	4- piridilo
SO ₂ CH ₃	2- piridilo
SOCH ₃	
SO ₂ CH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	

SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SCH ₃	
S(O)C ₂ H ₅	
S(O) ₂ C ₂ H ₅	
SC ₂ H ₅	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	

SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SCH ₃	

[0028] En la siguiente descripción, los símbolos que no están específicamente definidos deben entenderse como « anteriormente definidos ».

[0029] Los compuestos de fórmula (I) se pueden preparar por reacción de los compuestos de fórmula (II) con una amina



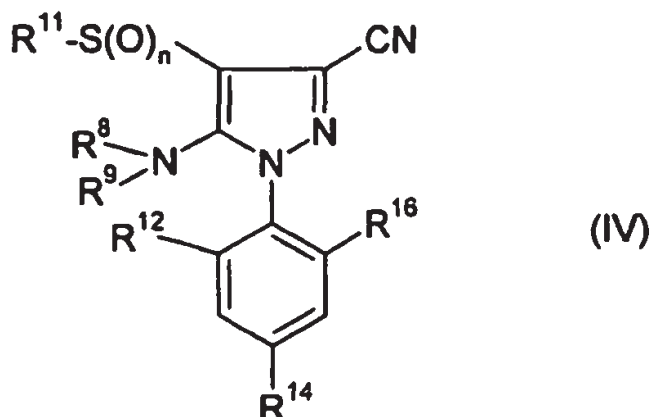
de fórmula (III) adecuada: R³¹-NH₂.

[0030] Esta transformación es esencialmente una deshidratación que puede realizarse preferentemente en presencia de un disolvente. La temperatura de reacción para lograr la transformación puede estar en el intervalo que va desde aproximadamente -78°C a aproximadamente 200°C, preferentemente entre aproximadamente -20°C y aproximadamente 120°C. Los catalizadores tales como los agentes deshidratantes pueden ser de ayuda. Entre los posibles agentes deshidratantes, se pueden mencionar bases o ácidos o cribas moleculares.

[0031] La reacción puede llevarse a cabo en una variedad de disolventes incluyendo disolventes aromáticos orgánicos, tales como el benceno, tolueno, xylene; alcoholes, tales como el metanol, etanol, isopropanol, etilenglicol, propilenglicol; éteres, tales como el tetrahydrofurano, etil éter, dimethoxietano, diglyme, dioxano, éteres de corona; hidrocarburos halogenados, tales como el cloruro de metileno, el cloroformo; amidas, tales como la dimetilformamida; cetonas, tales como la acetona. La reacción también se puede llevar a cabo en un disolvente mezclado. La eliminación azeotrópica del agua es a menudo útil cuando es posible.

[0032] Algunos ejemplos de catalizadores para su uso en la transformación de arriba incluyen hidróxidos metálicos alcalinos y trialkilaminas así como catalizadores ácidos inorgánicos y orgánicos. Algunos ejemplos de estos dos últimos catalizadores son el ácido hidrocórico y el ácido p-toluensulfónico.

[0033] Los compuestos de fórmula (II) se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula (IV)



5 por reacción con un reactivo de Grignard que comprende un compuesto de organomagnesio de fórmula $R^{31}\text{-Mg-X}$ donde X es un átomo halógeno, preferentemente cloro o bromo o yodo. El cloro es el más preferido. La reacción se lleva a cabo en un disolvente líquido (tal como un éter, un haloalcano, un disolvente aromático, una amida, o una mezcla de los mismos) a una temperatura que va desde aproximadamente -70°C hasta aproximadamente 150°C según el reactivo y el disolvente exactos.

[0034] Los reactivos de fórmula (IV) se pueden preparar según los procedimientos descritos en el estado de la técnica citados más arriba.

- 10 [0035] En las diversas transformaciones anteriormente descritas, es evidente que los sustituyentes seleccionados pueden a veces interferir en las reacciones consideradas. Estos efectos se pueden evitar empleando grupos de protección adecuados que eviten las reacciones secundarias no deseadas. También es posible emplear reactivos que no afecten a los grupos funcionales diferentes de aquellos que se quieren cambiar. La elección particular de los grupos de protección adecuados y de los reactivos se entenderán fácilmente por los expertos en la materia.
- 15 [0036] El uso de Artículos químicos y de cualquier base de datos química disponible se considera y se sugiere como parte del conocimiento del experto en la materia para escoger la forma de trabajar adecuada según las diversas técnicas descritas en la presente descripción.

[0037] Para ilustrar también la presente invención y las ventajas que aporta, se dan los siguientes ejemplos.

EJEMPLO 1

- 20 preparación de N-Fenil-5-amino-1-[2, 6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-metilsulfinil-1H-pirazol-3-il)etanimina (compuesto número 6):

[0038] Una mezcla agitada de 3-acetil-5-amino-1-[2, 6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-metilsulfinil-1H-pirazole (1.0 g, 2.5 mmol), ácido p-toluensulfónico (47.5 mg, 0.25 mmol), anilina (232.5 mg, 2.5 mmol) y benceno (20 ml) se calentó 15 h a reflujo con eliminación de agua. La mezcla se evaporó, entonces se hizo cromatografía para dar como resultado 360 mg de compuesto número 6 (punto de fusión a aproximadamente 179°C).

EJEMPLO 2

Preparación de N-(Metoxicarbonilamino)-[5-amino-1-(2, 6-dicloro-4-trifluorometil)fenil-4-metilsulfinil-1H-pirazol-3-il]etanimina (compuesto número 2):

- [0039] Una mezcla de 3-acetil-5-amino-1-[2, 6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-metilsulfinil-1H-pirazole (1 g, 2.5 mmol), metoxicarbonilidrazina (0.236 g, 2.625 mmol) y metanol (10 ml) se agitó durante 2 días a 20°C . La mezcla se evaporó, entonces se hizo cromatografía para dar como resultado 536 mg de compuesto número 2 como un polvo blanco (punto de fusión de aproximadamente 121°C).

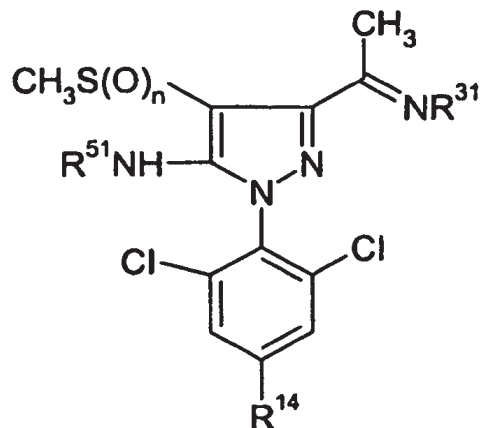
EJEMPLO 3

- Preparación de N-[[[1-[[5-Amino-1-[2, 6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(metiltio)-1H-pirazol-3-il]etilidene]]]-4-(metiltio)-3-[1-(fenilamino)etil]-1H-pirazole-5-amina (compuesto número 22):

[0040] Una mezcla agitada del producto del ejemplo 1 (2.5 g, 5.5 mmol) en metanol (25 ml) se trató con borohidruro de sodio (0.41 g, 11 mmol) a temperatura ambiente. El metanol se eliminó a presión reducida y el residuo se distribuyó entre el cloruro de metileno y el agua. La fase orgánica resultante se secó sobre sulfato de sodio, se filtró, se concentró y se purificó por cromatografía de columna para proporcionar 77 mg de compuesto número 22 (punto de fusión a aproximadamente 189°C).

[0041] En general los compuestos de la tabla I siguiente se pueden preparar por adaptación de los procedimientos de los ejemplos anteriores y por modificaciones de esto tal como sabe un experto en la materia. Cuando no se dispngna de punto de fusión los compuestos se caracterizaron mediante espectrometría de masas.

