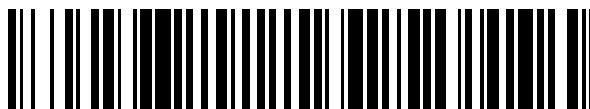


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 400 574**

51 Int. Cl.:

C07D 487/04 (2006.01)

A61P 33/00 (2006.01)

A61K 31/4985 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **07.02.2008** **E 08711309 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.01.2013** **EP 2118113**

54 Título: **Derivado piridil-triazolopirimidina o su sal, pesticida que lo contiene y su procedimiento de producción**

30 Prioridad:

15.02.2007 JP 2007034371

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

10.04.2013

73 Titular/es:

**ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD. (100.0%)
3-15, EDOBORI 1-CHOME, NISHI-KU
OSAKA-SHI OSAKA 550-0002, JP**

72 Inventor/es:

**HAGA, TAKAHIRO;
KIMURA, HIROHIKO;
MORITA, MASAYUKI;
UEDA, TSUYOSHI;
UEKI, TOSHIHIKO;
KIRIYAMA, KAZUHISA;
YOSHIDA, KOTARO y
HAMAMOTO, TAKU**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 400 574 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

Derivado piridil-triazolopirimidina o su sal, pesticida que lo contiene y su procedimiento de producción

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un insecticida y/o miticida que contiene un novedoso derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como un principio activo.

10 **Antecedentes de la técnica**

El documento WO2004/082383 divulga el uso de derivados triazolopirimidina que tienen una estructura química específica como nematocida. Sin embargo, estos compuestos son diferentes de los compuestos de la presente invención en la estructura química. Además, el documento WO2002/02563 divulga un método para prevenir o tratar el crecimiento de las células tumorales cancerosas y las enfermedades relacionadas, que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de triazolopirimidina a un mamífero. Sin embargo, no divulga los compuestos de la presente invención y el uso de los compuestos de la presente invención como un insecticida y/o miticida.

Selby et al. (ACS Symp. Series 504 (Synth. Chem. Agrochem. III), 1992, 91-102) divulga 7-fenil-1,2,4-triazolo[1,5-a]pirimidinas que tienen actividad herbicida.

Petrich et al. (Tetrahedron, 1994, 50(42), 12113-24) divulga la reacción de sales de iminio vinillogos y análogos relacionados con 3-amino-1,2,4-triazoles para dar triazolo[1,5-a]pirimidinas 7 sustituidas y 5 sustituidas.

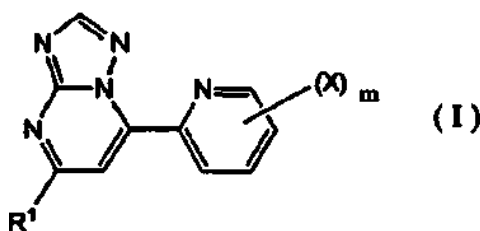
25 **Divulgación de la invención****Objeto que se obtiene mediante la invención**

Durante muchos años, se han utilizado muchos pesticidas, pero muchos de ellos tienen varios problemas, tales como que los efectos no son adecuados, su uso está restringido ya que las plagas han adquirido resistencia, etc. Por consiguiente, se desea desarrollar un plaguicida novedoso sustancialmente libre de tales problemas, por ejemplo, un pesticida capaz de controlar diversas plagas que crean problemas en los campos agrícolas y hortícolas o un pesticida capaz de controlar plagas parasitarias en animales.

35 **Medios para lograr el objetivo**

Los presentes inventores han realizado diversos estudios sobre derivados piridil-triazolopirimidina en un esfuerzo por encontrar un insecticida superior y/o miticida. Como resultado, han encontrado que un novedoso derivado piridil-triazolopirimidina tiene un efecto pesticida extremadamente alto contra las plagas a una dosis baja y al mismo tiempo es seguro para las plantas de cultivo, el enemigo natural de plagas o mamíferos y han logrado la presente invención.

Concretamente, la presente invención se refiere a un derivado piridil-triazolopirimidina representado por la fórmula (I) o su sal:



en la que R¹ es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquenoilo que puede estar sustituido por A, alquinoilo que puede estar sustituido por A, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido por alquilo, OR², S(O)_nR³ o NR⁴R⁵; R² es hidrógeno, alquilo, alquenoilo, alquinoilo, haloalquilo, alcoxialquilo, acetilo o arilo; R³ es alquilo o acetilo; R⁴ es hidrógeno o alquilo; R⁵ es hidrógeno, alquilo, acetilo, CH₂CH₂OR² o CH₂CN; A es halógeno, OR², S(O)_nR³, NR⁴R⁵, ciano, alquilo, cicloalquilo, arilo, un grupo heterocíclico, SCH₂COOR² o -CH(CN)₂; X es alquilo, alquenoilo, alquinoilo, arilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, NR⁴R⁵, S(O)_nR³, COR² o COOR²; m es un número entero de desde 1 hasta 4 y n es un número entero de desde 0 hasta 2; siempre que se excluya la 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina.

La presente invención se refiere además a un insecticida y/o miticida que contiene el derivado piridil-triazolopirimidina de la fórmula (I) o su sal como un principio activo, un método para controlar una plaga mediante su aplicación y su procedimiento de producción.

Efectos de la invención

Un insecticida y/o miticida que contiene el derivado piridil-triazolopirimidina de la fórmula (I) anterior o su sal como un principio activo tiene un efecto pesticida muy alto contra las plagas a una dosis baja.

5

Mejor modo de llevar a cabo la invención

Cuando m es un número entero de desde 2 hasta 4, las respectivos X pueden ser iguales o diferentes.

10 Como el halógeno o halógeno como sustituyente en la fórmula (I), se puede mencionar un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo. El número de halógenos como los sustituyentes pueden ser 1 o más y si es más, los halógenos respectivos pueden ser iguales o diferentes. Además, las posiciones de sustitución de tales halógenos pueden ser cualesquiera posiciones.

15 El alquilo de la fórmula (I) puede ser lineal o ramificado. Como ejemplo específico, se puede mencionar alquilo C₁₋₆, tal como metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, terc-butilo, pentilo o hexilo.

Como el cicloalquilo de la fórmula (I), se puede mencionar cicloalquilo C₃₋₆, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

20

El alquino de la fórmula (I) puede ser lineal o ramificado. Como ejemplo específico, se puede mencionar alquino C₂₋₆, tal como vinilo, 1-propenilo, alilo, isopropenilo, 1-butenilo, 1,3-butadienilo o 1-hexenilo.

25 El alquino de la fórmula (I) puede ser lineal o ramificado. Como ejemplo específico, se puede mencionar alquino C₂₋₆, tal como etinilo, 2-butenilo, 2-pentinilo, 3-metil-1-butenilo, 2-penten-4-inilo o 3-hexinilo.

Como el arilo de la fórmula (I), se puede mencionar arilo C₆₋₁₀, tal como, por ejemplo, fenilo o naftilo.

30 El grupo heterocíclico de la fórmula (I) incluye un grupo heterocíclico condensado en adición a un grupo heterocíclico monocíclico. El grupo heterocíclico monocíclico puede ser, por ejemplo, un grupo heterocíclico de 3 miembros, tal como oxiranilo, un grupo heterocíclico de 5 miembros, tal como furilo, tetrahydrofurilo, tienilo, pirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, dioxolanilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, pirazolilo, pirazolinilo, pirazolidinilo, triazoloilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo o tetrazolilo, o un grupo heterocíclico de 6 miembros, tal como piranilo, piridilo, piperidinilo, dioxanilo, oxazinilo, morfolinilo, tiazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piperazinilo o triazinilo. Entre tales grupos heterocíclicos monocíclicos, se prefiere un grupo heterocíclico monocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene desde 1 hasta 4 átomos de al menos un tipo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N. El grupo heterocíclico condensado puede ser, por ejemplo, benzofuranilo, isobenzofuranilo, dihidrobenzofuranilo, dihidroisobenzofuranilo, benzotienilo, isobenzotienilo, dihidrobenzotienilo, dihidroisobenzotienilo, tetrahydrobenzotienilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzodioxolanilo, benzodioxanilo, cromanilo, cromonilo, isocromanilo, cromonilo, cromanonilo, quinolilo, isoquinolilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, indolizínilo, quinolizínilo, imidazopiridilo, naftiridinilo, pteridinilo, dihidrobenzoxazinilo, dihidrobenzoxazolinonilo, dihidrobenzoxazinonilo o benzotioxanilo. Entre tales grupos heterocíclicos condensados, se prefiere un grupo heterocíclico condensado de 8 a 10 miembros que contiene desde 1 hasta 4 átomos de al menos un tipo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N

45

La sal del derivado de piridil-triazolopirimidina de la fórmula (I) anterior incluye todos los tipos siempre que sean agrícolamente aceptables. Por ejemplo, se puede mencionar una sal de amonio, tal como una sal de dimetilamonio o una sal de trietilamonio, una sal de ácido inorgánico, tal como un clorhidrato, un perclorato, un sulfato o un nitrato, o una sal de ácido orgánico, tal como un acetato o un metanosulfonato.

50

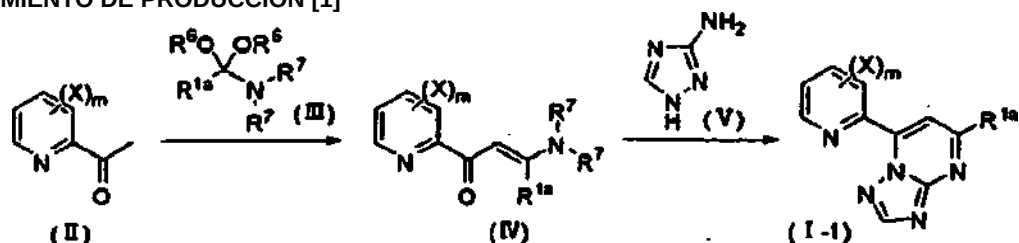
El derivado piridil-triazolopirimidina de la fórmula (I) puede tener isómeros ópticos o isómeros geométricos y dichos isómeros y sus mezclas están incluidos en la presente invención. En la presente descripción, los isómeros se divulgan en forma de mezclas, a menos que se especifique lo contrario. Además, en la presente invención, pueden ser incluidos dentro del alcance del conocimiento común en este campo técnico diversos isómeros distintos a los mencionados anteriormente. Además, dependiendo del tipo de tal isómero, la estructura química puede ser diferente de la fórmula mencionada anteriormente (I), pero es obvio para un experto en la técnica que tal estructura está en relación isomérica, y, por lo tanto, entra dentro de la alcance de la presente invención.

55

El derivado piridil-triazolopirimidina de la fórmula (I) anterior o su sal puede ser producido por los siguientes procedimientos de producción [1] a [9] y de acuerdo con un método usual para producir una sal.

60

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [1]



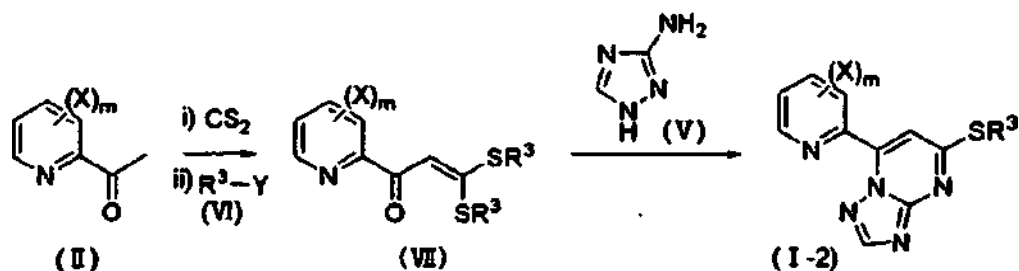
En el procedimiento de producción [1], R^{1a} es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquenilo que puede estar sustituido por A, alquinilo que puede estar sustituido por A, arilo o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido por alquilo; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es alquilo; y A, X y m son como se ha definido anteriormente.

El procedimiento de producción [1] comprende una primera parte de una reacción de condensación del compuesto de la fórmula (II) y el compuesto de la fórmula (III) para obtener el derivado cetona α , β -insaturada de la fórmula (IV) y una segunda parte de una reacción de condensación del compuesto de la fórmula (IV) y el compuesto de la fórmula (V) para obtener el derivado [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (I-1).

En la primera parte del procedimiento de producción [1], el compuesto de la fórmula (III) se puede utilizar en una proporción desde 0,8 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (II). Esta reacción generalmente se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente en tanto que sea inerte para la reacción, y puede, por ejemplo, ser un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno, un hidrocarburo alifático, tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o bencina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo, un nitrilo, tal como acetonitrilo o propionitrilo; una amida de ácido, tal como dimetilformamida, dimetilacetamida o N-metilpirrolidinona; un sulfóxido, tal como sulfóxido de dimetilo; una sulfona, tal como sulfolano; un fosfato de amida, tal como hexametilfosforamida; un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano, o una mezcla disolvente de los mismos. La temperatura de reacción es normalmente desde 80 hasta 200°C, preferiblemente desde 100 hasta 150°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 6 hasta 48 horas.

En la segunda parte del procedimiento de producción [1], el compuesto de la fórmula (V) se puede utilizar en una proporción desde 0,8 hasta 10 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2,5 equivalente por mol del compuesto de la fórmula (IV). Esta reacción generalmente se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente en tanto que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un ácido carboxílico, tal como ácido acético o ácido propiónico, un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático, tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o bencina de petróleo; un éter, tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo, tal como acetonitrilo o propionitrilo; una amida de ácido, tal como dimetilformamida, dimetilacetamida o N-metilpirrolidinona; un sulfóxido, tal como sulfóxido de dimetilo; una sulfona tal como sulfolano; un fosfato de amida tal como hexametilfosforamida; un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano, o un disolvente mezcla de los mismos y se prefiere un ácido carboxílico. La temperatura de reacción es normalmente desde 50 hasta 150°C, preferiblemente desde 80 hasta 120°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,5 hasta 100 horas.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [2]



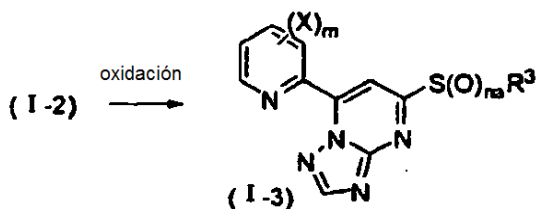
En el procedimiento de producción [2], Y es halógeno y R^3 , X y m son como se ha definido anteriormente. Como el halógeno Y, se puede mencionar un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo.