[0042] Los compuestos de la tabla (I) tienen la fórmula general:

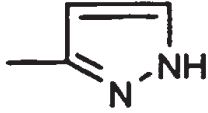
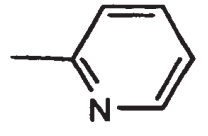
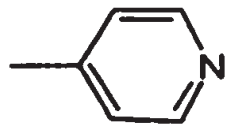
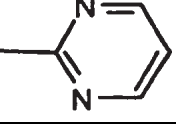
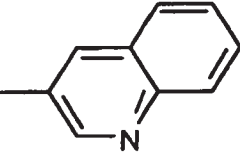
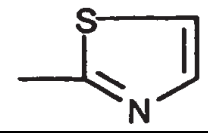
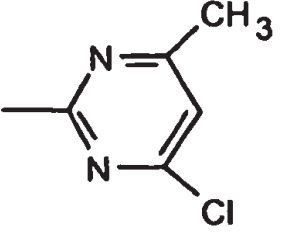
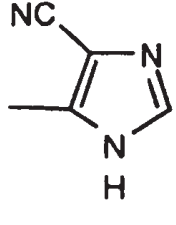


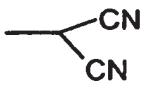
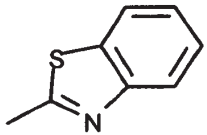
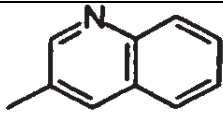
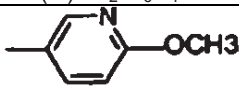
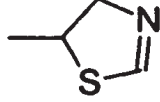
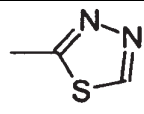
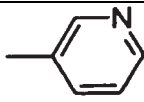
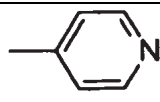
5

Tabla I

Compuesto	R ³¹	n	R ⁵¹	R ¹⁴	Punto de fusión[°C]	de
1	NH ₂	1	H	CF ₃	212	
2	NHC(O)OCH ₃	1	H	CF ₃	121	
5	NHC(O)NH ₂	1	H	CF ₃	114	
6	fenil	1	H	CF ₃	179	
7	CH ₂ CH ₂ OH	1	H	CF ₃	93	
8		0	H	CF ₃	aceite	
12	4-(OCH ₃)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	aceite	
14	NHC(O)NHN=C(CH ₃) ₂	1	H	CF ₃	209	
16	3-(OCH ₃)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	95	
17	4-ClC ₆ H ₄	1	H	CF ₃	165	
18	3-BrC ₆ H ₄	1	H	CF ₃	176	
19	3-NO ₂ C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	170	
21	NHC(S)NHN=C(CH ₃) ₂	1	H	CF ₃	200	

22		0	H	CF ₃	189
24	4-NO ₂ C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	aceite
25	3-CNC ₆ H ₄	1	H	CF ₃	95
26	4-CNC ₆ H ₄	1	H	CF ₃	131
27	3-SCH ₃ C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	107
30	4-F-C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	191
31	CH ₂ COOCH ₃	1	H	CF ₃	aceite
32	3-ClC ₆ H ₄	1	H	CF ₃	162
33	2-FC ₆ H ₄	1	H	CF ₃	163
34	4-CF ₃ C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	156
35	CH ₂ Ph	1	H	CF ₃	188
36	3-FC ₆ H ₄	1	H	CF ₃	175
37	4-CH ₃ C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	85
42	(3-CH ₃)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	166
46	CH ₂ -(2-tetrahidrofurano)	1	H	CF ₃	90
47	CH ₂ -(2-furan)	1	H	CF ₃	88
48	CH ₂ CH=CH ₂	1	H	CF ₃	134
49	(2-CH ₃)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	72
50	C ₆ H ₅	2	H	CF ₃	186
60	(4-CF ₃)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	75
71	CH ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
73	CH ₂ (2, 4-C ₁₂ -C ₆ H ₃)	1	H	CF ₃	
74	CH ₂ -(2-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
75	CH ₂ -(2-F-C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
76	CH ₂ -(3-F-C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
77	CH ₂ -(4-F-C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
78	CH ₂ -(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
79	CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	1	H	CF ₃	
80	CH ₂ -(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
81	CH ₂ -(3-CH ₃ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
82	CH ₂ -(4-CH ₃ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
83	CH ₂ -(2-CF ₃ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
84	CH ₂ -(4-CF ₃ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
85	CH ₂ -(3-CF ₃ -C ₆ H ₄)	1	H	CF ₃	
86	(4-Br)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	

88	(4-NHC(O)CH ₃)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	
96	(4-OCH ₃)C ₆ H ₄	2	H	CF ₃	80
98	(2-SCH ₃)C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	191
99	(3-NO ₂)C ₆ H ₄	2	H	CF ₃	195
102	(4-Cl)C ₆ H ₄	2	H	CF ₃	191
105		1	H	CF ₃	
106		1	H	CF ₃	
107		1	H	CF ₃	
108		1	H	CF ₃	
109		1	H	CF ₃	
110		1	H	CF ₃	
111		1	H	CF ₃	
112		1	H	CF ₃	

113		1	H	CF ₃	
115		1	H	CF ₃	
116		1	H	CF ₃	
119	4-C ₆ H ₅ O-C ₆ H ₅	2	H	CF ₃	196
121	3-C(O)NH ₂ -C ₆ H ₄	1	H	CF ₃	
122		1	H	CF ₃	
123		1	H	CF ₃	
124		1	H	CF ₃	
125		1	H	CF ₃	
126		1	H	CF ₃	
127	CH ₂ CH ₂ C(O)OCH ₃	1	H	CF ₃	69
128	CH ₂ C≡CH	1	H	CF ₃	127
129	C(CH ₂) ₅ CH ₃	1	H	CF ₃	114
130	C(CH ₂) ₄ CH ₃	1	H	CF ₃	132
131	C(CH ₂) ₃ CH ₃	1	H	CF ₃	131
132	CH(CH ₃) ₂	1	H	CF ₃	194
133	CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	H	CF ₃	129
134	(CH ₂) ₆ CH ₃	1	H	CF ₃	108
135	(CH ₂) ₇ CH ₃	1	H	CF ₃	124
136	(CH ₂) ₈ CH ₃	1	H	CF ₃	125
137	(CH ₂) ₉ CH ₃	1	H	CF ₃	83
138	(CH ₂) ₁₈ CH ₃	1	H	CF ₃	
139	(CH ₂) ₁₇ CH ₃	1	H	CF ₃	64
140	(CH ₂) ₁₁ CH ₃	1	H	CF ₃	
141	(CH ₂) ₁₃ CH ₃	1	H	CF ₃	
142	(CH ₂) ₁₀ CH ₃	1	H	CF ₃	
143	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1	H	CF ₃	
144	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1	H	CF ₃	138

145	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	1	H	CF ₃	150
146	CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃) ₂	1	H	CF ₃	178
147	(CH ₂) ₁₂ CH ₃	1	H	CF ₃	
148	(CH ₂) ₁₅ CH ₃	1	H	CF ₃	56

[0043] Los siguientes ejemplos ilustran el uso de los compuestos de la invención en el control de plagas.

[0044] Las especies probadas fueron las siguientes:

GENERO, especies	NOMBRE COMÚN
5 <i>Aphis gossypii</i>	Áfido de la hoja del algodón
<i>Musca domestica</i>	Mosca doméstica
<i>Diabrotica virgifera</i>	Gusano de la raíz del maíz occidental
<i>Periplaneta americana</i>	Cucarachas americanas
<i>Spodoptera eridania</i>	Gusano cogollero
10 <i>Schizaphis graminum</i>	Pulgón verde
<i>Ctenocephalides felis</i>	Pulga del gato
<i>Rhipicephalus sanguineas</i>	Garrapata marrón del perro

Prueba de rociado del suelo (Actividad sistémica)

- 15 [0045] Se pusieron plantas de algodón y sorgo en tiestos. Un día antes del tratamiento, cada tiesto se infestó con aproximadamente 25 áfidos de población mezclada. Las plantas de algodón se infestaron con áfidos y las plantas de sorgo se infestaron con pulgón verde. El compuesto de fórmula (I) se aplicó a la superficie del suelo con una dilución que suministraba el equivalente de una concentración de 10.0 ppm peso de suelo. Se contaron los áfidos a los 5 días tras el tratamiento. El número de áfidos en las plantas tratadas se comparó con el número de áfidos en las plantas de control sin tratar. Estas pruebas mostraron una actividad sistémica (migración del ingrediente activo).

Test de Cebo/ Contacto con mosca

- 25 [0046] Aproximadamente 25 moscas domésticas adultas de cuatro a seis días de edad se anestesiaron y pusieron en una jaula con una solución cebo con agua azucarada que contenía el compuesto. La concentración del compuesto de fórmula (I) aplicado en la solución de cebo era de 50 ppm. Después de 24 horas, se consideraron como muertas aquellas moscas que no mostraban movimiento al ser estimuladas.

Aplicación foliar (Test de contacto) con Áfidos

[0047] Se pusieron plantas de algodón infestadas de áfidos sobre un plato giratorio, y se rociaron con una formulación a 100 ppm del compuesto de fórmula (I) aplicado. Las plantas infestadas con *A. gossypii* se mantuvieron durante tres días después del tratamiento, tras los cuales se contaron los áfidos muertos.

- 30 [0048] Los resultados obtenidos son tal como se indica a continuación (En esta tabla 'X' significa actividad alta; '+' significa actividad moderada; '-' significa actividad baja; y 'NT' significa que no hay actividad.):

Compuesto número	Actividad sistémica en áfidos	Actividad sistémica en el pulgón verde	Actividad sobre la mosca doméstica por contacto	Actividad foliar en áfidos
1	+	X	X	X
2	-	-	X	-
5	-	-	X	X
6	X	X	NT	X
7	+	X	X	X
8	-	-	X	-
12	X	X	X	X
14	-	X	X	-
16	X	X	X	+
17	X	X	X	X
18	+	X	X	X
19	X	X	X	-

ES 2 374 806 T3

21	+	+	X	-
22	-	-	+	X
24	X	X	NT	NT
25	X	X	X	X
26	+	X	X	X
27	+	X	X	X
30	+	X	X	-
31	+	X	X	X
32	X	X	X	-
33	+	X	X	X
34	+	X	X	X
35	X	X	X	X
36	X	X	X	-
37	+	X	X	X
42	+	X	X	X
46	X	X	X	X
47	X	X	X	X
48	+	X	X	X
49	X	X	X	X
50	X	X	X	X
60	X	X	X	X
71	+	X	X	X
74	+	X	X	X
75	X	X	X	X
76	+	X	X	X
77	X	X	X	X
78	X	X	X	X
79	X	X	X	X
80	X	X	X	X
81	X	X	X	X
82	+	X	X	X
83	+	X	X	X
84	X	X	X	X
85	X	X	X	X
86	-	+	-	X
88	NT	NT	X	X
96	+	X	X	NT
98	+	X	X	-
99	+	+	X	+
102	+	X	X	X
105	+	X	X	-
106	NT	NT	X	X
107	NT	NT	X	-
108	NT	NT	X	X

109	NT	NT	X	NT
110	+	X	X	X
111	-	+	+	-
112	NT	NT	X	+
113	-	X	-	-
115	+	X	X	X
116	-	X	X	X
119	X	X	X	X
121	X	X	X	+
122	X	X	X	
123	X	X	X	-
124	X	X	-	
125	X	X	X	
126	X	X	X	-
127	X			
128	X	X	X	-
129	X	X	-	
130	X	X	-	
131	X	X	-	
132	X	X	-	
133	X	X	-	
134	-	X	X	-
135	X	-	-	
136	X	X	X	-
137	X	X	X	-
138	X	X	X	-
139	+	X	X	-
140	X	X	X	-
141	X	X	X	
142	X	X	-	
143	X	X	-	
144	X	X	-	-
145	X	X	X	+
146	+	X	X	X
147	X	X	-	-
148	X	X	+	-

'X' = actividad alta; '+' = actividad moderada; '-' = actividad baja; y 'NT' = no hay actividad.

La presente invención proporciona un procedimiento para controlar plagas en un lugar, comprendiendo dicho procedimiento aplicar a dicho lugar una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida de un compuesto de fórmula (I) o una sal de los mismos aceptable como pesticida o una composición que contiene el ingrediente activo, con la condición de que el lugar no es un animal.

[0049] El procedimiento es preferentemente útil para el control sistémico de artrópodos en un lugar, especialmente algunos insectos o ácaros que se nutren de las partes de las plantas que están por encima del suelo. El control de estas plagas foliares puede proporcionarse por aplicación foliar directa o por aplicación mediante, por ejemplo, rociado del suelo o aplicación de gránulos a las raíces o semillas de las plantas con translocación sistémica posterior de las partes de las plantas que están por encima del suelo. Esta actividad sistémica incluye el control de insectos

- que residen no sólo en el punto de aplicación sino también en una parte remota de la planta, por ejemplo, por translocación de uno a otro lado de una hoja o de una hoja sin tratar a una hoja tratada. Algunos ejemplos de clases de plagas de insectos que pueden controlados sistémicamente por los compuestos de la invención incluyen el orden *Homoptera* (perfora-chupa), el orden *Hemiptera* (perfora-chupa), y el orden *Thysanoptera*. La invención es especialmente adecuada para los áfidos y los trips.
- [0050]** Como es evidente a partir del uso pesticida anterior, la presente invención proporciona compuestos activos como pesticidas y procedimientos de utilización de dichos compuestos para el control de varias plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o ácaros; nematodos de planta; o plagas de helmintos o protozoos. Los compuestos de fórmula (I) o las sales de los mismos aceptables como pesticidas se emplean ventajosamente en utilización práctica, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, silvicultura, medicina veterinaria o cría de ganado, o en la salud pública. A partir de aquí, siempre que se utilice el término "compuestos de fórmula (I)" se utiliza este término abarca compuestos de fórmula (I) o sus sales aceptables como pesticidas. El término "compuesto de fórmula (I) abarca un compuesto de fórmula (I) o sal de los mismos aceptable como pesticida.
- [0051]** Por lo tanto, la presente invención proporciona un procedimiento de control de plagas en un lugar que comprende el tratamiento del lugar (por ejemplo, por aplicación o administración) con una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula (I) o una sal de los mismos aceptable como pesticida, donde los grupos sustituyentes son tal como se ha definido más arriba, con la condición de que el lugar no es un animal. El lugar incluye, por ejemplo, la propia plaga o el lugar (planta, campo, estructura, locales, bosque, huerto, vía de agua, suelo, producto de planta o animal o similares) donde se alimenta o reside la plaga.
- [0052]** Los compuestos de la presente invención se pueden utilizar para el control de insectos de tierra, tales como el gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de raíz, gusanos de alambre, gorgojos de raíz, barrenadores del tallo, gusanos cortadores, áfidos de la raíz o larvas. También se pueden utilizar para proporcionar una actividad contra nemátodos patogénicos de plantas, tales como nemátodos de los nódulos, quiste, daga, lesión o del tallo o el bulbo, o contra ácaros. Para el control de plagas de tierra, por ejemplo, el gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican de manera ventajosa o se incorporan en una relación eficaz en la tierra en la que se plantan o se van a plantar los cultivos o a las semillas o raíces de las plantas en crecimiento.
- [0053]** En el área de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la porquería u otras plagas de *Diptera*, tales como, moscas domésticas, moscas de los establos, moscas soldados, moscas del cuerno, moscas del venado, tábanos, mosquitos pequeños, "punkies", moscas prietas, o mosquitos.
- [0054]** Los compuestos de la invención se pueden utilizar en las siguientes aplicaciones y en las siguientes plagas incluyendo plagas de artrópodos, especialmente insectos o ácaros, nematodos o protozoos.
- [0055]** En la protección de productos almacenados, por ejemplo, cereales, incluyendo grano o harina, cacahuetes, alimento de animales, madera o utensilios domésticos, por ejemplo, alfombras y tejidos, los compuestos de la presente invención son útiles contra el ataque por artrópodos, más especialmente escarabajos, incluyendo, gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo *Ephestia* spp. (polillas de la harina), *Anthrenus* spp. (escarabajos de alfombra), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos de grano) o *Acarus* spp. (ácaros).
- [0056]** En el control de cucarachas, hormigas o termitas o plagas de artrópodos similares en instalaciones domésticas o industriales infestadas o en el control de larvas de mosquitos en canales, pozos, depósitos u otras fuentes de agua corriente o estancada.
- [0057]** Para el tratamiento de cimientos, estructuras o tierra en la prevención del ataque en la construcción por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp., *Coptotermes* spp.
- [0058]** En la agricultura contra adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y polillas), por ejemplo, *Heliothis* spp. tal como *Heliothis virescens* (gusano cogollero), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), por ejemplo, *Anthonomus* spp., por ejemplo, *grandis* (gorgojo del tallo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz del maíz). Contra heterópteros (*Hemiptera* y *Homoptera*), por ejemplo, *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltamontes de las hojas de arroz), *Nilaparvata* spp.
- Contra dípteros, por ejemplo, *Musca* spp. Contra *Thysanoptera*, tales como *Thrips tabaci*. Contra *Orthoptera*, tales como *Locusta* y *Schistocerca* spp., (langostas y grillos), por ejemplo *Gryllus* spp., y *Acheta* spp., por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides*, y *Schistocerca gregaria*. Contra *Collembola*, por ejemplo, *Periplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucarachas). Contra *Isóptera*, por ejemplo *Coptotermes* spp. (termitas).
- [0059]** Contra artrópodos de importancia agrícola, tales como *Acari* (ácaros), por ejemplo, *Tetranychus* spp., y *Panonychus* spp.,

[0060] Contra nemátodos que atacan plantas o árboles de importancia para la agricultura, silvicultura, u horticultura de forma directa o mediante la expansión de enfermedades bacterianas, virales, por micoplasma o fúngicas de las plantas. Por ejemplo, los nemátodos de nódulos, tales como *Meloidogyne* spp. (por ejemplo, *M. incognita*).