El procedimiento de producción [2] comprende una primera parte de la reacción donde reacciona el compuesto de la fórmula (II), disulfuro de carbono y el compuesto de la fórmula (VI) para obtener el derivado cetona α , β -insaturado de la fórmula (VII) y una segunda parte de la reacción de condensación del compuesto de la fórmula (VII) y el compuesto de la fórmula (V) para obtener el [1,2,4] triazolo[1,5-a] pirimidina de la fórmula (I-2).

En la primera parte del procedimiento de producción [2], cada uno de disulfuro de carbono y el compuesto de la fórmula (VI) se puede utilizar en una proporción de desde 0,8 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (II). Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia de una base y un disolvente. La base puede ser, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; un hidróxido de metal alcalino, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un metal alcalino, tal como sodio o potasio, un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido terciario de potasio. La base puede usarse en una proporción de desde 1 hasta 10 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (II). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede, por ejemplo, ser el mismo disolvente usado en la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [1]. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 100°C, preferiblemente desde 10 hasta 50°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 6 hasta 48 horas

En la segunda parte del procedimiento de producción [2], el compuesto de la fórmula (V) se puede utilizar en una proporción desde 0,8 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (VII). Esta reacción generalmente se puede llevar a cabo en presencia de una base y un disolvente. La base puede ser, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; un hidróxido de metal alcalino, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un metal alcalino, tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio; un carbonato de metal alcalino, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un bicarbonato de metal alcalino, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio, o una base orgánica tal como trietilamina o piridina. La base puede usarse en una proporción desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (V). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, el mismo disolvente usado en la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [1]. La temperatura de reacción es normalmente desde 100 hasta 200°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 10 horas

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [3]

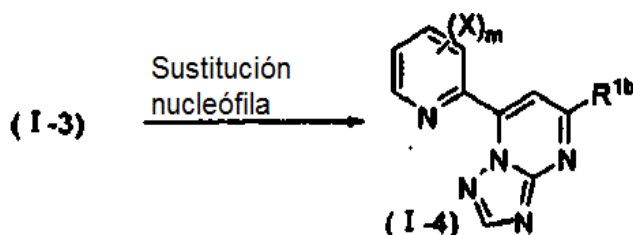


En el procedimiento de producción [3], R^3 , X y m son como se ha definido anteriormente y na es un número entero de desde 1 hasta 2.

En el procedimiento de producción [3], el compuesto de la fórmula (I-2) y un agente oxidante se hacen reaccionar en presencia de un disolvente para producir la [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (I-3).

El agente oxidante usado para la reacción anterior puede ser, por ejemplo, peróxido de hidrógeno, ácido peracético o ácido m-cloroperbenzoico. El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; una cetona, tal como acetona o dimetil etil cetona; un éter, tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un ácido carboxílico, tal como ácido acético o ácido propiónico, o una mezcla disolvente de los mismos. El agente oxidante puede ser utilizado en una proporción de desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (I-2). La temperatura de reacción es normalmente desde temperatura ambiente hasta la temperatura de reflujo. El tiempo de reacción es normalmente desde 1 hasta 24 horas.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [4]

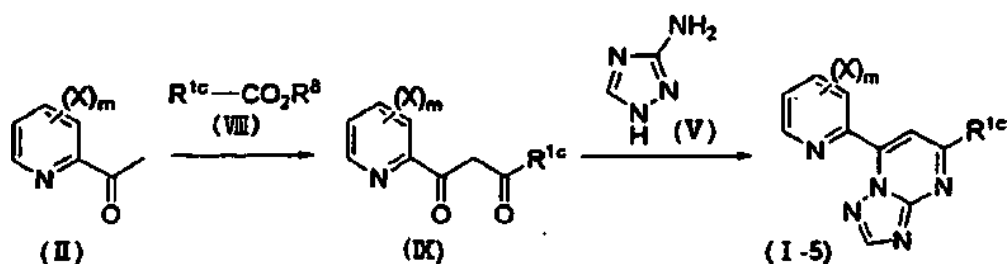


5 En el procedimiento de producción [4], R^{1b} es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquenilo que puede estar sustituido por A, alquinilo que puede estar sustituido por A, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido por alquilo, OR^2 o NR^4R^5 y R^2 , R^4 , R^5 , A, X y m son como se ha definido anteriormente.

10 En el procedimiento de producción [4], el compuesto de la fórmula (I-3) y un reactivo nucleófilo se hacen reaccionar en presencia de un disolvente para producir el derivado [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (I-4).

El reactivo nucleófilo puede ser, por ejemplo, un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio o etóxido de sodio; una mercaptida de metal alcalino, tal como metil mercaptano de sodio; una amina primaria o secundaria, tal como metilamina, dimetilamina o piperidina; un reactivo de metal orgánico, tal como metil bromuro de magnesio, bromuro de etil-magnesio o bromuro de fenil magnesio; o un agente de fluoración, tal como fluoruro de potasio, fluoruro de cesio o fluoruro de tetrabutilamonio. El reactivo nucleófilo se puede utilizar en una proporción desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (I-3). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o butanol, un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático, tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o bencina de petróleo; un éter, tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo, tal como acetonitrilo o propionitrilo; una amida de ácido, tal como dimetilformamida, dimetilacetamida o N-metilpirrolidinona; un sulfóxido, tal como dimetilsulfóxido o una mezcla disolvente de los mismos. La temperatura de reacción es normalmente desde -100 hasta 50°C , preferiblemente desde -70 hasta 30°C . El tiempo de reacción es normalmente desde un minuto hasta 48 horas.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [5]



30 En el procedimiento de producción [5], R^{1c} es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquenilo que puede estar sustituido por A, alquinilo que puede estar sustituido por A, arilo o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido por alquilo; R^8 es alquilo y A, X y m como se ha definido anteriormente.

El procedimiento de producción [5] comprende una primera parte de la reacción de la reacción del compuesto de la fórmula (II) con el compuesto de la fórmula (VIII) para obtener el compuesto de la fórmula (IX) y una segunda parte de la reacción de condensación del compuesto de la fórmula (IX) y el compuesto de la fórmula (V) para obtener la [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (I-5).

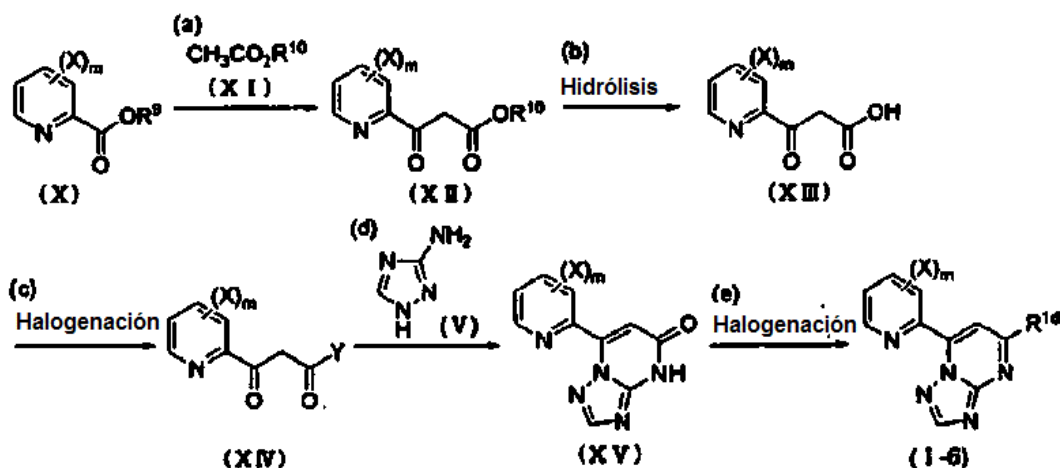
En la primera parte del procedimiento de producción [5], el compuesto de la fórmula (VIII) se puede utilizar en una proporción de desde 0,8 equivalente a una cantidad en gran exceso, preferiblemente desde 1 hasta 10 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (II). Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia de una base y un disolvente. La base puede ser, por ejemplo, la misma base que la utilizada en la primera parte de la reacción en el procedimiento de producción [2]. La base puede usarse en una proporción de desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (II). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o butanol, un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno o xileno;

un hidrocarburo alifático, tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o bencina de petróleo; un éter, tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; una amida de ácido, tal como dimetilformamida, dimetilacetamida o N-metilpirrolidinona; un sulfóxido, tal como dimetil sulfóxido; una sulfona, tal como sulfolano; un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla de disolventes de los mismos y se prefiere un éter. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 70°C, preferiblemente desde 10 hasta 50°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 24 horas.

En la segunda parte del procedimiento de producción [5], el compuesto de la fórmula (V) se puede utilizar en una proporción desde 0,8 hasta 10 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2,5 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (IX). Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede, por ejemplo, ser el mismo disolvente que el usado en la segunda parte del procedimiento de producción [1] y se prefiere un ácido carboxílico. Cuando el compuesto de la fórmula (IX) es líquido a temperatura ambiente, la segunda parte de la reacción del procedimiento de producción [5] se puede llevar a cabo de forma continua sin aislar el compuesto después de la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [5]. La temperatura de reacción es normalmente desde 50 hasta 150°C, preferiblemente desde 80 hasta 120°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,5 hasta 100 horas.

El tiempo de reacción es normalmente desde 0,5 hasta 100 horas.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [6]



En el procedimiento de producción [6], R^{1d} es halógeno; cada uno de R^9 y R^{10} que son independientes entre sí, es alquilo y X, Y y m son como se ha definido anteriormente. Como el halógeno R^{1d} , se puede mencionar un átomo de flúor, cloro o bromo.

En el procedimiento de producción [6], el compuesto de la fórmula (I-6) puede ser producido por las reacciones anteriores (a) a (e). Las respectivas reacciones se describirán en detalle a continuación.

(a) El compuesto de la fórmula (XII) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de la fórmula (X) con el compuesto de la fórmula (XI) en presencia de una base y un disolvente. El compuesto de la fórmula (XI) se puede utilizar en una proporción desde 0,8 cantidad equivalente hasta una cantidad en gran exceso, preferiblemente desde 1 hasta 30 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (X). La base puede ser, por ejemplo, la misma base que la utilizada en la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [2]. La base puede usarse en una proporción desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (X). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, el mismo disolvente usado en la reacción en la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [5] y se prefiere un éter. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 70°C, preferiblemente desde 10 hasta 50°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 24 horas.

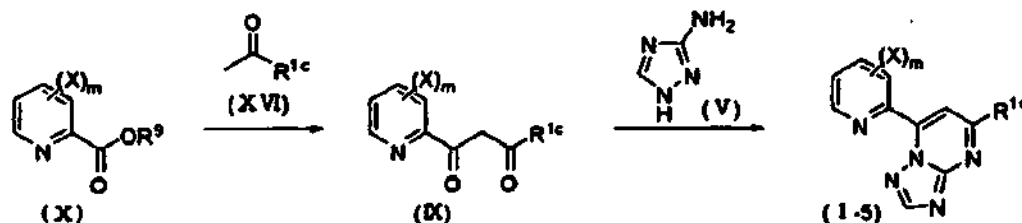
(b) El compuesto de la fórmula (XIII) se puede producir hidrolizando el compuesto de la fórmula (XII) en presencia de una base y agua. La base puede ser un hidróxido de metal alcalino, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio. La base puede usarse en una proporción de desde 1 cantidad equivalente hasta una cantidad en gran exceso por mol del compuesto de la fórmula (XII). La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 70°C, preferiblemente desde 10 hasta 50°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 24 horas.

(c) El compuesto de la fórmula (XIV) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de la fórmula (XIII) con un agente halogenante en presencia de un disolvente. El agente de halogenación puede ser, por ejemplo, cloruro de tionilo o dicloruro de oxalilo. El agente halogenante se puede utilizar en una proporción desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (XIII). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 100°C, preferiblemente desde 10 hasta 50°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 24 horas.

(d) El derivado 4,5-dihidro-5-oxo[1,2,4]triazolo[1,5-a] pirimidina de la fórmula (XV) se puede producir por condensación del compuesto de la fórmula (XIV) y el compuesto de la fórmula (V). El compuesto de la fórmula (V) se puede utilizar en una proporción desde 0,8 hasta 10 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2,5 equivalente por mol del compuesto de la fórmula (XIV). Esta reacción generalmente se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, el mismo disolvente que el usado en la reacción en la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [5] y se prefiere una amida de ácido. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 150°C, preferiblemente desde 20 hasta 100°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,5 hasta 100 horas.

(e) El derivado 5-halo[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (1-6) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de la fórmula (XV) con un agente de halogenación. El agente de halogenación puede ser, por ejemplo, cloruro de tionilo, oxicluro de fósforo u oxibromuro de fósforo. El agente halogenante se puede utilizar en una proporción desde 1 hasta 20 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 8 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (XV). Esta reacción generalmente se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción y puede ser, por ejemplo, un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 150°C, preferiblemente desde 20 hasta 100°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 24 horas.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [7]



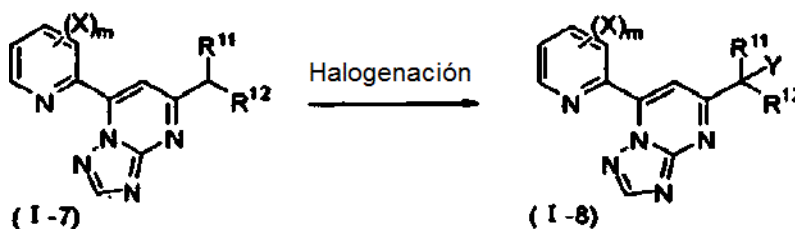
En el procedimiento de producción [7], R⁹, R^{1c}, X y m son como lo definido anteriormente.

El procedimiento de producción [7] comprende una primera parte de la reacción del compuesto de la fórmula (X) y el compuesto de la fórmula (XVI) para obtener el compuesto de la fórmula (IX) y una segunda parte de la reacción de condensación del compuesto de la fórmula (IX) y el compuesto de la fórmula (V) para obtener la [1,2,4] triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (1-5).

En la primera parte del procedimiento de producción [7], el compuesto de la fórmula (XVI) se puede utilizar en una proporción desde 0,8 hasta una cantidad en gran exceso, preferiblemente desde 1 hasta 10 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (X). Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia de una base y un disolvente. La base puede usarse, por ejemplo, la misma base que la utilizada en la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [5]. La base puede usarse en una proporción desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (X). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, el mismo disolvente que el usado en la primera parte de la reacción del procedimiento de producción [5] y se prefiere un éter. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 70°C, preferiblemente desde 10 hasta 50°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 24 horas.

La segunda parte de la reacción del procedimiento de producción [7] puede llevarse a cabo de la misma manera que en la segunda parte de la reacción del procedimiento de producción [5].

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [8]

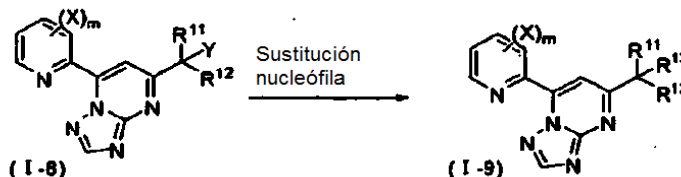


- 5 En el procedimiento de producción [8], cada uno de R^{11} y R^{12} que son independientes entre sí, es hidrógeno, alquilo o cicloalquilo y X, Y y m son como se ha definido anteriormente.

En el procedimiento de producción [8], el compuesto de la fórmula (I-7) y un agente de halogenación se hacen reaccionar en presencia de un disolvente y una pequeña cantidad de un iniciador de radicales para producir el derivado [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (I-8). Esta reacción puede llevarse a cabo, si es necesario, bajo irradiación con luz.

El agente halogenante puede ser, por ejemplo, N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida o N-yodosuccinimida. El agente halogenante se puede utilizar en una proporción desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 2 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (I-7). El iniciador de radicales puede ser, por ejemplo, el peróxido de benzoilo o azobisisobutironitrilo. El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción, y puede, por ejemplo, ser un hidrocarburo halogenado, tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano. La temperatura de reacción es normalmente desde 0 hasta 100°C, preferiblemente desde 10 hasta 80°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 0,1 hasta 24 horas.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [9]



- 25 En el procedimiento de producción [9], R^{13} es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo, que puede estar sustituido por A, alquénilo, que puede estar sustituido por A, alquínilo, que puede estar sustituido por A, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido por alquilo, OR^{14} , SR^{14} o $NR^{15}R^{16}$, cada uno de R^{14} , R^{15} y R^{16} que son independientes entre sí, es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquénilo que puede estar sustituido por A o alquínilo que puede estar sustituido por A y R^{11} , R^{12} , A, X y m son como se ha definido anteriormente.

En el procedimiento de producción [9], el compuesto de la fórmula (I-8) y se hace reaccionar con un reactivo nucleófilo en presencia de un disolvente para producir el derivado [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina de la fórmula (I-9).

El reactivo nucleófilo puede ser, por ejemplo, un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio o etóxido de sodio; un haloalcóxido de metal alcalino, tal como trifluorometil etóxido sódico; una mercaptida de metal alcalino, tal como metil mercaptano de sodio; una amina primaria o secundaria, tal como metilamina, dimetilamina, piperidina o morfolina; un reactivo de metal orgánico, tal como bromuro de metil magnesio, bromuro de etil magnesio o bromuro de fenil magnesio; un agente de fluoración, tal como fluoruro de potasio, fluoruro de cesio o fluoruro de tetrabutylamonio, o un agente de cianación, tal como cianuro de potasio o cianuro de sodio. El reactivo nucleófilo se puede utilizar en una proporción desde 1 hasta 5 cantidad equivalente, preferiblemente desde 1 hasta 3 cantidad equivalente por mol del compuesto de la fórmula (I-8). El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre que sea inerte para la reacción y puede ser, por ejemplo, el mismo disolvente usado en la reacción del procedimiento de producción [4]. La temperatura de reacción es normalmente desde -100 hasta 50°C, preferiblemente desde -70 hasta 20°C. El tiempo de reacción es normalmente desde 6 hasta 48 horas.

Entre los procedimientos de producción anteriores, se prefiere particularmente el procedimiento de producción [1], [5] o [7].

Las realizaciones preferidas de los pesticidas que contienen los compuestos de la presente invención se describirán a continuación. Los pesticidas que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente útiles, por

ejemplo, como agentes para el control de diversas plagas que se convierten en problemáticas en los campos agrícolas y hortícolas, es decir, los pesticidas agrícolas y hortícolas, o como agentes para controlar plagas que son parásitos de animales, es decir, pesticidas contra parásitos de animales. Los pesticidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención son útiles como un insecticida, un miticida, un nematocida o un pesticida del suelo y son eficaces para controlar los ácaros parásitos de plantas tales como la araña roja bima-
 5 culada (*Tetranychus urticae*), la araña carmín (*Tetranychus cinnabarinus*), la araña roja Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), el ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), el ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi*), el ácaro ancho (*Polyphagotarsonemus latus*), el ácaro de la herrumbre del cidro japonés (*Aculops pelekassi*), el ácaro de los bulbos (*Rhizoglyphus echinopus*); áfidos tales como el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) y el pulgón del
 10 algodón (*Aphis gossypii*); plagas de insectos agrícolas, como la polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*), el gusano soldado de la col (*Mamestra brassicae*), el gusano cortador (*Spodoptera litura*), la polilla de la manzana (*Laspeyresia pomonella*), el gusano mazorquero (*Heliothis zea*), la oruga del tabaco (*Heliothis virescens*), la polilla gitana (*Lymantria dispar*), el enrollador de la hoja del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), *Adoxophyes* sp., el escarabajo de la patata (*Leptinotarsa decemlineata*), el escarabajo de la hoja de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*), el picudo del algodón (*Anthonomus grandis*), chicharritas, saltahojas, escamas, chinches, moscas
 15 blancas, trips, saltamontes, antómidos, escarabajos, el gusano cortador negro (*Agrotis ipsilon*), el gusano cortador (*Agrotis segetum*) y hormigas; nematodos parásitos de las plantas, tales como los nematodos formadores de agallas, nematodos del quiste, nemátodos de la lesión de la raíz, el nematodo de la enfermedad de las puntas blancas en el arroz (*Aphelenchoides besseyi*), el nematodo de los brotes de la fresa (*Nothotylenchus acris*), el nematodo de la
 20 madera del pino (*Bursaphelenchus lignicolus*); gasterópodos, tales como las babosas y los caracoles, plagas del suelo, tales como los isópodos, tales como cochinillas de humedad (*Armadiidium vulgare*) y cochinillas (*Porcellio scaber*); plagas de insectos que afectan a la higiene, tales como el ácaro tropical de los ratones (*Ornithonyssus bacoti*), cucarachas, la mosca doméstica (*Musca domestica*) y el mosquito común (*Culex pipiens*); plagas de
 25 insectos de granos almacenados, tales como la polilla de los cereales (*Sitotroga cerealella*), el gorgojo chino (*Callosobruchus chinensis*), el escarabajo rojo de la harina (*Tribolium castaneum*) y gusanos de la harina; plagas de insectos de los artículos para el hogar, tales como la polilla de la ropa (*Tinea pellionella*), el escarabajo negro de la alfombra (*Anthrenus scrophularidae*) y las termitas subterráneas, los ácaros domésticos, tales como el ácaro del moho (*Tyrophagus putrescentiae*), *Dermatophagoides farinae*, *Chelacaropsis moorei*, etc. Entre ellos, los pesticidas
 30 agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente eficaces para controlar los ácaros parásitos de plantas, las plagas de insectos agrícolas, los nematodos parásitos de las plantas o similares. Particularmente, son más eficaces para controlar los ácaros parásitos de plantas y plagas de insectos agrícolas y, en consecuencia, son más útiles como insecticida o miticida. Además, son eficaces contra plagas de insectos que han adquirido resistencia a los organofosforados, insecticidas carbamato y/o piretroides sintéticos. Además, los compuestos de la presente invención tienen excelentes propiedades sistémicas, y mediante la
 35 aplicación de los pesticidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención para el tratamiento del suelo, se pueden controlar no solamente insectos nocivos, ácaros nocivos, nematodos nocivos, gasterópodos nocivos e isópodos nocivos en el suelo, sino también las plagas del follaje.

Otras realizaciones preferidas de los pesticidas que contienen los compuestos de la presente invención pueden ser
 40 pesticidas agrícolas y hortícolas que controlan colectivamente los ácaros parásitos de las plantas antes mencionadas, plagas agrícolas de insectos, nematodos parásitos de las plantas, gasterópodos y plagas del suelo

El pesticida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención, se formula usualmente
 45 mezclando el compuesto con diferentes coadyuvantes agrícolas y se utiliza en forma de una formulación, tal como un polvo, gránulos, gránulos dispersables en agua, un polvo humectable, un concentrado en suspensión acuosa, un concentrado en suspensión oleosa, gránulos solubles en agua, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, una pasta, un aerosol o una formulación de volumen ultra-bajo. Sin embargo, siempre que sea conveniente para el propósito de la presente invención, se pueden formular en cualquier tipo de formulación que se utiliza
 50 comúnmente en este campo. Tales adyuvantes agrícolas incluyen vehículos sólidos, tales como tierra de diatomeas, cal apagada, carbonato de calcio, talco, carbono blanco, caolín, bentonita, caolinita, sericita, arcilla, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio, mirabilita, zeolita y almidón; disolventes, tales 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; tensioactivos aniónicos, tales como una sal de
 55 ácidos grasos, un benzoato, un alquilsulfosuccinato, un dialquilsulfosuccinato, un policarboxilato, una sal de éster de ácido alquilsulfúrico, un sulfato de alquilo, un sulfato de alquilarilo, un sulfato de diglicol éter de alquilo, una sal del éster de alcohol ácido sulfúrico, un sulfonato de alquilo, un sulfonato de alquilarilo, un sulfonato de arilo, un sulfonato de lignina, un disulfonato de éter alquildifenilo, un sulfonato de poliestireno, una sal de éster de ácido alquilsulfúrico, un fosfato de alquilarilo, un fosfato de estirilarilo, una sal de éster de ácido polioxietilen alquil éter sulfúrico, un sulfato de polioxietilen alquilaril éter, una sal de éster de ácido polioxietilen alquilaril éter sulfúrico, un fosfato de polioxietilen
 60 alquil éter, una sal de éster del ácido polioxietilen alquilaril fosfórico y una sal de un condensado de sulfonato de naftaleno con formalina; tensioactivos no iónicos, tales como un éster de ácido graso de sorbitán, un éster de ácido graso de glicerina, un poliglicérido de ácido graso, un poliglicol éter de alcohol de ácido graso, acetilenglicol, alcohol acetileno, un polímero de bloques de oxialquilen, un éter de polioxietilen de alquilo, un éter de polioxietilen de alquilarilo, un éter de polioxietileno de estilarilo, un éter de polioxietilen glicol de alquilo, un polietilenglicol, un éster
 65 de ácido graso de polioxietileno, un éster de polioxietileno sorbitán de ácido graso, un éster de ácido graso de polioxietileno de glicerina, un aceite de ricino de polioxietileno hidrogenado y un éster de ácido graso de

polioxipropileno, aceites vegetales y minerales, tales como aceite de oliva, aceite de capoc, 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 de tung y parafinas líquidas, etc. Cada uno de los componentes como tales adyuvantes pueden ser uno o más seleccionados adecuadamente para su uso, siempre y cuando sirvan para lograr el objeto de la presente invención. Además, también se pueden emplear varios aditivos que se utilizan comúnmente, tales como una carga, un espesante, un agente anti-sedimentación, un agente anti-congelante, un estabilizador de la dispersión, un agente reductor de la fitotoxicidad, un agente anti-moho, etc.

- 10 La relación en peso entre el compuesto de la presente invención y los diversos adyuvantes agrícolas es habitualmente desde 0,001:99.999 hasta 95:5, preferiblemente desde 0,005:99.995 hasta 90:10.

En la aplicación real de tal formulación, esta puede utilizarse tal cual o se puede diluir hasta una concentración predeterminada con un diluyente, tal como agua y diversos esparcidores, por ej., tensioactivos, aceites vegetales o aceites minerales que pueden añadirse a la misma, como se requiera en cada caso.

- La aplicación del insecticida y/o miticida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención no se puede definir generalmente, ya que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, el tipo de la formulación, la estación de aplicación, el sitio de aplicación o los tipos o el grado de aparición de los insectos plagas. Sin embargo, se aplica usualmente en una concentración del principio activo que es desde 0,05 hasta 800.000 ppm, preferiblemente desde 0,5 hasta 500.000 ppm y la dosis por unidad de área es tal, que el compuesto de la presente invención es desde 0,05 hasta 50.000 g, preferiblemente desde 1 hasta 30.000 g, por hectárea. Además, los miticidas y/o insecticidas agrícolas y hortícolas como otra realización preferida de miticidas y/o insecticidas que contienen los compuestos de la presente invención se pueden aplicar de acuerdo con la aplicación de miticidas y/o insecticidas anteriormente descrita. La presente invención, incluye un método para controlar plagas de insectos, en particular para el control de ácaros parásitos de plantas, plagas agrícolas de insectos o nematodos parásitos de plantas mediante dichas aplicaciones.

- Las diversas formulaciones de pesticidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención o sus composiciones diluidas pueden aplicarse por métodos convencionales de aplicación que se emplean comúnmente, tales como pulverización (por ejemplo, pulverización, chorro, nebulización, atomización, dispersión de polvo o grano o dispersión en agua), aplicación al suelo (por ejemplo, mezclando o empapando), aplicación a la superficie (por ejemplo, recubrimiento, pulverización o cobertura) o impregnación para obtener alimento venenoso. Además, es posible alimentar a los animales domésticos con un alimento que contenga el principio activo anterior y para controlar el brote o crecimiento de las plagas de insectos, con sus excrementos. Además, el principio activo también puede aplicarse mediante el denominado método de aplicación de volumen ultra-bajo. En este método, la composición puede estar compuesta de 100% del principio activo.