[0061] En el campo de la medicina veterinaria o la cría de ganado o en el mantenimiento de la salud pública contra artrópodos que son parasitarios de forma interna o externa sobre los vertebrados, particularmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo, animales domésticos, por ejemplo, ternera, oveja, cabra, equinos, cerdos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo Acarina, incluyendo garrapatas por ejemplo *Ixodidae* spp., *Boophilus* spp., por ejemplo, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp., por ejemplo, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Omithodorus* spp. (por ejemplo *Omithodorus moubata*) y ácaros (por ejemplo *Damalinia* spp.); Diptera (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); Hemiptera.; Dictyoptera (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blatella* spp.); Hymenoptera; por ejemplo, contra infecciones del tracto gastrointestinal causadas por gusanos nemátodos parasitarios, por ejemplo, miembros de la familia *Trichostrongylidae*. En el control y tratamiento de enfermedades provocadas por protozoos de, por ejemplo *Eimeria* spp. por ejemplo *Trypanosoms cruzi*, *Leishaminia* spp., *Plasmodium* spp., *Babesis* spp., *Trichomonadidae* spp., *Toxoplasma* spp. y *Theileria* spp.

[0062] En el uso práctico para el control de artrópodos, especialmente, insectos o ácaros, especialmente plagas de nemátodos de plantas, un método, por ejemplo, comprende aplicar a las plantas o al medio en el que crecen una cantidad eficaz de un compuesto de la presente invención. Para dicho método, el compuesto de la presente invención se aplica generalmente al foco en el que va a controlarse la infestación por artrópodos o nemátodos en una relación eficaz en el intervalo de aproximadamente 5 g a aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea del foco tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga a controlar, una relación inferior puede ofrecer una protección adecuada. Por otro lado, las condiciones climáticas adversas, la resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el principio activo se utilice en relaciones más elevadas. La relación óptima depende normalmente de una serie de factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se controla, el tipo o la etapa de crecimiento de la planta infestada, el espacio entre las hileras o también el método de aplicación. Más preferentemente, un intervalo de relación eficaz del compuesto activo es de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 400 g/ha.

Cuando una plaga se encuentra en la tierra, el compuesto activo generalmente en una composición formulada, se distribuye uniformemente sobre el área a tratar (es decir, por ejemplo, tratamiento por difusión o bandas) de cualquier manera práctica y se aplica en relaciones de aproximadamente 5 g/ha a aproximadamente 1 kg ai/ha, preferentemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 250 g ai/ha. Cuando se aplica por inmersión de la raíz a plántulas o irrigación discontinua a plantas, la solución líquida o suspensión contiene de aproximadamente de 0, 075 a aproximadamente 1000 mg al/l, preferentemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ai/l. La aplicación se puede realizar, si se desea, al campo o el área de crecimiento del cultivo generalmente o próxima a la semilla o planta a proteger del ataque. El compuesto de la presente invención se puede lavar en la tierra mediante la pulverización con agua sobre el área o se puede dejar a la acción natural de la lluvia. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado, si se desea, se puede distribuir mecánicamente en la tierra, por ejemplo mediante arado, disqueo o el uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede ser anterior a la plantación, en la plantación o después de la plantación, pero antes o después de que haya brotado.

[0063] Los compuestos de la presente invención y los procedimientos del control de plagas con los mismos son particularmente valiosos en la protección del campo, forraje, plantaciones, invernaderos, huertos o cultivos de viñas, de plantas ornamentales, árboles de plantación o forestales, por ejemplo: cereales (tales como, trigo o arroz), algodón, hortalizas (tales como, pimientos), cosechas del campo (tales como, remolacha azucarera, soja o colza oleaginosa), cosechas de pradera o forraje (tales como, maíz o sorgo), huertas o arboledas (tales como, de fruto de hueso o pepita o cítricos), plantas ornamentales, flores u hortalizas o matas en invernaderos o en jardines o parques, o árboles forestales (tanto de hoja caduca como perenne) en bosques, plantaciones o viveros.

[0064] También son valiosos en la protección de madera (en pie, caída, convertida, almacenada o estructural) del ataque, por ejemplo, por moscas de sierra o escarabajos o termitas.

[0065] Presentan aplicaciones en la protección de productos almacenados, tales como granos, frutas, frutos secos, especies o tabaco, tanto de forma completa, molidos o compuestos en productos, del ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos de grano. También se protegen los productos de animales almacenados, tales como pieles, pelo, lana o plumas de forma natural o convertida (por ejemplo, como alfombras o tejidos) del ataque de polillas o escarabajos, así como carne, pescado o granos almacenados del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.

[0066] Adicionalmente, el compuesto de la presente invención y los procedimientos de uso del mismo son particularmente valiosos en el control de artrópodos, helmintos o protozoos que son perjudiciales, o se extienden o actúan como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, los mencionados anteriormente, y más especialmente en el control de pulgas, ácaros, piojos, pulgas, mosquitos pequeños o moscas por mordedura, molestia o con miasis. Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles en el control de artrópodos, helmintos o protozoos que están presentes en animales huésped domésticos o que se alimentan de la

piel o sobre la misma o chupan la sangre del animal, para cuyo objetivo se pueden administrar de manera oral, parenteral, percutánea o tópica.

- [0067]** Además, los compuestos de la invención pueden usarse en el tratamiento de la coccidiosis, una enfermedad causada por infecciones por parásitos protozoarios del género *Elmeria*. Es una posible causa importante de pérdidas económicas en los animales domésticos y aves, en particular las planteadas o mantenidas bajo condiciones intensivas. Por ejemplo, pueden ser afectados vacas, ovejas, cerdos o conejos, aunque la enfermedad es especialmente importante en aves de corral, especialmente en los pollos. La administración de una pequeña cantidad de un compuesto de la invención, preferentemente mediante una combinación con el alimento es eficaz en la prevención o la reducción de la incidencia de la coccidiosis. Los compuestos son eficaces frente a la forma cecal y las formas intestinales. Además, los compuestos de la invención también puede ejercer un efecto inhibitor sobre los ovocitos por reducir considerablemente el número y la esporulación de los que se producen. La enfermedad de las aves es generalmente transmitida por las aves al recoger el organismo infeccioso de las heces o en lechos contaminados, tierra, alimentos, o agua para beber. La enfermedad se manifiesta por la hemorragia, la acumulación de sangre en el ciego, el paso de sangre a los excrementos, debilidad y trastornos digestivos. La enfermedad a menudo termina con la muerte del animal, pero las aves que sobreviven a las infecciones graves ven su valor de mercado sustancialmente reducido a causa de la infección.

- [0068]** Los compuestos descritos a continuación para la aplicación en cultivos en crecimiento o focos en crecimiento de cultivos o como la preparación de la semilla se pueden utilizar, en general, alternativamente, en la protección de productos almacenados, utensilios domésticos, propiedades o áreas del medio general. Los medios adecuados de aplicación de los compuestos de la presente invención incluyen: a cultivos en crecimiento como pulverizadores foliares (por ejemplo, como un pulverizador en surcos), polvos, gránulos, vapores o espumas o también como suspensiones de composiciones finamente divididas o encapsuladas; como tratamientos de la tierra o la raíz mediante empapamiento líquido, polvos, gránulos, humos o espumas; a semillas de cultivos mediante la aplicación como preparación de semillas, por ejemplo, mediante emulsiones líquidas o polvos.