- Además, los miticidas y/o insecticidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención pueden ser mezclados con o pueden ser utilizados en combinación con otros productos químicos agrícolas, fertilizantes o agentes reductores de la fitotoxicidad, con lo que a veces se pueden obtener efectos o actividades sinérgicas. Tales otros productos químicos agrícolas incluyen, por ejemplo, un herbicida, un insecticida, un miticida, un nematocida, un pesticida para el suelo, un fungicida, un agente antiviral, un atrayente, un antibiótico, una hormona vegetal, un agente regulador del crecimiento vegetal, etc. Especialmente, con un plaguicida mixto que tiene un compuesto de la presente invención mezclado con o utilizado en combinación con uno o más compuestos activos de otros productos químicos agrícolas, el intervalo de aplicación, el tiempo de aplicación, las actividades pesticidas, etc. pueden mejorarse en los aspectos preferidos. El compuesto de la presente invención y los compuestos activos de otros productos químicos agrícolas se pueden formular separadamente de manera que se pueden mezclar para su uso en el momento de la aplicación, o se pueden formular juntos. La presente invención incluye tal composición plaguicida mixta.

- La relación de mezcla entre el compuesto de la presente invención y los compuestos activos de otros productos químicos agrícolas no se puede definir generalmente, ya que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, los tipos de formulaciones, el tiempo de aplicación, el sitio de aplicación, los tipos o el grado de aparición de las plagas de insectos, etc., pero por lo general está dentro de un intervalo de desde 1:300 hasta 300:1, preferiblemente desde 1:100 hasta 100:1, en peso. Además, la dosis para la aplicación es tal, que la cantidad total de los compuestos activos es desde 0,1 hasta 50.000 g, preferiblemente desde 1 hasta 30.000 g, por hectárea. La presente invención incluye un método para controlar plagas mediante la aplicación de tal composición plaguicida mixta.

- Los compuestos activos de los agentes de control de insectos de plagas, tales como insecticidas, miticidas, nematocidas o pesticidas de suelo en los anteriormente mencionados productos químicos agrícolas, incluyen, por ejemplo, (con nombres comunes, algunos de ellos están todavía en una fase de solicitud, o códigos de ensayo) compuestos orgánicos de fosfato, tales como profenofos, diclorvos, fenamifos, fenitrotión, EPN, diazinona, clorpirifos, clorpirifos-metil, acefato, protiofos, fostiazato, cadusafos, disulfoton, isoxatión, isofenfos, etión, etrimfos, quinalfos, dimetilvinfos, dimetoato, sulprofos, tiometón, vamidotión, piraclofos, piridafentión, pirimifosmetilo, propafos, fosadona,

formotión, malatión, tetraclovinfos, clorfenvinfos, cianofos, triclorfón, metidatión, fentoato, ESP, azinfosmetilo, fentión, heptenofos, metoxicloro, paratión, fosfocarb, demetón-S-metilo, monocrotofos, metamidofos, imiciafos, paratión-metilo, terbufos, fosfamidón, fosmet y forato; compuestos carbamato tales como carbarilo, propoxur, aldicarb, carbofurano, tiodicarb, metomilo, oxamilo, etiofencarb, pirimicarb, fenobucarb, carbosulfán, benfuracarb, bendiocarb, furatiocarb, isoprocarb, metolcarb, xililcarb, XMC y fenotiocarb; derivados de nereistoxina, tales como cartap, tiociclam, bensultap y tiosultap-sodio; compuestos orgánicos de cloro, tales como dicofol, tetradifón, endosulfan, dienocloro y dieldrina; compuestos orgánicos metálicos, tales como óxido de fenbutatina y cihexatina; compuestos piretroide, tales como fenvalerato, permetrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, teflutrina, etofenprox, flufenprox, ciflutrina, fenpropatrina, flucitrinato, fluvalinato, cicloprotrina, lambda-cihalotrina, piretrinas, esfenvalerato, tetrametrina, resmetrina, protrifenbute, bifentrina, zeta-cipermetrina, acrinatrina, alfa-cipermetrina, aletrina, gamma-cihalotrina, teta-cipermetrina, tau-fluvalinato, tralometrina, proflutrina, beta-cipermetrina, beta-ciflutrina, metoflutrina y fenotrina; compuestos benzoilurea, tales como diflubenzurón, clorfluazurón, teflubenzurón, flufenoxurón, triflumurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, bistrifluron y fluazurón; compuestos similares a las hormonas juveniles, tales como metopreno, piriproxifeno, fenoxicarb y diofenolan; compuestos pirazol, tales como fenpiroximato, fipronil, tebufenpirad, etiprol, tolfenpirad, acetoprol, pirafuprol y piriprol; neonicotinoides tales como imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid, tiametoxam, clotianidina, dinotefuran y nitiazina, compuestos hidrazina, tales como tebufenozida, metoxifenozida, cromafenozida y halofenozida; compuestos piridina, tales como piridarilo y flonicamid; compuestos de ácido tetrónico, tales como espiroclorfenol; compuestos estrobilurina, tales como fluciclorfenol; compuestos piridinamina, tales como flufenimer; compuestos dinitro; compuestos orgánicos de azufre, compuestos de urea; compuestos de triazina; compuestos de hidrazona y otros compuestos, tales como buprofezina, hexitiazox, amitraz, clordimeform, silafluofeno, triazamato, pimetrozina, pirimidifen, clorfenapir, indoxacarb, acequinocil, etoxazol, ciromazina, 1,3-dicloropropeno, diafenthiurón, benclofliaz, bifentazato, espiromesifeno, espirotetramato, propargita, clofentezina, metaflumizona, flubendiamida, ciflumetofeno, clorantraniliprol, ciperpirafeno, pirifluquinazona, fenazaquin, piridaben, amidoflomet, clorobenzoato, sulfluramida, hidrametilnon, metaldehído, HGW 86 y rianodina. Además, los productos químicos agrícolas microbianos, tales como *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, cristal de proteína insecticida producido por *Bacillus thuringiensis*, virus de insectos, hongos entomopatógenos y hongos nematófagos; antibióticos o antibióticos semisintéticos, tales como avermectina, emamectina-benzoato, milbectina, milbemectina, spinosad, ivermectina, lepmectina, DE-175, abamectina y emamectina; y pueden mencionarse, por ejemplo, productos naturales, tales como azadiractina y rotenona y repelentes, tales como DEET.

Los compuestos fungicidas activos en los anteriormente mencionados otros productos químicos agrícolas incluyen, por ejemplo, (con nombres comunes, algunos de ellos están todavía en una fase de solicitud, o códigos de ensayo de la Asociación Japonesa para la Protección de las Plantas) compuestos de anilino, tales como mepanipirim, pirimetanil y ciprodinil; compuestos piridinamina, tales como fluzinam; compuestos azol, tales como triadimefón, bitertanol, triflumizol, etaconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, miclobutanil, ciproconazol, tebuconazol, hexaconazol, furconazol-cis, procloraz, metconazol, epoxiconazol, tetraconazol, fumarato de oxpoconazol, sipconazol, protioconazol, triadimenol, flutriafol, difenoconazol, fluquinconazol, fenbuconazol, bromuconazol, diniconazol, tricloclazol, probenazol, simeconazol, pefurazoato, ipconazol e imibenconazol; compuestos quinoxalina, tales como quinometionato; compuestos ditiocarbamato, tales como maneb, zineb, mancozeb, policarbamato, metiram, propineb y tiram; compuestos orgánicos de cloro tales, como ftaluros, clorotalonil y quinceno; compuestos imidazol, tales como benomil, tiofanato-metilo, carbendazim, tiabendazol, fuberiazole y ciazofamida; compuestos cianoacetamida, tales como cimoxanilo; compuestos fenilamida, tales como metalaxil, metalaxil-M, mefenoxam, oxadixil, ofurace, benalaxil, benalaxil-M (otro nombre: kiralaxil, quiraxil), furalaxil y ciprofuram; compuestos de ácido sulfénico, tales como diclofluanid; compuestos de cobre, tales como hidróxido cúprico y el cobre de oxina; compuestos isoxazol, tales como himexazol; compuestos organofosforados, tales como fosetil-Al, tolclofos-metilo, edifenfos, iprobenfos, S-bencilo, O,O-diisopropilfosforotioato, o-etilo, S,S-difenilfosforoditioato y etilhidrógeno fosfonato de aluminio; compuestos N-halógenoalquilo, tales como captan, captafol y folpet; compuestos dicarboximida, tales como procimidona, iprodiona y vinclozolina; compuestos benzanilida, tales como flutolanil, mepronil, zoxamid y tiadinil; compuestos anilida, tales como carboxin, oxicarboxin, tifulzamida, pentiopirad y boscalid; compuestos piperazina, tales como triforina; compuestos piridina, tales como pirifenox; compuestos carbinol, tales como fenarimol y flutriafol; compuestos piperidina, tales como fenpropidina; compuestos morfina, tales como fenpropimorf, espiroamina y tridemorf; compuestos de organoestaño, tales como hidróxido de fentina y acetato de fentina; compuestos urea, tales como penciclorón; compuestos de ácido cinámico, tales como dimetomorf y flumorf; compuestos fenilcarbamato, tales como dietofencarb; compuestos cianopirrol, tales como fludioxonil y fenpicloronil; compuestos estrobilurina, tales como azoxistrobina, cresoxim-metilo, metominofen, trifloxistrobina, picoxistrobina, orizastrobina, dimoxistrobina, piraclostrobina, fluoxastrobina y fluacipirín; compuestos oxazolidinona, tales como famoxadona; compuestos tiazolcarboxamida, tales como etaboxam; compuestos silil amida, tales como siltiofam, compuestos amidocarbamato de aminoácidos, tales como iprovalicarbo y bentiavalicarbo-isopropilo; compuestos imidazolidina, tales como fenamidona; compuestos hidroxanilida, tales como fenhexamida; compuestos bencenosulfonamida, tales como flusulfamida; compuestos oxima éter, tales como ciflufenamida; compuestos fenoxiamida, tales como fenoxanil; antibióticos, tales como validamicina, kasugamicina y polioxinas; compuestos guanidina tales como iminactadina y otros compuestos, tales como isoprotiolano, piroquilon, diclomezina, quinoxifeno, hidrocloreto de propamocarb, cloropicrina, dazomet, metam sodio, nicobifeno, metrafenona, MTF 753, 307-UBF, diclocimet, proquinazid, amisulbrom (otro nombre: amibromdol), piribencarb,

Syngenta 446510 (mandipropamid, dipromandamid), fluopicolide, carpropamid, BCF051, BCM061 y BCM062.

Además, los productos químicos agrícolas que pueden ser utilizados en mezcla con o en combinación con los compuestos de la presente invención, pueden ser, por ejemplo, los principios activos de los compuestos herbicidas como los descritos en Farm Chemicals Handbook (2002 Edita), en particular los de tipo de tratamiento del suelo.

Los pesticidas contra parásitos en animales son eficaces para controlar, por ejemplo, parásitos externos que son parásitos de la superficie corporal de los animales hospedadores (por ejemplo, la espalda, la axila, la parte inferior del abdomen o la parte interior del muslo) o parásitos internos que son parásitos en el cuerpo de animales hospedadores (tales como el estómago, el tracto intestinal, el pulmón, el corazón, el hígado, los vasos sanguíneos, el tejido subcutáneo o los tejidos linfáticos), pero son particularmente eficaces para controlar los parásitos externos.

Los parásitos externos pueden ser, por ejemplo, ácaros parásitos de animales o pulgas. Sus especies son tantas que es difícil hacer una lista de todas ellas, y por lo tanto, se mencionarán ejemplos típicos.

Los ácaros parásitos de animales pueden ser, por ejemplo, tales como Boophilus microplus, Rhipicephalus sanguineus, Haemaphysalis longicornis, Haemaphysalis flava, Haemaphysalis campanulata, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis japonica, Haemaphysalis kitaokai, Haemaphysalis ias, Ixodes ovatus, Ixodes nipponensis, Ixodes persulcatus, Amblyomma testudinarium, Haemaphysalis megaspinosa, Dermacentor reticulatus y Dermacentor taiwanensis; el ácaro rojo de las gallinas (Dermanyssus gallinae); ácaros de las aves del norte, tales como Ornithonyssus sylviarum y Ornithonyssus bursa; trombidídeos, tales como Eutrombicula wichmanni, Leptotrombidium akamushi, Leptotrombidium pallidum, Leptotrombidium fuji, Leptotrombidium tosa, Neotrombicula autumnalis, Eutrombicula alfreddugesi y Helenicula miyagawai; queiletielas, tales como Cheyletiella yasguri, Cheyletiella parasitivorax y Cheyletiella blakei; ácaros de la sarna sarcóptica, tales como Psoroptes cuniculi, Chorioptes bovis, Otodectes cynotis, Sarcoptes scabiei y Notoedres cati y Demodicidae, tales como Demodex canis. Los pesticidas contra parásitos en animales, que contienen los compuestos de la presente invención, son particularmente eficaces para el control de garrapatas en ellos.

Las pulgas pueden ser, por ejemplo, insectos sin alas externamente parásitos pertenecientes a Siphonaptera, más específicamente, las pulgas pertenecientes a Pulicidae, Ceratophyllus, etc. Las pulgas pertenecientes a Pulicidae pueden ser, por ejemplo, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Echidnophaga gallinacea, Xenopsylla cheopis, Leptopsylla segnis, Nosopsyllus fasciatus y Monopsyllus anisus. Los pesticidas contra parásitos de animales, que contienen los compuestos de la presente invención, son particularmente eficaces para el control de pulgas pertenecientes a Pulicidae, particularmente Ctenocephalides canis y Ctenocephalides felis, entre otros.