- [0069]** Los compuestos de la invención también sirven para su aplicación parenteral, oral o tópica para tratar animales infestados o expuestos a la infestación por artrópodos, helmintos o protozoos por ejemplo mediante la incorporación en el alimento o formulaciones farmacéuticas adecuadas ingeribles por vía oral, cebos comestibles, depósitos de sales, suplementos dietético, formulaciones de aplicación, pulverizadores, baños, por inmersión, duchas, chorros, polvos, grasas, champús, cremas, embadurnes con cera o sistemas de autotratamiento del ganado.

- [0070]** Los compuestos de la invención también sirven para su aplicación al medio en general o a localizaciones específicas donde las plagas merodean, incluyendo productos almacenados, madera, utensilios domésticos, o instalaciones domésticas o industriales, como pulverizadores, vapores, polvos, humos, embadurnes de cera, lacas, gránulos o cebos, o en una alimentación por goteo a canales, pozos, depósitos u otras fuentes de agua corriente o estancada.

- [0071]** Los compuestos de la invención sirven también para su uso en el control de larvas de mosca que se alimentan de las heces de los animales domésticos, uso en el que los compuestos se añaden a los piensos de los animales domésticos.

- [0072]** En la práctica, los compuestos de la presente invención la mayoría de las veces forman parte de composiciones. Estas composiciones se pueden utilizar para controlar artrópodos, especialmente insectos o ácaros; nemátodos o plagas de helmintos o protozoos. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica adecuado para la aplicación a la plaga deseada en cualquier instalación o área interna o externa o mediante administración interna o externa a vertebrados. Estas composiciones contienen por lo menos un compuesto de fórmula (I) o una sal de los mismos aceptable como pesticida, tal como las descritas más arriba, como ingrediente activo en combinación o asociación con uno o más de otros componentes compatibles que son, por ejemplo, portadores o diluyentes, adyuvantes, agentes tensoactivos, sólidos o líquidos, o similares, apropiados para el uso deseado y que son agrícolamente o medicinalmente aceptables. Estas composiciones, que se pueden preparar de cualquier manera conocida en la técnica, forman asimismo parte de la presente invención.

- [0073]** Las composiciones pueden contener también otros tipos de ingredientes tales como coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, aceites para spray (especialmente para su uso acaricida), estabilizantes, conservantes (especialmente los conservantes de moho), agentes secuestrantes, o similares, así como otros principios activos conocidos con propiedades plaguicidas (especialmente insecticidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas o) o con propiedades de regulación del crecimiento de las plantas. De manera más general, los compuestos empleados en la invención se pueden combinar con todos los aditivos sólidos o líquidos, correspondientes a las técnicas habituales de formulación.

- [0074]** Algunas composiciones, adecuadas para aplicaciones en agricultura, horticultura, o similares, incluyen formulaciones adecuadas para su uso como, por ejemplo, aerosoles, polvos, granulados, nieblas, espumas, emulsiones, o similares.

[0075] Las dosis de utilización efectivas de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de intervalos amplios, en especial en función de la naturaleza de la plaga a eliminar o el grado de infestación, por ejemplo, de plantaciones con estas plagas. En general, las composiciones según la invención suelen contener de aproximadamente 0.05 hasta aproximadamente 95% (en peso) de uno o más ingredientes activos según la invención, aproximadamente 1 hasta aproximadamente 95% de uno o más transportadores sólidos o líquidos y, opcionalmente, aproximadamente 0.1 hasta aproximadamente 50% de uno o más de otros componentes compatibles, tales como agentes tensoactivos o similares.

[0076] En la presente descripción, el término "transportador" indica un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con los que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, las semillas o al suelo. Por lo tanto, este transportador es en general inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, aceptable agrónomicamente, en especial para la planta tratada).

[0077] El transportador puede ser un sólido, por ejemplo, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo sales de amonio), minerales naturales del suelo, tales como caolinas, arcillas, talco, tiza, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra diatómea, o minerales naturales del suelo, tales como sílice, alumina, o silicatos, en especial silicatos de aluminio o magnesio. Como transportadores sólidos para gránulos son adecuados los siguientes: piedras naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de comida inorgánica u orgánica; gránulos de material orgánico tales como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, hojas de maíz o tallos de tabaco; kieselguhr, fosfato de tricalcio, corcho pulverizado, negro de carbono absorbente; polímeros solubles en agua, resinas, ceras; o fertilizantes sólidos. Estas composiciones sólidas pueden, si se desea, contener uno o más agentes humidificadores, dispersantes, emulsificadores o colorantes compatibles que, en estado sólido, también sirven como diluyentes.

[0078] El transportador también puede ser líquido, por ejemplo: agua, alcoholes, en especial butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, en especial acetato de metilglicol; cetonas, en especial acetona, ciclohexanona, metiletilo cetona, metilisobutilcetona, o isoforona; fracciones de petróleo tales como hidrocarburos de parafina o aromáticos, en especial xilenos o alquilo naftaleno; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos alifáticos clorados, en especial tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos aromáticos clorados, en especial clorobenzenos; disolventes solubles en agua o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetilo sulfóxido, o N-metilpirrolidona; gases líquidos; o similares o una mezcla de estos.

[0079] El agente tensoactivo puede ser un agente emulsificador, un agente dispersante o un agente humidificador de tipo iónico o no-iónico o una mezcla de estos agentes tensoactivos. Entre estos se cuentan por ejemplo, sales de ácidos poli acrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolesulfónicos o naftalenesulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (en especial alquilofenoles o arilfenoles), sales de ésteres ácidos sulfosuccínicos, derivados taurinos (en especial alquilo-tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos mencionados. La presencia de al menos un agente tensoactivo es en general esencial cuando el ingrediente activo y/o el transportador inerte son solamente ligeramente solubles o no solubles y el agente transportador de la composición para la aplicación es agua.

[0080] Las composiciones de la invención pueden contener también otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. Se pueden utilizar en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en la forma de polvos, gránulos o celdas, tales como goma arábiga, alcohol de polivinilo o acetato de polivinilo, fosfolípidos naturales, tales como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos. Es posible utilizar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul prusiano;

colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azo de metal o de ftalocianina, u oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno, o zinc.

[0081] Las composiciones que contienen compuestos de fórmula (I), o sales de los mismos aceptables como pesticidas, que pueden ser aplicadas al control de plagas de artrópodos, nematodos de plantas, helmintos o protozoos, también pueden contener sinérgicos (por ejemplo, butóxido de piperonilo o sesamex), la sustancias de estabilización, otros insecticidas, acaricidas, nematocidas de planta, antihelmínticos o anticoccidiales, fungicidas (agrícolas o veterinarios según el caso, por ejemplo, benomyl e iprodiona), bactericidas, artrópodos o atrayentes de vertebrados o repelentes o feromonas, desodorantes, agentes saborizantes, colorantes o agentes terapéuticos auxiliares, por ejemplo, oligoelementos. Estos se pueden diseñar para mejorar la potencia, la persistencia, la seguridad, la absorción cuando se desee, el abanico de plagas a controlar o para permitir que la composición realice otras funciones útiles en el mismo animal o el área tratada.

[0082] Algunos ejemplos de otros compuestos activos como pesticidas que se pueden incluir en, o utilizarse junto con las composiciones de la presente invención son: acefato, clorpirifos, demeton-S-metilo, disulfotonsulfona, etoprofos, fenitrotión, fenamifos, fonofos, isazofos, isofenfos, malatión, monocrotofos, paratión, forato, fosalona, pirimifos-metilo, terbufos, triazofos, ciflutrina, cipermetrina, deltametrina, fenpropatrina, fenvalerato, permetrina, teflutrina, aldicarb, carbosulfan, metomilo, oxamil, pirimicarb, bendiocarb, teflubenzuron, dicofol, endosulfán, lindano,

cartap benzoximato, cihexatina, tetradifon, avermectinas, ivermectinas, milbemicinas, tiofanato, triclorfon, diclorvos, diaveridine o dimetriadazole.

[0083] Para su aplicación en la agricultura, los compuestos de fórmula (I) o las sales de los mismos aceptables como pesticidas, tienen en general la forma de composiciones, en varias formas líquidas o sólidas.