Otros parásitos externos pueden ser, por ejemplo, piojos chupadores (Anoplura), tales como el piojo de nariz corta del ganado (Haematopinus eurysternus), el piojo chupador del caballo (Haematopinus asini), el piojo de nariz larga del ganado (Linognathus vituli) y el piojo de la cabeza (Pediculus capitis); piojos mordedores, tales como el piojo mordedor del perro (Trichodectes canis) e insectos dípteros chupadores de sangre, tales como el tábano (Tabanus trigonus), jejenes mordedores (Culicoides schultzei) y la mosca negra (Simulium ornatum). Además, los parásitos internos pueden ser, por ejemplo, ser nematodos tales como gusanos del pulmón, tricocéfalos (Trichuris), parásitos gástricos, gusanos tuberosos, Ascaris y Filarioidea; cestodos, tales como Spirometra erinacei, Diphylllobothrium latum, Dipylidium caninum, Taenia multiceps, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis; trematodos, tales como Schistosoma japonicum, Fasciola hepatica y protozoos, tales como coccidios, parásitos productores del paludismo (Plasmodium malariae), Sarcocystis intestinalis, Toxoplasma y Cryptosporidium.

Los animales hospedadores pueden ser, por ejemplo, animales de compañía, animales domésticos y aves de corral, tales como perros, gatos, ratones, ratas, hámsteres, cobayas, ardillas, conejos, hurones, aves (tales como palomas, loros, colinas, minas, gorriones de Java, loriquitos, agapornis y canarios), vacas, caballos, cerdos, ovejas, patos y pollos. Los pesticidas contra parásitos de animales, que contienen los compuestos de la presente invención, son particularmente eficaces para el control de plagas parasitarias en animales de compañía y animales domésticos, especialmente para el control de parásitos externos, entre ellos. Entre los animales de compañía y animales domésticos, son eficaces especialmente para perros y gatos, vacas y caballos.

Cuando el compuesto de la presente invención se utiliza como plaguicida contra parásitos en animales, se puede utilizar tal como está o se puede usar junto con los adyuvantes adecuados, formulado en diversas formulaciones, tales como un polvo, gránulos, comprimidos, polvos, cápsulas, un concentrado soluble, un concentrado emulsionable, un concentrado en suspensión acuosa y un concentrado en suspensión oleosa. Además de estas formulaciones, se pueden formular en cualquier tipo de formulación que se utiliza comúnmente en este campo, con tal de que sea adecuado para el propósito de la presente invención. Los adyuvantes para su utilización en formulaciones pueden ser, por ejemplo, tensioactivos aniónicos o no iónicos ejemplificados anteriormente como adyuvantes para la formulación de pesticidas agrícolas y hortícolas; un tensioactivo catiónico, tal como bromuro de cetil trimetilamonio; un disolvente, tal como agua, acetona, acetonitrilo, monometilacetamida, dimetilacetamida, dimetilformamida, 2-pirrolidona, N-metil-2-pirrolidona, queroseno, triacetina, metanol, etanol, isopropanol, alcohol bencílico, etilenglicol, propilenglicol, polietilenglicol, polioxietilenglicol líquido, butildiglicol, etilenglicol monometil éter, etilenglicol monoetil éter, dietilenglicol monoetil éter, dietilenglicol n-butil-éter, dipropilenglicol monometil éter o

dipropilenglicol n-butil éter; un antioxidante, tal como butilhidroxianisol, butilhidroxitolueno, ácido ascórbico, hidrógenometasulfito de sodio, galato de propilo o tiosulfato de sodio; un agente de recubrimiento filmógeno, tal como la polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico o un copolímero de acetato de vinilo y vinilpirrolidona; los aceites vegetales y aceites minerales, como los ejemplificados anteriormente como adyuvantes para la formulación de pesticidas agrícolas y hortícolas; un vehículo, tal como lactosa, sacarosa, glucosa, almidón, harina de trigo, polvo de maíz, torta y harina de soja, salvado de arroz desengrasado, carbonato de calcio u otras materias primas comercialmente disponibles, etc. Uno o más de los componentes respectivos de estos adyuvantes se pueden seleccionar adecuadamente para su uso, siempre que no se aparten de la finalidad de la presente invención. Además, aparte de los adyuvantes anteriormente mencionados, se pueden seleccionar adecuadamente para su uso algunos de entre los conocidos en este campo, y aún más, se pueden seleccionar adecuadamente para su uso algunos de entre los diversos adyuvantes anteriormente mencionados para ser utilizados en el campo agrícola y hortícola.

La relación de mezcla entre el compuesto de la presente invención y los diversos adyuvantes generalmente es de 0,1:99,9 hasta 90:10. En el uso real de tal formulación, esta puede ser utilizada tal cual, o se puede diluir hasta una concentración predeterminada con un diluyente, tal como agua y se pueden añadir a la misma diversos esparcidores (por ej., tensioactivos, aceites vegetales o aceites minerales) como se requiera en cada caso.

La administración del compuesto de la presente invención a un animal hospedador se lleva a cabo por vía oral o parenteral. Como un método de administración oral, se puede mencionar un método de administración de un comprimido, un agente líquido, una cápsula, una oblea, una galleta, carne picada u otros alimentos, que contenga el compuesto de la presente invención. Como método de administración parenteral, puede mencionarse, por ejemplo, un método en el que el compuesto de la presente invención se formula en una formulación adecuada y, a continuación se introduce en el cuerpo, por ejemplo, por administración intravenosa, administración intramuscular, administración intradérmica, administración hipodérmica, etc., un método en el que se administra sobre la superficie del cuerpo por tratamiento de aplicación superficial, tratamiento de vertido o tratamiento de pulverización o un método para incorporar un fragmento de resina o similar que contiene el compuesto de la presente invención bajo la piel del hospedador animal.

La dosis del compuesto de la presente invención en un animal hospedador varía dependiendo del método de administración, el propósito de la administración, el síntoma a disminuir, etc., pero generalmente se administran en una proporción desde 0,01 mg hasta 100 g, preferiblemente desde 0,1 mg hasta 10 g, por 1 kg del peso corporal del animal hospedador.

La presente invención también incluye un método para controlar una plaga por el método de administración mencionado anteriormente o con la dosis mencionada anteriormente, particularmente un método para controlar los parásitos externos o parásitos internos.

Además, en la presente invención, mediante el control de plagas parasitarias en animales como se ha descrito anteriormente, es posible prevenir o curar diversas enfermedades del animal hospedador que puedan causar en algunos casos. Por lo tanto, la presente invención también incluye un agente preventivo o terapéutico para una enfermedad animal causada por parásitos, que contiene el compuesto de la presente invención como un principio activo y un método para prevenir o curar una enfermedad animal causada por parásitos.

Cuando el compuesto de la presente invención se utiliza como pesticida contra parásitos en animales, se pueden usar diversas vitaminas, minerales, aminoácidos, nutrientes, enzimas, antipiréticos, sedantes, antiflogísticos, fungicidas, colorantes, sustancias aromáticas, conservantes, etc., mezclados con o en combinación con los adyuvantes. Además, según requiera el caso, se pueden mezclar o combinar para su uso otros fármacos animales o productos químicos agrícolas, tales como vermícidias, agentes anticoccidio, insecticidas, miticidas, pulicidas, nematocidas, bactericidas o agentes antibacterianos, pudiéndose obtener en ocasiones efectos mejorados. La presente invención incluye una composición pesticida mixta de este tipo que tiene los diversos componentes mencionados anteriormente mezclados o combinados para su uso, y aún más un método para controlar una plaga mediante el uso de la misma, particularmente un método para controlar los parásitos externos o los parásitos internos.

Las realizaciones preferidas de los compuestos de la fórmula (I) anterior son las siguientes. Sin embargo, se debe entender que la presente invención no queda de ningún modo restringida.

- (1) Un derivado piridil-triazolopirimidina representado por la fórmula (I) anterior o su sal.
- (2) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (1), en la que R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquenilo que puede estar sustituido por A, alquinilo que puede estar sustituido por A, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 ; R^2 es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo o arilo; R^3 es alquilo; R^5 es hidrógeno o alquilo; A es halógeno, OR^2 , $S(O)_nR^3$, NR^4R^5 , ciano, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico y X es alquilo, alquenilo, alquinilo, halógeno, haloalquilo, ciano o nitro.
- (3) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (2), en la que R^1 es hidrógeno,

alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alqueno, alquino, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

(4) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (3), en la que R^1 es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquino, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

(5) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (2), en la que R^1 es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alqueno que puede estar sustituido por A, alquino que puede estar sustituido por A, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

(6) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (5), en la que R^1 es alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alqueno, alquino, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

(7) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (6), en la que R^1 es alquilo, haloalquilo, cicloalquilo o alqueno.

(8) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (5), en la que R^1 es alquilo, haloalquilo, alquino, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

(9) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (8), en la que R^1 es alquilo, haloalquilo, alquino, ciano, arilo, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

(10) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (9), en la que R^1 es alquilo, trifluorometilo, alquino, ciano, fenilo, alcoxi, tioalquilo, alquilsulfonilo, dialquilamino o amino.

(11) El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la anterior (2), en la que X es alquilo, alquino, halógeno, haloalquilo, ciano o nitro.

Ejemplos

Ahora, la presente invención se describirá con más detalle con referencia a Ejemplos, pero se debe entender que la presente invención no se limita de ninguna manera a los mismos. En primer lugar, se describirán los Ejemplos de Preparación del compuesto de la presente invención.

Ejemplo de preparación 1

Preparación de 7-(3-bromo-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 4)

(1) Se hicieron reaccionar 728 mg de 2-acetil-3-bromo-5-(trifluorometil)piridina y 466 mg de N,N-dimetilformamida dimetil acetal en 5 ml de tolueno a 100°C durante 16 horas. El líquido de reacción se concentró a presión reducida para obtener 866 mg de 1-(3-bromo-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-3-(dimetilamino)-2-propen-1-ona (intermedio mencionado posteriormente como N° IV-7).

(2) Se disolvieron 866 mg de 1-(3-bromo-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-3-(dimetilamino)-2-propen-1-ona obtenida en (1) en 10 ml de ácido acético y 225 mg de 3-amino-1H-1,2,4-triazol, seguido por reflujo con calentamiento durante 7 horas. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/2) para obtener 402 mg del producto deseado.

Ejemplo de preparación 2

Preparación de 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 19)

(1) Se hicieron reaccionar 1,0 g de 2-acetil-3-cloro-5-(trifluorometil)piridina y 715 mg de N,N-dimetilacetamida dimetil acetal en 6 ml de tolueno a 100°C durante 14 horas. El líquido de reacción se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: acetato de etilo) para obtener 869 mg de 1-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-3-(dimetilamino)-2-buten-1-ona (intermedio mencionado posteriormente como N° IV-1).

(2) Se disolvieron 850 mg de 1-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-3-(dimetilamino)-2-buten-1-ona obtenidos en (1) 3 ml de ácido acético y se añadieron 244 mg de 3-amino-1H-1,2,4-triazol, seguido por reflujo con calentamiento durante 17 horas. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se lavó con una solución saturada de bicarbonato sódico acuoso y se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 609 mg del producto deseado.

Ejemplo de preparación 3

Preparación de 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 20)

(1) Se añadieron 608 mg de una solución etanólica al 21% de etóxido de sodio 0°C a una solución de 9 ml de

tetrahidrofurano (deshidratado) de 1 g de 2-acetil-3-cloro-5-(trifluorometil)piridina y 635 mg de 2,2,2-trifluoroacetato de etilo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 13 horas. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida para obtener 1,4 g de 1-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-4,4,4-trifluorobutan-1,3-diona (intermedio mencionado posteriormente como N° IX-25).

(2) A una solución de 9 ml de ácido acético de 1-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-4,4,4-trifluorobutan-1,3-diona obtenida en (1), se añadieron 376 mg de 3-amino-1H-1,2,4-triazol, seguido por reflujo con calentamiento durante 6 horas. Después de la terminación de la reacción, el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 4/1) para obtener 111 mg del producto deseado

Ejemplo de preparación 4

Preparación de 5-(metiltio)-7-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 21)

(1) Se añadieron 3,68 g de t-butoxido potásico y 3,1 g de 2-acetil-5-(trifluorometil)piridina a 55 ml de tetrahidrofurano (deshidratado), seguido de agitación a temperatura ambiente. Diez minutos después, se añadieron 1,37 g de disulfuro de carbono y 4,9 g de yoduro de metilo, en este orden, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 12 horas. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 9/1) para obtener 3,0 g de 3,3-bis(metiltio)-1-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-2-propen-1-ona.

(2) A una solución de 30 ml de N-metilpirrolidinona de 2,7 g de 3,3-bis(metiltio)-1-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-2-propen-1-ona obtenida en (1), se añadieron 1,16 g de 3-amino-1H-1,2,4-triazol y 2,5 g de carbonato potásico, seguido de agitación a 150°C durante 30 minutos. Después de la terminación de la reacción, el líquido de reacción se devolvió a temperatura ambiente, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se lavó con una solución salina saturada y se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 4/1) para obtener 600 mg del producto deseado.

Ejemplo de preparación 5

Preparación de 5-(metilsulfonil)-7-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 22)

Se añadieron 700 mg de ácido m-cloroperbenzoico a una solución de 120 ml de cloroformo de 420 mg de 5-(metiltio)-7-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, seguido de reflujo con calentamiento durante 2 horas. Después de la terminación de la reacción, el líquido de reacción se devolvió a temperatura ambiente, se añadió una solución acuosa de hidróxido de sodio 1N al líquido de reacción, seguido de extracción con cloroformo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 420 mg del producto deseado.

Ejemplo de preparación 6

Preparación de 5-metoxi-7-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 25)

Se añadieron 62 mg de una solución metanólica al 28% de metóxido de sodio a una solución de 3 ml de metanol de 100 mg de 5-(metilsulfonil)-7-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 5 minutos. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 85 mg del producto deseado.

Ejemplo de preparación 7

Preparación de 5-fenil-7-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 28)

Se añadieron 0,2 ml de una solución de tetrahidrofurano 3,0 M de bromuro de fenil magnesio a 0°C a una solución de 3 ml de tetrahidrofurano (deshidratado) de 200 mg de 5-(metilsulfonil)-7-(5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, seguido de agitación a 0°C durante 5 minutos. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 4/1) para obtener 93 mg del producto deseado.

Ejemplo de preparación 8

Preparación de 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-ciclopropil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 82)

- 5 (1) Se añadieron 805 mg de etóxido de sodio a una solución con 2 g de etil-3-cloro-5-(trifluorometil) piridina-2-carboxilato de metilo y 3,4 g de ciclopropil metil cetona disueltos en 15 ml de tetrahidrofurano (deshidratado), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 10 minutos. Después de la terminación de la reacción, se
- 10 añadió ácido clorhídrico 1N al líquido de reacción para acidificarla, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida para obtener un material líquido, que se confirmó que contenía 1-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-ciclopropilpropan-1,3-diona (intermedio N° IX-18) por RMN de ¹H.
- 15 (2) A la totalidad del material líquido obtenido en (1), se añadieron 15 ml de ácido acético y 730 mg de 3-amino-1H-1,2,4-triazol, seguido de agitación a 100°C durante la noche. Después de la terminación de la reacción, el disolvente se separó por destilación a presión reducida y se añadió agua al residuo obtenido, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de hidrógeno carbonato sódico acuoso y se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 4/1) para obtener 1,67 g del producto deseado.

20 Ejemplo de preparación 9

Preparación de 7-(3-bromo-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-isopropil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 95)

- 25 (1) Se añadieron 408 mg de etóxido de sodio a una solución con 1,2 g de etil-3-bromo-5-(trifluorometil) piridina-2-carboxilato de etilo y 1,73 g de isopropilmetil cetona disuelta en 13 ml de tetrahidrofurano (deshidratado), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 15 minutos. Después de la terminación de la reacción, se añadió ácido clorhídrico 1N al líquido de reacción para acidificarla, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida para obtener un líquido que contiene 1-(3-bromo-5-(trifluorometil) piridin-2-il)-4-metilpentan-1,3-diona (intermedio N° IX-22).
- 30 (2) A la totalidad del material líquido obtenido en (1), se añadieron 8 ml de ácido acético y 370 mg de 3-amino-1H-1,2,4-triazol, seguido de agitación a 100°C durante la noche. Después de la terminación de la reacción, el disolvente se separó por destilación a presión reducida y se añadió agua al residuo obtenido, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de hidrógenocarbonato sódico acuoso y se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 3/1) para obtener 650 mg del producto deseado.
- 35

Ejemplo de preparación 10

40

Preparación de 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 16)

- 45 (1) Se añadieron 3,2 g de etóxido de sodio a una solución con 6,0 g de etil-3-cloro-5-(trifluorometil) piridina-2-carboxilato de metilo y 2,6 g de metil-etil-cetona en 80 ml de tetrahidrofurano (deshidratado), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 15 minutos. Después de la terminación de la reacción, se añadió ácido clorhídrico 1N al líquido de reacción para acidificarla, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida para obtener un material líquido, que se confirmó que contenía 1-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-pentan-1,3-diona (intermedio N° IX-7) por RMN de ¹H.
- 50 (2) A la totalidad del material líquido obtenido en (1), se añadieron 65 ml de ácido acético y 2,2 g de 3-amino-1H-1,2,4-triazol, seguido de agitación a 100°C durante la noche. Después de la terminación de la reacción, el disolvente se separó por destilación a presión reducida y se añadió agua al residuo obtenido, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de hidrógenocarbonato sódico acuoso y se secó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 3/1) para obtener 3,1 g del producto deseado.
- 55

Ejemplo de preparación 11

- 60 Preparación de 5-(1-bromoetil)-7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 101)

- 65 Se añadieron 4,47 g de N-bromosuccinimida y 50 mg of azobisisobutilonitrilo (AIBN) a una solución que tiene 5,76 g de 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina disueltos en 30 ml de cloroformo, seguido de agitación durante la noche bajo reflujo con calentamiento. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se lavó sobre sulfato

de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 5/2) para obtener 4,47 g del producto deseado como un sólido.

5 Ejemplo de preparación 12

Preparación de 5-bromometil-7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 60)

Se añadieron 312 mg de N-bromosuccinimida y 13 mg de azobisisobutironitrilo (AIBN) a una solución que tiene 500 mg de 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina disueltos en 3 ml de tetracloruro de carbono, seguido de agitación durante la noche bajo reflujo con calentamiento. Después de la terminación de la reacción, se añadió agua al líquido de reacción, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se lavó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 7/3) para obtener 86 mg del producto deseado.

Ejemplo de preparación 13

Preparación de 7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-5-((2,2,2-trifluoroetoxi)metil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (compuesto N° 63)

Se añadieron 230 mg de 2,2,2-trifluoroetanol a una solución de 8 ml de tetrahidrofurano (deshidratado) de 33 mg de un hidruro sódico al 60%, seguido de agitación durante 5 minutos y se añadieron 300 mg de 5-bromometil-7-(3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina a temperatura ambiente, seguido de agitación durante 5 minutos. Después de la terminación de la reacción, se añadió ácido clorhídrico 1N para acidificarla, seguido de extracción con acetato de etilo, la capa orgánica se lavó sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se separó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 97 mg del producto deseado.

En la Tabla 1 se presentan ejemplos típicos del compuesto de la fórmula anterior (I). Estos compuestos se pueden preparar mediante los Ejemplos de preparación anteriormente descritos o mediante los diversos procedimientos anteriormente mencionados para la producción del compuesto de la presente invención. En la Tabla 1, N° representa el compuesto N°, Me metilo, Et etilo, n-Pro propilo normal, i-pr isopropilo, n-Bu butilo normal, t-Bu butilo terciario, sec-Bu butilo secundario, Ac acetilo y Ph fenilo, respectivamente y la temperatura mostrada como las propiedades físicas es el punto de fusión. Además, en la Tabla 2 se muestran datos de la RMN de ^1H de algunos de los compuestos de la fórmula anterior (I).

En la Tabla 3 se presentan ejemplos típicos del compuesto de la fórmula anterior (IV) del procedimiento de producción [1]. Estos compuestos se pueden preparar mediante los Ejemplos de preparación anteriormente descritos o mediante los diversos procedimientos de producción anteriormente descritos. En la Tabla 3, N° representa el N° del intermedio, Me metilo, Et etilo y n-Pr propilo normal, respectivamente y la temperatura mostrada como las propiedades físicas es el punto de fusión. Además, en la Tabla 4 se muestran datos de la RMN de ^1H de algunos de los compuestos de la fórmula anterior (IV).

En la Tabla 5 se presentan ejemplos típicos del compuesto de la fórmula (IX) de los procedimientos de producción [5] y [7]. Estos compuestos se pueden preparar mediante los Ejemplos de preparación anteriormente descritos o mediante los diversos procedimientos de producción anteriormente descritos. En la Tabla 5, N° representa el N° del intermedio, Me metilo, Et etilo, i-Pr isopropilo, i-Bu isobutilo, t-Bu butilo terciario, sec-Bu butilo secundario y Ph fenilo, respectivamente y la temperatura mostrada como las propiedades físicas es el punto de fusión. Además, en la Tabla 6 se muestran datos de la RMN de ^1H de algunos de los compuestos de la fórmula anterior (IX).

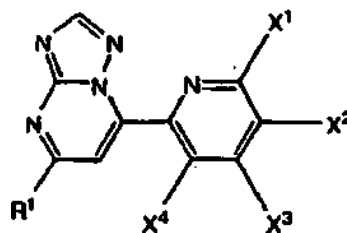
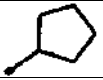
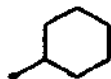
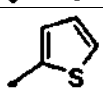
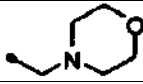
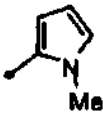
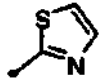


TABLA 1

Nº	R ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Propiedades físicas
1	H	CF ₃	H	H	H	118 a 120°C
2	H	H	CF ₃	H	H	110 a 112°C
3	H	H	H	H	CF ₃	173 a 174°C
4	H	H	CF ₃	H	Br	aceite
5	H	H	CF ₃	H	F	aceite
6	H	H	Cl	H	Cl	134 a 136°C
7	H	H	CF ₃	H	C≡C-t-Bu	aceite
8	H	H	H	CF ₃	H	168°C
9	H	Cl	H	CF ₃	H	183 a 185°C
10	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	132°C
11	H	H	NO ₂	H	Cl	57 a 60°C
12	H	H	CF ₃	H	NO ₂	aceite
13	H	H	Me	H	Cl	aceite
14	H	H	CF ₃	H	CN	aceite
15	Me	H	CF ₃	H	Br	156 a 158°C
16	Et	H	CF ₃	H	Cl	aceite
17	n-Pr	H	CF ₃	H	Cl	aceite
18	Me	H	CF ₃	H	H	sólido
19	Me	H	CF ₃	H	Cl	105 a 107°C
20	CF ₃	H	CF ₃	H	Cl	aceite
21	SMe	H	CF ₃	H	H	177 a 179°C
22	SO ₂ Me	H	CF ₃	H	H	Al menos 300°C
23	NMe ₂	H	CF ₃	H	H	195 a 198°C
24	Me	H	H	H	CF ₃	167 a 169°C
25	OMe	H	CF ₃	H	H	255°C
26	OCH ₂ C≡CCH ₃	H	CF ₃	H	H	168 a 170°C
27	CN	H	CF ₃	H	H	175°C
28	Ph	H	CF ₃	H	H	185 a 187°C
29	NH ₂	H	CF ₃	H	H	201 a 203°C
30	i-Pr	H	CF ₃	H	H	
31	t-Bu	H	CF ₃	H	H	
32	CH=CHMe	H	CF ₃	H	H	198 a 201 °C
33	C≡CMe	H	CF ₃	H	H	120 a 123°C
34		H	CF ₃	H	H	
35		H	CF ₃	H	H	
36		H	CF ₃	H	H	
37		H	CF ₃	H	H	
38	OCH ₂ -CF ₃	H	CF ₃	H	H	160 a 162°C
39	CH ₂ CN	H	CF ₃	H	H	
40	F	H	CF ₃	H	H	
41	Me	H	CF ₃	H	I	186 a 189°C
42	Me	H	CF ₃	H	F	
43	Me	H	CF ₃	H	CN	aceite
44	Me	H	CF ₃	H	Me	123°C
45	F	H	CF ₃	H	Cl	

N°	R ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Propiedades físicas
46	Cl	H	CF ₃ .	H	Cl	
47	Br	H	CF ₃	H	Cl	
48	CH ₂ OMe	H	CF ₃	H	Cl	aceite
49	CH ₂ OPh	H	CF ₃	H	Cl	
50	CH ₂ Ph	H	CF ₃	H	Cl	
51	Me	CF ₃	H	CF ₃	H	113°C
52	Me	H	CF ₃	H	Ph	aceite
53	CH ₂ Cl	H	CF ₃	H	Cl	aceite
54	CHCl ₂	H	CF ₃	H	Cl	aceite
55	Me	H	CF ₃	H	COOEt	95 a 98°C
56	Me	H	CF ₃	H	COOH	229 a 231°C
57	Me	H	Cl	H	CF ₃	
58	Me	H	CF ₃	H	COMe	aceite
59	Me	CF ₃	H	H	CF ₃	150 a 151°C
60	CH ₂ Br	H	CF ₃	H	Cl	aceite
61	CHBr ₂	H	CF ₃	H	Cl	147 a 150°C
62	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃	H	Cl	aceite
63	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	Cl	aceite
64	CH ₂ OCH(CF ₃) ₂	H	CF ₃	H	Cl	140 a 143°C
65	CH ₂ NMe ₂	H	CF ₃	H	Cl	aceite
66	CH ₂ NMeCH ₂ CH ₂ OH	H	CF ₃	H	Cl	aceite
67	Me	Cl	CF ₃	H	CF ₃	aceite
68	Me	Cl	CF ₃	H	Cl	142 a 143°C
69	Me	CF ₃	H	H	Cl	
70	CN	H	CF ₃	H	Cl	164 a 166°C
71	Me	CF ₃	H	H	Br	
72	CH ₂ SCH ₂ COOMe	H	CF ₃	H	Cl	aceite
73	CH ₂ CN	H	CF ₃	H	Cl	aceite
74	CH ₂ NMeCH ₂ CH ₂ OMe	H	CF ₃	H	Cl	aceite
75	CH ₂ NMeCH ₂ CN	H	CF ₃	H	Cl	aceite
76		H	CF ₃	H	Cl	aceite
77	CH ₂ CH (CN) ₂	H	CF ₃	H	Cl	aceite
78	Me	H	CF ₃	H	NO ₂	aceite
79	Me	H	CF ₃	H	Et	aceite
80	i-Pr	H	CF ₃	H	Cl	86 a 88°C
81	CH ₂ (i-Pr)	H	CF ₃	H	Cl	aceite
82		H	CF ₃	H	Cl	93 a 95°C
83	n-Bu	H	CF ₃	H	Cl	aceite
84		H	CF ₃	H	Cl	189 a 190°C
85	Ph	H	CF ₃	H	Cl	218 a 220°C
86	CH ₂ CH ₂ (i-Pr)	H	CF ₃	H	Cl	90 a 92°C
87	sec-Bu	H	CF ₃	H	Cl	aceite
88		H	CF ₃	H	Cl	187 a 189°C
89	t-Bu	H	CF ₃	H	Cl	aceite

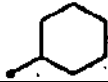
Nº	R ¹	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Propiedades físicas
90		H	CF ₃	H	Cl	sólido
91		H	CF ₃	H	Cl	196 a 198°C
92	2-piridil	H	CF ₃	H	Cl	183 a 186°C
93	4-piridil	H	CF ₃	H	Cl	213°C
94		H	CF ₃	H	Br	139 a 141°C
95	i-Pr	H	CF ₃	H	Br	105 a 108°C
96	Me	CF ₃	Cl	H	H	208 a 211°C
97	Me	CF ₃	Br	H	H	222 hasta 226°C
98		H	CF ₃	H	Cl	174 a 178°C
99		H	CF ₃	H	Cl	aceite
100	CHMeOH	H	CF ₃	H	Cl	178°C
101	CHMeBr	H	CF ₃	H	Cl	118°C
102	CHMeNHMe	H	CF ₃	H	Cl	amorfo
103	CHMeF	H	CF ₃	H	Br	
104	CHMeF	H	CF ₃	H	Cl	aceite
105	Me	Cl	CF ₃	H	F	aceite viscoso
106	Me	NMe ₂	CF ₃	H	Cl	149 a 150°C
107		H	CF ₃	H	Cl	aceite
108		H	CF ₃	H	Cl	111 a 113°C
109	CH ₂ (t-Bu)	H	CF ₃	H	Cl	155 a 158°C
110		H	CF ₃	H	COOEt	aceite
111	CHMeOAc	H	CF ₃	H	Cl	98 a 99°C
112	CHMeCN	H	CF ₃	H	Cl	167°C
113	CHMeSAc	H	CF ₃	H	Cl	115 a 118°C
114	CMe ₂ Br	H	CF ₃	H	Cl	89°C
115	CHMeNHAc	H	CF ₃	H	Cl	185 a 188°C
116	CH=CH ₂	H	CF ₃	H	Cl	
117	CHMeOMe	H	CF ₃	H	Cl	aceite
118	CHMeSMe	H	CF ₃	H	Cl	
119	Me	H	CF(CF ₃) ₂	H	Cl	
120		H	CF ₃	H	I	
121	i-Pr	H	CF ₃	H	I	
122	Me	CF ₃	Cl	H	Cl	sólido
123	CH ₂ F	H	CF ₃	H	Cl	amorfo