- 5 **[0084]** Se pueden utilizar formas sólidas de composiciones tales como polvos (con un contenido del compuesto de fórmula (I) o de una sal del mismo aceptable como pesticida de hasta 80%), polvos o gránulos humidificables (incluyendo gránulos dispersables en agua), en especial aquellos obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un transportador granular, o granulación a partir de un polvo (estando el contenido del compuesto de fórmula (I) o de una sal del mismo aceptable como pesticida, en estos polvos o gránulos humidificables entre
- 10 aproximadamente 0.5 y aproximadamente 80%). Se pueden utilizar composiciones sólidas homogéneas o heterogéneas que contienen uno o más compuestos de fórmula (I) o las sales de los mismos aceptables como pesticidas, por ejemplo gránulos, pellets, briquetas o cápsulas, para tratar aguas estancadas o corrientes durante un periodo de tiempo. Un efecto similar se puede lograr empleando alimentación por goteo o intermitente de concentrados dispersables en agua tal como se describe aquí.
- 15 **[0085]** Las composiciones líquidas incluyen, por ejemplo, soluciones o suspensiones acuosas o no acuosas (tales como concentrados emulsificables, emulsiones, fluidos, dispersiones, o soluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas también incluyen, en particular, polvos humidificables de concentrados emulsificables, emulsiones, fluidos, dispersiones, aerosoles (o polvo para rociar), pastas o fluidos secos como formas de composiciones líquidas o destinadas a formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo como esprays acuosos (incluyendo
- 20 volumen bajo y muy bajo) o como nieblas o aerosoles.

- [0086]** Las composiciones líquidas, por ejemplo, en la forma de concentrados emulsificables o solubles comprenden en la mayoría de las veces aproximadamente de 5 a aproximadamente 80% en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o soluciones listas para su aplicación contienen, en su caso, aproximadamente de 0.01 a aproximadamente 20% del ingrediente activo. Aparte del disolvente, los concentrados emulsificables o solubles
- 25 pueden contener, cuando sea necesario, aproximadamente de 2 a aproximadamente 50% de aditivos adecuados, tales como estabilizadores, agentes tensoactivos, agentes de penetración, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Se pueden obtener emulsiones de cualquier concentración buscada, que son en especial adecuadas para su aplicación, por ejemplo, a plantas, a partir de estos concentrados por dilución con agua. Estas composiciones están al alcance de las composiciones que se pueden emplear en la presente invención. Las
- 30 emulsiones pueden estar en la forma de agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia espesa.

[0087] Las composiciones líquidas de esta invención pueden ser usadas, además de en los usos normales, en agricultura por ejemplo para tratar sustratos o lugares infestados o que pueden ser infestados por artrópodos (u otras plagas controladas por los compuestos de esta invención) incluyendo establecimientos de almacenamiento o de procesado internos o al aire libre, contenedores o equipos o aguas corrientes o estancadas.

- 35 **[0088]** Se pueden aplicar todas estas dispersiones o emulsiones acuosas o mezclas para rociado, por ejemplo, a plantaciones mediante cualquier medio apropiado, principalmente por rociado, a velocidades que son en general del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1, 200 litros de mezcla de rociado por hectárea, aunque puede ser mayor o menor (por ejemplo volumen bajo o ultra bajo) dependiendo de las necesidades o de la técnica de aplicación. El compuesto o composiciones según la invención se aplican convenientemente a vegetación y en particular a raíces u hojas que contienen plagas a eliminar. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es por quimigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el ingrediente activo para irrigar con agua. Esta irrigación puede ser irrigación por rociado para pesticidas foliares o puede ser irrigación de suelo o subsuelo o para pesticidas sistémicos.
- 40

- [0089]** Las suspensiones de concentrado, que se pueden aplicar por rociado, se preparan para que produzcan un producto estable fluido que no se deposite (triturado fino) y suelen contener desde aproximadamente 10 a aproximadamente 75% en peso de ingrediente activo, desde aproximadamente 0.5 a aproximadamente 30% de agentes tensoactivos, desde aproximadamente 0.1 a aproximadamente 10% de agentes tixotrópicos, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 30% de aditivos adecuados, tales como agentes anti-espuma, inhibidores de la corrosión, estabilizadores, agentes de penetración, adhesivos y, como transportador, agua o un líquido orgánico en el que el ingrediente activo es poco soluble o insoluble algunas sales orgánicas o inorgánicas se pueden disolver en el transportador para evitar la deposición o como anticongelante del agua.
- 45
- 50

- [0090]** Los polvos humidificables (o polvo para rociado) se suelen preparar para que contengan desde aproximadamente 10 a aproximadamente 80% en peso de ingrediente activo, desde aproximadamente 20 a aproximadamente 90% de transportador sólido, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 5% de agente humidificador, desde aproximadamente 3 a aproximadamente 10% de agente dispersante y, cuando sea necesario, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 80% de uno o más estabilizadores y/o otros aditivos, tales como agentes de penetración, adhesivos, agentes anti-formación de tortas, colorantes, o similares. Para obtener estos polvos humidificables, el ingrediente activo se mezcla totalmente en un mezclador adecuado con sustancias adicionales que se pueden impregnar sobre un relleno poroso y se tritura utilizando un triturador o molino adecuado.
- 55

Esto produce polvos humidificables, cuya humidificabilidad y grado de suspensión son ventajosos. Se pueden suspender en agua para producir cualquier concentración deseada y esta suspensión se puede emplear muy ventajosamente para su aplicación al follaje de plantas.

- [0091]** Los "gránulos dispersables en agua (WG)" (gránulos que se dispersan inmediatamente en agua) tienen composiciones que son sustancialmente parecidas a los polvos humidificables. Se pueden preparar por granulación de formulaciones descritas para los polvos humidificables, ya sea mediante camino húmedo (poner en contacto ingrediente activo finamente dividido con un relleno inerte y un poco de agua, por ejemplo de 1 a 20% en peso, o con una solución acuosa de un agente dispersante o de unión, y luego secar y poner máscara), o mediante un camino seco (compactación seguida de triturado y máscara).
- 10 **[0092]** Las concentraciones y tasas de las composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o utilización de estas. En términos generales, las composiciones para la aplicación para el control de plagas de artrópodos, nematodos de plantas, helmintos o protozoos suelen contener desde aproximadamente 0.00001 % a aproximadamente 95%, más especialmente desde aproximadamente 0.0005% a aproximadamente 50% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas, o de ingredientes activos totales (es decir el compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo aceptable como pesticida, junto con otras sustancias tóxicas para los artrópodos o nematodos de planta, anti helmintos, anti coccidianos, elementos de sinergia, elementos de traza o estabilizadores). Las composiciones empleadas y su tasa de aplicación se seleccionaran para obtener el o los efectos deseados por el granjero, productor de ganado, el médico, o veterinario, el operario del control de plagas u otro experto en la materia.
- 20 **[0093]** Las composiciones sólidas o líquidas para la aplicación tópica a animales, madera, productos almacenados o bienes domésticos suelen contener desde aproximadamente 0.00005% a aproximadamente 90%, más especialmente desde aproximadamente 0.001 % a aproximadamente 10%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Para la administración a animales por vía oral o parenteral, incluyendo composiciones líquidas o sólidas percutáneas, estos suelen contener desde aproximadamente 0.1 % a aproximadamente 90% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los alimentos con medicamentos contienen normalmente desde aproximadamente 0.001% a aproximadamente 3% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas. Los concentrados o suplementos para el mezclado con alimentos contienen normalmente desde aproximadamente 5% a aproximadamente 90%, preferentemente desde aproximadamente 5% a aproximadamente 50%, en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas. Los lamederos de sales minerales contienen normalmente desde aproximadamente 0.1% a aproximadamente 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o sales aceptables como pesticidas de estos.
- 25 **[0094]** Los polvos o composiciones líquidas para su aplicación a ganado, bienes, establecimientos o zonas externas pueden contener desde aproximadamente 0.0001 % a aproximadamente 15%, más especialmente desde aproximadamente 0.005% a aproximadamente 2.0%, en peso, de uno o más compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas. Unas concentraciones adecuadas en aguas tratadas están entre aproximadamente 0.0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más especialmente aproximadamente 0.001 ppm a aproximadamente 5.0 ppm de uno o más compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas, y se pueden utilizar terapéuticamente en piscifactorías con tiempos de exposición adecuados. Los cebos comestibles pueden contener desde aproximadamente 0.01% a aproximadamente 5%, preferentemente desde aproximadamente 0.01 % a aproximadamente 1.0%, en peso, de uno o más compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas.
- 30 **[0095]** Cuando se administra a vertebrados por vía parenteral, oral o percutánea u otros medios, la dosificación de los compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas, dependerá de la especie, edad, o salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de infestación actual o potencial por plagas de artrópodos, helmintos o protozoos. Una única dosis de aproximadamente 0.1 a aproximadamente 100 mg, preferentemente de aproximadamente 2.0 a aproximadamente 20.0 mg, por kg de animal o dosis de aproximadamente 0.01 a aproximadamente 20.0 mg, preferentemente aproximadamente 0.1 a aproximadamente 5.0 mg, por kg de animal por día, para una medicación sostenida, son en general adecuadas por administración oral o parenteral. Mediante la utilización y combinación de dispositivos de liberación sostenida de formulaciones, la dosis diaria requerida durante un periodo de meses se puede administrar a animales de una única vez.
- 35 **[0096]** Los siguientes EJEMPLOS 2A - 2M de composiciones ilustran composiciones para su utilización contra artrópodos, en especial ácaros o insectos, nematodos de planta o plagas de helmintos o protozoos, que comprenden, como ingrediente activo, compuestos de fórmula (I) o de las sales de los mismos aceptables como pesticidas, tales como aquellos descritos ejemplos de preparados. Las composiciones descritas en los EJEMPLOS 2A - 2M pueden ser todos diluidos para dar como resultado una composición que se puede rociar en concentraciones adecuadas para la utilización en el campo. Las descripciones químicas genéricas de los ingredientes (para las cuales todos siguientes porcentajes están en porcentaje en peso), utilizadas en los
- 40 EJEMPLOS 2A - 2M siguientes, son tal como se muestra a continuación:
- 45
- 50
- 55
- 60