TABLA 2

Nº	RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz)
4	7,28(1H, d, J = 4,4Hz), 8,38(1H, d, J= 0,8Hz), 8,56(1H, s), 9,02(1H, m), 9,02(1H, s)
5	7,43(1H, d, J = 4,4Hz), 7,97(1H, dd, J= 8,8, 1,6Hz), 8,56(1H, s), 8,96(1H, m), 9,03(1H, d, J = 4,4Hz)
7	0,95(9H, s), 7,33(1H, d, J = 4,4Hz), 8,16(1H, d, J= 1,6Hz), 8,56(1H, s), 8,94(1H, m), 8,99(1H, d, J= 4,4Hz)
12	7,30(1H, d, J = 4,4Hz), 8,22(1H, s), 8,56(1H, s), 8,99(1H, s), 9,02 (1H, d, J = 4,4Hz)
13	2,49(3H, S), 7,27(1H, d, J = 4,4Hz), 7,79(1H, s), 8,54(1H, s), 8,56 (1H, s), 8,96(1H, d, J = 4,4Hz)
14	7,44(1H, d, J = 4,4Hz), 8,51(1H, s), 8,61(1H, s), 9,07(1H, d, J = 4,4Hz), 9,29 (1H, s)
16	1,47(3H, t, J = 8,0Hz), 3,09(2H, c, J = 8,0Hz), 7,17(1H, s), 8,21(1H, d, J = 1,6Hz), 8,47(1H, s), 8,98(1H, m)
17	1,07(3H, t, J = 7,6Hz), 1,95(2H, m), 3,03(2H, c, J = 7,6Hz), 7,15(1H, s), 8,22(1H, s), 8,47(1H, s), 8,98(1H, m)
18	2,84(3H, s), 8,02(1H, s), 8,22(1H, d, J = 8,4Hz), 8,57 (1H, s), 9,08(1H, s), 9,34 (1H, d, J = 8,4Hz),
20	7,63(1H, s), 8,23(1H, s), 8,68(1H, s), 8,98(1H, s)
43	2,86(3H, s), 7,29(1H, s), 8,50(1H, s), 8,51(1H, s), 9,27(1H, s)
48	3,56(3H, s), 4,79(2H, s), 7,55(1H, s), 8,21(1H, d, J = 2,0Hz), 8,51(1H, s), 8,98 (1H, d, J = 0,8Hz)
52	2,72(3H, s), 7,03(11-1, s), 7,16-7,30(51-1, m), 8,19(11-1, s), 8,25(1H, s), 9,07(1H, s)
53	4,79(2H, s), 7,49(1H, s), 8,16(1H, s), 8,48(1H, s), 8,92(1H, s)
54	6,81(11-1, s), 7,76(1H, s), 8,21(1H, s), 8,56(1H, s), 8,97(1H, s)
57	2,81(31-1, s), 7,02(11-1, s), 8,22(11-1, s), 8,41(1H, s), 8,94(1H, s)
58	2,67(3H, s), 2,83(3H, s), 7,37(1H, s), 8,34(1H, s), 8,40(1H, s), 9,13(1H, s)
60	4,67(2H, s), 7,46(1H, s), 8,20(1H, s), 8,52(1H, s), 8,96(1H, s)
62	6,71(11-1, s), 7,83(11-1, s), 8,22(11-1, s), 8,56(1H, s), 8,99(1H, s)
63	3,98-4,04(2H, m), 4,94(2H, s), 7,46(1H, s), 8,15(1H, s), 8,44(1H, s), 8,91 (1H, s)
65	2,33(6H, s), 3,78(2H, s), 7,59(1H, s), 8,17(1H, s), 8,45(1H, s), 8,94(1H, s)
66	2,37(3H, s), 2,73(2H, t, J=4,8Hz), 3,68(2H, t, J=4,8Hz), 3,94(2H, s), 7,50(1H, s), 8,18(1H, s), 8,45(1H, s), 8,94(1H,s)
67	2,83(3H, s), 7,06(1H, s), 8,42(1H, s), 8,51(11-1, s)
72	1,21(2H, s), 3,58(2H, s), 4,08(3H, s), 7,42(1H, s), 8,17(1H, s), 8,47(1H, s), 8,93(1H, s)
73	5,12(2H, s), 7,48(1H, s), 8,14(1H, s), 8,45(1H, s), 8,89(1H, s)
74	2,38(3H, s), 2,74(2H, t, J=5,2Hz), 3,29(3H, s), 3,51(2H, t, J=5,2Hz), 3,93(2H, s), 7,66(1H, s), 8,17(1H, s), 8,45(1H,s), 8,95(1H, s)
75	2,52(3H, s), 3,66(2H, s), 4,08(2H, s), 7,46(1H, s), 8,19(11-1, s), 8,49(1H, s), 8,96(11-1, s)
76	2,58(4H, m), 3,72(4H, m), 3,86(2H, s), 7,60(1H, s), 8,19(1H, s), 8,46(1H, s), 8,96(1H, s)
77	3,81(2H, d, J=6,8Hz), 4,82(1H, t, J=6,8Hz), 7,30(1H, s), 8,19(1H, s), 8,51(1H, s), 8,92(1H, s)
78	2,85(3H, s), 7,41(1H, s), 8,37(1H, s), 8,84(1H, s), 9,28(1H, s)
79	1,20(3H, t, J = 7,2Hz), 2,57(2H, q, J = 7,2Hz), 2,82(3H, s), 7,10(1H, s), 8,05(1H, s), 8,46(1H, s), 8,89(1H, s)
81	0,97(6H, d, J=6,8Hz), 2,27(1H, m), 2,84(2H, d, J=7,2Hz), 7,01(1H, s), 8,15(1H, s), 8,40(1H, s), 8,91(1H, s)

Nº	RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz)
83	0,94(3H, t, J=7,2Hz), 1,42(2H, m), 1,85(2H, m), 3,00(2H, t, J=7,6Hz), 7,11(1H, s), 8,17(1H, s), 8,42(1H, s), 8,93(1H,s)
87	0,88(3H, t, J=7,6Hz), 1,36(3H, d, J=7,2Hz), 1,69(1H, m), 1,85(1H, m), 3,00(1H, m), 7,07(1H, s), 8,14(1H, s), 8,39(1H,s), 8,90(1H,s)
89	1,42(9H, s), 7,29(1H, s), 8,15(1H, s), 8,39(1H, s), 8,91(1H, s)
90	7,20(1H, dd, J = 4,0Hz, J = 4,4Hz), 7,56(1H, s), 7,64(1H, d, J = 4,4Hz), 7,86(1H, d, J = 4,0Hz), 8,20(1H, s), 8,45(1H,s), 8,98(1H,s)
99	1,94-2,56(6H, m), 3,83(1H, m), 7,08(1H, s), 8,17(1H, s), 8,43(1H, s), 8,93(1H,s)
102	1,53(3H, d, J = 7,2Hz), 4,15(1H, q, J = 7,2H), 4,81(1H, s), 7,74(1H, s), 8,58(1H, s), 8,59(1H, s), 9,07(1H, s)
104	1,86(3H, dd, J = 6,8Hz, J = 24,4Hz), 5,87(1H, dc, J = 6,8Hz, J = 48,4Hz), 7,56(1H, s), 8,23(1H, s), 8,54 (1H,s), 8,99(1H,s)
105	2,83(3H, s), 7,14(1H, s), 8,29(1H, d, J = 0,8Hz), 8,48(1H, s)
107	1,71-2,21(8H, m), 3,40(1H, m), 7,14(1H, s), 8,17(1H, s), 8,43(1H, s), 8,94(1H, s)
110	0,90(3H, t, J=7,2Hz), 1,17(2H, m), 1,37(2H, m), 2,16(1H, m), 4,01(2H, c, J=7,2Hz), 7,19(1H, s), 8,22(1H, s), 8,59(1H,s), 9,07(1H, s)
117	1,60(3H, d, J=7,2Hz), 3,43(3H, s), 4,64(1H, q, J=7,2Hz), 7,53(1H, s), 8,22(1H, s), 8,51(1H, s), 8,99(1H, s)
122	2,82(3H, s), 7,15(1H, s), 8,17(1H, s), 8,44(1H, s)
123	5,71(2H-1, d, J=46,8Hz), 7,53(1H, s), 8,23(1H, s), 8,55(1H, s), 9,00(1H, s)

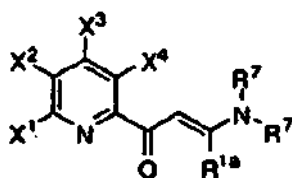


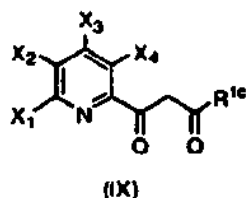
TABLA 3

Nº	R ^{1a}	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ⁷	Propiedades físicas
IV-1	Me	H	CF ₃	H	Cl	Me	83 a 86°C
IV-2	Me	H	H	H	CF ₃	Me	sólido
IV-3	Et	H	CF ₃	H	Cl	Me	74 a 76°C
IV-4	n-Pr	H	CF ₃	H	Cl	Me	127 a 129°C
IV-5	H	H	CF ₃	H	H	Me	57 a 60°C
IV-6	H	H	H	H	CF ₃	Me	aceite
IV-7	H	H	CF ₃	H	Br	Me	102 a 104°C
IV-8	H	H	Cl	H	Cl	Me	aceite
IV-9	Me	H	CF ₃	H	Br	Me	110 a 112°C
IV-10	H	H	H	CF ₃	H	Me	aceite
IV-11	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	sólido
IV-12	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	sólido
IV-13	H	H	NO ₂	H	Cl	Me	aceite
IV-14	H	H	CF ₃	H	NO ₂	Me	aceite
IV-15	H	H	Me	H	Cl	Me	aceite
IV-16	CH ₂ OMe	H	CF ₃	H	Cl	Me	aceite
IV-17	Me	CF ₃	H	H	CF ₃	Me	aceite
IV-18	Me	NMe ₂	CF ₃	H	Cl	Me	aceite

IV-19	Me	Cl	CF ₃	H	CF ₃	Me	113 a 115°C
IV-20	Me	Cl	CF ₃	H	Cl	Me	108 a 110°C
IV-21	Me	OMe	CF ₃	H	Cl	Me	101 a 102°C
IV-22	Me	H	CF ₃	H	I	Me	120 a 123°C
IV-23	Me	Cl	CF ₃	H	F	Me	88 a 92°C

TABLA 4

Nº	RMN de ¹ H δppm (Disolvente: CDCl ₃ /400 MHz)
IV-6	2,92(3H, señal ancha), 3,14(3H-1, señal ancha), 5,56(1H, d ancho), 7,25-7,46 (1H, m), 7,85 (1H, señal ancha), 8,04(1H, dd, J= 7,6, 0,8Hz), 8,75(1H, dd, J = 4,8, 0,8Hz)
IV-8	2,92(3H, señal ancha), 3,14(3H,señal ancha), 5,59(1H, señal ancha), 7,77(1H,d, J=2Hz), 8,45(1H, J=2Hz)
IV-10	3,01(3H-1, s), 3,21(3H-1, s), 6,46(1H-1, d, J= 12,8Hz), 7,57(1H, d, J= 4,8Hz), 7,96(1H, d, J= 12,8Hz), 8,40(1H, s), 8,80(1H,d,J= 4,8Hz)
IV-11	3,04(3H, s), 3,22(3H, s), 6,40(1H, d, J= 12,8H), 7,61(1H, s), 7,96(1H,d, J= 12,8Hz), 8,31(1H, s)
IV-12	2,93(3H, s), 3,18(3H, señal ancha), 5,35(1H, d, J= 12,8Hz), 7,88(1H, señal ancha)
IV-13	2,95(3H, s), 3,20(3H, señal ancha), 5,55(1H, d ancho), 7,93(1H, señal ancha), 8,54(1H, d, J= 2,2Hz), 9,29 (1H,d,J= 2,2Hz)
IV-14	2,94(3H, s), 3,17(3H, señal ancha), 5,56(1H, d ancho), 7,95(1H, señal ancha), 7,99(1H, s), 8,74(1H, s)
IV-15	2,36(3H, s), 2,91(3H, s), 3,16(3H, señal ancha), 5,61(1H, señal ancha), 7,57(1H, d, J= 0,8Hz), 7,90(1H, señal ancha), 8,31(1H, d, J= 2,2Hz)
IV-16	3,00(3H, señal ancha), 3,20(3H, señal ancha), 3,49(3H, s), 5,08(2H, s), 5,46(1H, s), 7,96(1H, d, J= 1,2Hz), 8,72(1H,dd,J= 0,8, 2,0Hz)
IV-17	2,69(3H, s), 3,09(6H, señal ancha), 5,44(1H, s), 7,76(1H, d, J= 7,6Hz), 8,20(1H, d, J= 7,6Hz)
IV-18	2,70(3H, s), 3,02(6H, s), 3,07(6H, s), 5,46(1H, s), 7,78 (1H, s)



5

TABLA 5

Nº	R ^{1c}	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Propiedades físicas
IX-1		H	CF ₃	H	Cl	
IX-2		H	CF ₃	H	Cl	
IX-3		H	CF ₃	H	Cl	47°C
IX-4		H	CF ₃	H	Cl	50°C
IX-5		H	CF ₃	H	Cl	
IX-6		H	CF ₃	H	Cl	
IX-7	Et	H	CF ₃	H	Cl	

Nº	R ^{1c}	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	Propiedades físicas
IX-8	Me	H	CF ₃	H	Cl	51°C
IX-9		H	CF ₃	H	Cl	
IX-10	n-Bu	H	CF ₃	H	Cl	
IX-11	i-Pr	H	CF ₃	H	Cl	
IX-12	i-Bu	H	CF ₃	H	Cl	
IX-13	Ph	H	CF ₃	H	Cl	
IX-14	CH ₂ CH ₂ (i-Pr)	H	CF ₃	H	Cl	
IX-15	sec-Bu	H	CF ₃	H	Cl	
IX-16	t-Bu	H	CF ₃	H	Cl	
IX-17	CH ₂ (t-Bu)	H	CF ₃	H	Cl	
IX-18		H	CF ₃	H	Cl	
IX-19		H	CF ₃	H	Cl	
IX-20		H	CF ₃	H	Cl	
IX-21		H	CF ₃	H	Cl	
IX-22	i-Pr	H	CF ₃	H	Br	
IX-23		H	CF ₃	H	Br	
IX-24		H	CF ₃	H	CO ₂ Et	
IX-25	CF ₃	H	CF ₃	H	Cl	

TABLA 6

Nº	¹ RMN de ¹ H δppm (Disolvente: CDCl ₃ /400 MHz)
IX-7	1,22(3H, t, J = 7,2Hz), 2,48 (2H, c, J = 7,2Hz), 6,28(1H, s), 8,02(1H, s), 8,77(1H, s)
IX-9	0,86-0,89(2H, m), 1,29(3H, s), 1,36-1,41(2H, m), 6,33(1H, s), 8,01(1H, s), 8,78(1H, s)
IX-18	0,94-1,07(2H, m), 1,21-1,25(2H, m), 1,80(1H, m), 6,37(1H, s), 8,01(1H, s), 8,78(1H, s)

Ahora se describirán los Ejemplos de ensayo.