Marca	Descripción química
Etilan BCP	condensado de Nonilfenol óxido de etileno
Soprofor BSU	condensado de Tristirilfenol óxido de etileno
5 Arilan CA	una solución al 70% p/v de dodecilbencenosulfonato de calcio
Solvesso 150	disolvente C ₁₀ aromático ligero
Arylan S	dodecilbencenosulfonato de sodio Darvan NO ₂ lignosulfonato de sodio
Celite PF	transportador de silicato de magnesio sintético
Sopropon T36	sales de sodio de ácidos policarboxícos
10 Rhodigel 23	goma xantana polisacarido
Bentone 38	Derivado orgánico de montmorillonite de magnesio
Aerosil	Dióxido de sílice microfino

EJEMPLO 2A

15 **[0097]** Un concentrado soluble en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo	7%
Etilan BCP	10%
N-metilpirrolidone	83%

20 **[0098]** A una solución de Etilan BCP disuelta en una porción de N-metilpirrolidone se le añade el ingrediente activo con calentamiento y mezclado hasya que se disuelve. La solución resultante se completa en volumen con el disolvente restante.

EJEMPLO 2B

[0099] Un concentrado emulsificable (EC) se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

25 Ingrediente activo	25%(max)
Soprophor BSU	10%
Arylan CA	5%
N-metilpirrolidone	50%
Solvesso 150	10%

30 **[0100]** Los primeros tres componentes se disuelven en N-metilpirrolidone y a esto se le añade luego el Solvesso 150 para llegar al volumen final.

EJEMPLO 2C

[0101] Un polvo humidificable (WP) se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

35 Ingrediente activo	40%
Arylan S	2%
Darvan NO ₂	5%
Celite PF	53%

40 **[0102]** Los ingredientes se mezclan y asientan en un molino de martillo a polvo con un tamaño de partícula de menos de 50 micras.

EJEMPLO 2D

[0103] Una formulación fluida acuosa se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

45 Ingrediente activo	40.00%
Etilan BCP	1.00%
Sopropon T360.	0.20%
Etilen glicol	5.00%
Rhodigel 230.	0.15%
Agua	53.65%

50 **[0104]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan en un molino de bolas hasta que se obtiene un tamaño de partícula de menos de 3 micras.

EJEMPLO 2E

[0105] Un concentrado de suspensión emulsificable se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

	Ingrediente activo	30.0%
5	Etilan BCP	10.0%
	Bentone 38	0.5%
	Solvesso 150	59.5%

[0106] Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan en un molino de bolas hasta que se obtiene un tamaño de partícula de menos de 3 micras.

10 EJEMPLO 2F

[0107] Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

	Ingrediente activo	30%
	Darvan No 2	15%
	Arylan S	8%
15	Celite PF	47%

[0108] Los ingredientes se mezclan, micronizan en un molino movido por fluido y luego se granula en un pelletizador giratorio mediante rociado con agua (hasta 10%). Los gránulos resultantes se secan en un secador de lecho fluido para retirar el exceso de agua.

EJEMPLO 2G

20 **[0109]** Un polvo secante se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

	Ingrediente activo	1 a 10%
	Polvo de talco-superfino de 99 a 90%	

25 **[0110]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan lo suficientemente para lograr un polvo fino. Este polvo puede aplicarse al lugar de infestación de artrópodos, por ejemplo en vertederos de rechazo, productos almacenados o bienes o animales domésticos infestados, o con riesgo de ser infestados por, artrópodos para controlarlos por ingestión oral. Unos medios adecuados para distribuir el polvo secante al lugar de infestación de artrópodos incluyen ventiladores mecánicos, manuales o dispositivos automáticos de tratamiento de ganado.

EJEMPLO 2H

[0111] Un cebo comestible se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

30	Ingrediente activo	0.1 a 1.0%
	Harina de trigo	80%
	Melazas	19.9 a 19%

35 **[0112]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se conforman en forma de cebo. Este cebo comestible puede ser distribuido en un lugar, por ejemplo establecimientos domésticos o industriales, por ejemplo cocinas, hospitales o almacenes, o zonas al aire libre, infestados por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

EJEMPLO 2I

[0113] Una formulación de solución se prepara con una composición tal como se indica a continuación:

	Ingrediente activo	15%
40	Sulfóxido de dimetilo	85%

45 **[0114]** El ingrediente activo se disuelve en sulfóxido de dimetilo con mezclado y calentamiento si es necesario. Esta solución puede aplicarse de forma percutánea como aplicación por vertido en animales domésticos infestados por artrópodos o, tras esterilización por filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (0.22 micrómetros de tamaño de poro), por inyección parenteral, a una velocidad de aplicación desde 1.2 a 12 ml de solución por 100 kg de animal.

EJEMPLO 2J

[0115] Un polvo humidificable se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo	50%
Etilan BCP	5%
Aerosil	5%
Celite PF	40%

- 5 **[0116]** El Etilan BCP es absorbido sobre el Aerosil que luego se mezcla con los otros ingredientes y asientan en un molino de martillos para dar un polvo humidificable, que se puede diluir con agua a una concentración desde 0.001 % a 2% en peso del compuesto activo y aplicado a un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas dípteras o nematodos de planta, por rociado, o a animales domésticos infestados por, o con riesgo de infección por artrópodos, por rociado o inmersión, o por administración oral en agua de bebida, para controlar los artrópodos, los
- 10 helmintos o los protozoos.

EJEMPLO 2K

[0117] Una composición de bolo de liberación lenta se hace a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes con porcentajes variables (similares a aquellos descritos para las composiciones previas) dependiendo de las necesidades:

- 15 Ingrediente activo
 Agente de densidad
 Agente de liberación lenta
 Ligante

- 20 **[0118]** Los ingredientes íntimamente mezclados se conforman en gránulos que son comprimidos a modo de bolo con una gravedad de 2 o más. Puede ser administrado oralmente a animales domésticos rumiantes para su retención en el retículo-rumen para proporcionar una liberación lenta y progresiva del compuesto activo durante un periodo de tiempo extendido para control de infestación de animales domésticos rumiantes por artrópodos, helmintos o protozoos.

EJEMPLO 2L

- 25 **[0119]** Una composición de liberación lenta en la forma de gránulos, pellets, briquetas o similares puede ser preparada con composiciones tal como sigue:

Ingrediente activo	0.5 a 25%
Cloruro de polivinilo	75 a 99.5%
Ftalato de dioctilo (plastificador)	

- 30 **[0120]** Los componentes se mezclan y son conformados con formas adecuadas por moldeado o fusión-extrusión. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para la adición a agua estancada o para fabricación de collares o etiquetas para las orejas para su fijación a animales domésticos para el control de plagas y liberación lenta.

EJEMPLO 2M

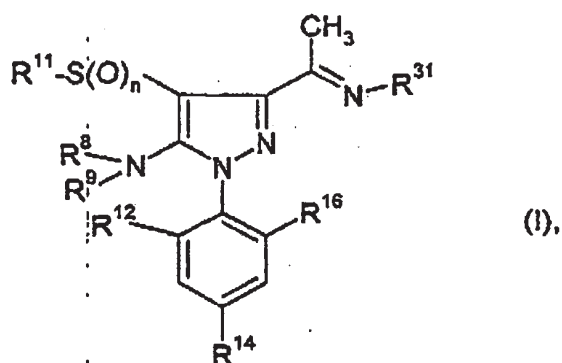
[0121] Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

- 35 Ingrediente activo 85%(máx.)
 Polivinilpirrolidone 5%
 Arcilla de attapulgita 6%
 Lauril Sulfato sodio 2%
 Glicerina 2%

- 40 **[0122]** Los ingredientes se mezclan como lodo con 45% de agua y serán triturados en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 micras, y luego secado por espray para eliminar el agua.

REIVINDICACIONES

1. Compuesto de fórmula 1



5 En el que:

R³¹ puede ser:

H; CN; NO₂; NO; SH; C₁-C₈ alquiltio; NH₂; P(O)(OR⁸)(OR⁹) o R³⁸; o

mono(alquilo C₁-C₈)amino; di(alquilo C₁-C₆)amino; formilo; (alquilo C₁-C₈); alquilo C₁-C₂₀; cicloalquilo C₃-C₆; o

(cicloalquilo) alquilo C₄-C₈; donde cada alquilo o cicloalquilo está opcionalmente sustituido por uno o más R³⁵; o

10 naftilo o fenilo, cada uno de ellos opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶ o R³⁷; o

NH-CO-NH-N=CR⁸R⁹; NH-CS-NH-N=CR⁸R⁹; NH-CO-NR⁸R⁹;

NH-CS-NR⁸R⁹; NH-CO-OR⁸; NH-CS-OR⁸; o NH-CO-NH-NH₂;

R³⁵ puede ser halógeno, amino, alquilamino C₁-C₆, di(alquilo C₁-C₆)amino, NO₂, CN, alcoxi C₁-C₆, (alcoxi C₁-C₆) carbonilo, hidroxicarbonilo, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, metileno, metilidino, acetenyl, acetenyl(alquilo C₁-C₈); o

15 R³⁵ puede ser fenilo opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶, o R³⁹ puede ser un anillo heterocíclico que tienen a total de 3 a 7 átomos en el anillo de los cuales 1 a 4 son heteroátomos, siendo dichos heteroátomos iguales o diferentes y seleccionándose del grupo formado por O, S y N, said anillo heterocíclico ser saturados o insaturados y estando opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶; o R³⁵ puede ser OH, SH, C₁-C₈ alquiltio, alquilsulfinilo C₁-C₈, alquilsulfonilo C₁-C₆, aminocarbonilo, (alquilo C₁-C₈)aminocarbonilo, di(alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, (alcoxi C₁-C₆) carbonilo, o P(O)(OR⁸)(OR⁹);

20 R³⁸ puede ser SF₅, halógeno, alquilo C₁-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, NO₂, CN, amino, alquilamino C₁-C₆, di(alquilo C₁-C₆) amino, di(alquilo C₁-C₆)aminocarbonilamino, (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilamino, aminocarbonilamino, (alquilo C₁-C₆)carbonilo, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, (alquilo C₁-C₆)carbonilamino, (alcoxi C₁-C₆)carbonilamino, aminocarbonilo, di(alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, hidroxicarbonilo, aminocarbonilo, (alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, di(alquilo C₁-C₆)aminocarbonilo, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, P(O)(OR⁸)(OR⁹), (alquilo C₁-C₆)[(alquilo C₁-C₆)carbonil]amino o fenilamino(alquilo C₁-C₆);

25 R³⁷ puede ser R³⁶ o fenilo opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶, fenoxi opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶, o bencilo opcionalmente sustituido por uno o más R³⁶;

30 R³⁸ puede ser un radical heterocíclico derivado de un único anillo heterocíclico o de un sistema heterocíclico de dos anillos fusionados donde al menos un anillo es heterocíclico, teniendo cada anillo de 3 a 7 átomos en el anillo, teniendo cada anillo heterocíclico de 1 a 4 heteroátomos en el anillo, siendo dichos heteroátomos en el anillo iguales o diferentes y seleccionándose del grupo formado por O, S y N, siendo cada anillo saturado o insaturado;

35 todos los radicales heterocíclicos pueden estar unidos al nitrógeno del grupo H₃C-C=N-R³¹ en cualquier posición posible del anillo heterocíclico y todos los anillos pueden estar opcionalmente sustituido con uno o más R³⁶ o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R³⁶;

R⁸ y R⁹ se seleccionan independientemente de entre H y alquilo C₁-C₆ opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, NO₂, CN, CHO, OH, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, (alcoxi C₁-C₆)carbonilo, hidroxicarbonilo, y carbamilo;

40 R¹¹ es metilo o etilo;

n es 0 o 1;

R¹² es cloro o bromo;

R¹⁴ es perhaloalquilo, perhaloalcoxi o SF₅;

R¹⁶ es cloro o bromo:

5 y sales de los mismos aceptables como pesticidas.

2. El compuesto según la reivindicación 1 en el que:

R¹⁴ es CF₃, OCF₃, o SF₅; y R¹² y R¹⁶ son cloro o bromo.

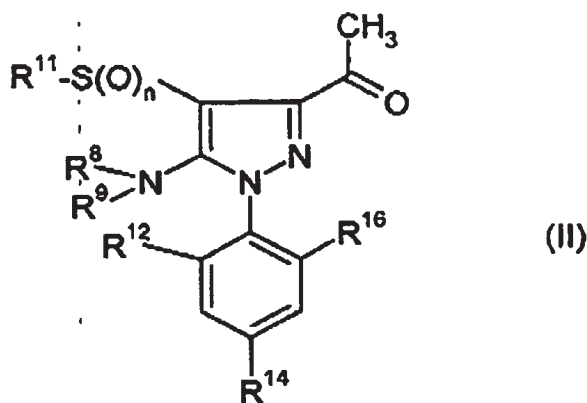
10 3. El compuesto según las reivindicaciones 1 o 2, en el que el radical heterocíclico R³⁸ se selecciona de piridina, pirimidina, oxazole, oxadiazole, oxatriazole, isoxazole, tiazole, isotiazole, imidazole, pirane, pirone, pirazole, pirrole, tetrazole, furoxano, tetrahidrofuranilo, furano, pirazina, piridazina, benzimidazole, quinolina, isoquinolina, triazina, thiofene, furopirano, furopirone, tiatriazina, tiadiazole, pudiendo estar todos los radicales heterocíclicos unidos al nitrógeno del grupo H₃C-C=N-R³¹ en cualquier posición posible del anillo heterocíclico y todos los anillos opcionalmente sustituidos con uno o más R³⁶ o un fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R³⁶.

15 4. Composición que comprende un compuesto de fórmula (I) tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-3 y un vehículo aceptable como pesticida.

5. Procedimiento para controlar plagas en un lugar, comprendiendo dicho procedimiento aplicar a dicho lugar una cantidad eficaz desde el punto de vista pesticida de un compuesto de fórmula (I) o a sal de los mismos aceptable como pesticida tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una composición tal como se define en la reivindicación 4, con la condición de que el lugar no es un animal.

20 6. Uso de compuestos de fórmula (I) tal como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1-3 para la preparación de una composición para controlar plagas en un lugar.

7. Proceso para la preparación de un compuesto como el reivindicado en la reivindicación 1, comprendiendo dicho proceso hacer reaccionar un compuesto de fórmula:



25

Donde las variables estructurales son tal como se ha reivindicado en la reivindicación 1, con una amina de fórmula R³¹ - NH₂ (III)

donde R³¹ es tal como se define en la reivindicación 1.