5

Ejemplo de ensayo 1

Ensayo de control de los efectos contra el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*)

- 10 Se introdujo una hoja de rábano japonés en un tubo de ensayo al que se añadió agua y se liberaron en la hoja cerca de 20 ninfas de primer instar de pulgón verde del melocotonero. Al día siguiente se contó el número de ninfas parasitarias sobre la hoja y, a continuación, la hoja se sumergió durante aproximadamente 10 segundos en una solución insecticida preparada para conseguir una concentración del compuesto de la presente invención de 200 ppm, se secó al aire y se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Se contaron las
- 15 ninfas muertas 5 días después del tratamiento y la mortalidad se calculó mediante la siguiente ecuación. Los insectos que abandonaron la hoja o que presentaban síntomas tóxicos se contaron como insectos muertos. El ensayo se llevó a cabo con respecto a los compuestos mencionados anteriormente N° 4, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 41, 43, 44, 48, 51, 53, 68, 73, 78, 79, 80, 82, 94, 95 y 104, donde todos los compuestos mostraron una mortalidad de al menos 90%

20

$$\text{Mortalidad (\%)} = (1 - (\text{número de insectos supervivientes} / \text{número de insectos tratados})) \times 100$$

Ejemplo de ensayo 2

5 Ensayo de control de los efectos contra el saltamontes marrón (Nilaparvata lugens)

Se sumergieron plántulas de arroz durante aproximadamente 10 segundos en una solución insecticida preparada para conseguir una concentración del compuesto de la presente invención de 200 ppm y después se secaron al aire, la raíz se envolvió con un algodón absorbente húmedo y la planta de semillero se puso en un tubo de ensayo. A continuación, se liberaron en el mismo 10 ninfas del segundo-tercer instar de saltamontes marrón y el tubo de ensayo se cubrió con una gasa y se dejó en una cámara a temperatura constante a 25°C con iluminación. En el quinto día después de la liberación, se contaron las ninfas muertas y la mortalidad se calculó mediante la siguiente ecuación.

15 El ensayo se llevó a cabo con respecto a los compuestos mencionados anteriormente N° 4, 12, 15, 16, 17, 19, 20, 41, 43, 44, 48, 52, 57, 68, 70, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 87, 89, 91, 94, 95, 98, 99, 104, 105 y 107, donde todos los compuestos mostraron una mortalidad de al menos el 90%. Mortalidad (%) = (número de insectos muertos/número de insectos liberados)x100.

20 Ejemplo de ensayo 3

Ensayo de control de los efectos contra la mosca blanca (Bemisia argentifolii)

25 Se aplicó una solución insecticida preparada para conseguir una concentración del compuesto de la presente invención de 200 ppm mediante un rociador de mano a la plántula de pepino plantada en una maceta en la cual existían ninfas del primero-segundo instar de mosca blanca parasitarias y se secó al aire. A continuación, la plántula de semillero de pepino se dejó en una cámara de temperatura constante a 25°C con iluminación. Siete días después del tratamiento se contó el número de ninfas instar viejas y se determinó el valor de protección (%) mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo con respecto a los compuestos mencionados anteriormente N° 4, 5, 30 12, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 44, 48, 80, 82 y 94, donde todos los compuestos mostraron un valor de protección de al menos 80%.

$$\text{Valor protectivo (\%)} = (1 - ((T_{ax}C_b) / (T_{bx}C_a))) \times 100$$

35 Ta: El número de ninfas de instar viejas después del tratamiento en la plántula de pepino tratada
Tb: El número de ninfas del primer-segundo instar antes del tratamiento en la plántula de pepino tratada
Ca: El número de ninfas de instar viejas después del tratamiento en la plántula de pepino no tratada
Cb: El número de ninfas del primer-segundo instar antes del tratamiento en la plántula de pepino no tratada

40 Ejemplo de ensayo 4

Ensayo pesticida contra Haemaphysalis longicornis utilizando un perro

45 Se aplicó a un perro (Beagle, 8 meses de edad) una cápsula de gelatina que contiene el compuesto de la presente invención a una dosis de 10 mg/kg de peso, e inmediatamente después de la aplicación, se liberaron aproximadamente 50 ácaros jóvenes Haemaphysalis longicornis en la oreja del perro y parasitado artificialmente. Después del tratamiento, se llevó a cabo la observación para inspeccionar el número de parásitos, la reducción en número y la mortalidad de los Haemaphysalis longicornis caídos. Por consiguiente, el compuesto de la presente invención es eficaz para conseguir la caída o muerte de los Haemaphysalis longicornis parásitos.

50 Ejemplo de ensayo 5

Ensayo pesticida contra la pulga del gato (Ctenocephalides felis) utilizando un perro

55 Se aplicó a un perro (Beagle, 8 meses de edad) una cápsula de gelatina que contiene el compuesto de la presente invención a una dosis de 10 mg/kg de peso, e inmediatamente después de la aplicación, se liberaron 100 adultos no chupadores de sangre de la pulga del gato sobre el pelaje dorsal del perro y parasitado artificialmente. Después del tratamiento, la pulga del gato se recupera mediante un peine para recoger las pulgas y se cuenta el número de parásitos. En consecuencia, el compuesto de la presente invención es eficaz para controlar la parasitación por la pulga del gato.

Ahora, se describen a continuación ejemplos de formulación.

Ejemplo de formulación 1

(1) Compuesto de la presente invención	20 partes en peso
(2) Arcilla	70 partes en peso
(3) Carbono blanco	5 partes en peso
(4) Policarboxilato de sodio	3 partes en peso
(5) Alquilnaftaleno sulfonato de sodio	2 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para obtener un polvo humectable.

5

Ejemplo de formulación 2

(1) Compuesto de la presente invención	5 partes en peso
(2) Talco	60 partes en peso
(3) Carbonato de calcio	34,5 partes en peso
(4) Parafina líquida	0,5 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para obtener un polvo.

10

Ejemplo de formulación 3

(1) Compuesto de la presente invención	20 partes en peso
(2) N,N-dimetilacetamida	20 partes en peso
(3) Polioxietileno triestiril fenil éter	10 partes en peso
(4) Dodecilbenceno sulfonato de calcio	2 partes en peso
(5) Xileno	48 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para obtener un concentrado emulsionable.

15 Ejemplo de formulación 4

(1) Arcilla	68 partes en peso
(2) Lignin sulfonato de sodio	2 partes en peso
(3) Polioxietilén alquilaril sulfato	5 partes en peso
(4) Carbono blanco	25 partes en peso

La mezcla de los componentes anteriores se mezcla con el compuesto de la presente invención en una relación en peso de 4:1 para obtener un polvo humectable.

20

Ejemplo de formulación 5

(1) Compuesto de la presente invención	50 partes en peso
(2) Producto de condensación de alquilnaftaleno sódico de formaldehído	2 partes en peso
(3) Aceite de silicona	0,2 partes en peso
(4) Agua	47,8 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan para obtener un líquido base y

25

(5) Policarboxilato de sodio	5 partes en peso
(6) sulfato de sodio anhidro, y la mezcla se mezcla uniformemente, se granula y se seca para obtener gránulos dispersables en agua	42,8 partes en peso

30 Ejemplo de formulación 6

(1) Compuesto de la presente invención	5 partes en peso
(2) Polioxietilenoctilfenil éter	1 parte en peso
(3) Éster del ácido polioxietilén alquil fosfórico	0,1 partes en peso
(4) Carbonato de calcio granulado	93,9 partes en peso

Los componentes anteriores (1) a (3) se mezclan preliminarmente uniformemente y se diluyen con una cantidad apropiada de acetona y después la mezcla se pulveriza sobre el componente (4) y la acetona se elimina para obtener gránulos.

5 Ejemplo de formulación 7

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

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se disuelven para obtener una formulación de volumen ultra bajo.

10 Ejemplo de formulación 8

(1) Compuesto de la presente invención	40 partes en peso
(2) Polioxietilen estiril éter fosfato de potasio	4 partes en peso
(3) Aceite de silicona	0,2 partes en peso
(4) Goma xantana	0,1 partes en peso
(5) Etilenglicol	5 partes en peso
(6) Agua	50,7 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan para obtener un concentrado en suspensión acuosa.

15 Ejemplo de formulación 9

(1) Compuesto de la presente invención	10 partes en peso
(2) Dietilenglicol monoetil éter	80 partes en peso
(3) Polioxietilenalquil éter	10 partes en peso

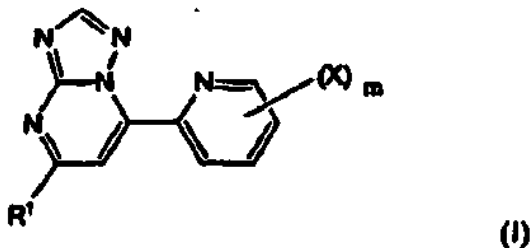
Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para obtener un concentrado soluble.

20 **Aplicabilidad industrial**

25 El insecticida y/o miticida que contiene un derivado novedoso piridil-triazolopirimidina o su sal como un principio activo de la presente invención es excelente en el efecto, la dosificación, etc., en comparación con los productos convencionales, y tiene un efecto de control muy alto con una dosis baja y, por lo tanto, es aplicable al control de plagas y en particular es altamente susceptible de aplicación industrial como un insecticida y/o miticida agrícola y hortícola y como plaguicida contra parásitos en animales

REIVINDICACIONES

1. Un derivado piridil-triazolopirimidina representado por la fórmula (I) o su sal:



en la que

R^1 es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alqueno que puede estar sustituido por A, alquino que puede estar sustituido por A, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 ; R^2 es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo o arilo;

R^3 es alquilo;

R^4 es hidrógeno o alquilo;

R^5 es hidrógeno o alquilo;

A es halógeno, OR^2 , $S(O)_nR^3$, NR^4R^5 , ciano, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico;

X es alquilo, alqueno, alquino, halógeno, haloalquilo, ciano o nitro;

m es un número entero de desde 1 hasta 4 y

n es un número entero de desde 0 hasta 2.

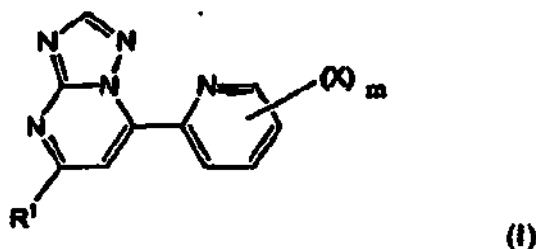
2. El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R^1 es alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alqueno, alquino, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

3. El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal de acuerdo con la reivindicación 2, en el que R^1 es alquilo, haloalquilo, cicloalquilo o alqueno.

4. El derivado piridil-triazolopirimidina o su sal de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R^1 es alquilo, haloalquilo, alquino, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 .

5. Un insecticida o acaricida que contiene el derivado piridil-triazolopirimidina o su sal como se define en la reivindicación 1, como un principio activo.

6. Un procedimiento para la producción de un derivado piridil-triazolopirimidina representado por la fórmula (I) o su sal:



en la que

R^1 es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alqueno que puede estar sustituido por A, alquino que puede estar sustituido por A, halógeno, ciano, arilo, un grupo heterocíclico, OR^2 , $S(O)_nR^3$ o NR^4R^5 ;

R^2 es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo o arilo;

R^3 es alquilo;

R^4 es hidrógeno o alquilo;

R^5 es hidrógeno o alquilo;

A es halógeno, OR^2 , $S(O)_nR^3$, NR^4R^5 , ciano, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico;

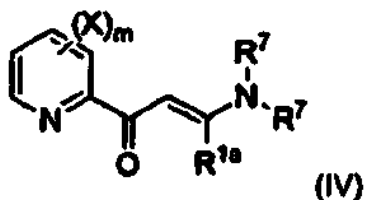
X es alquilo, alqueno, alquino, halógeno, haloalquilo, ciano o nitro;

m es un número entero de desde 1 hasta 4 y

n es un número entero de desde 0 hasta 2,

el cual comprende

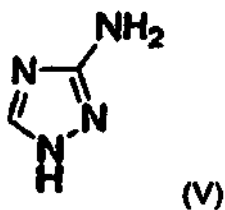
- 5 (1) condensar un derivado cetona α,β -insaturada representada por la fórmula (IV):



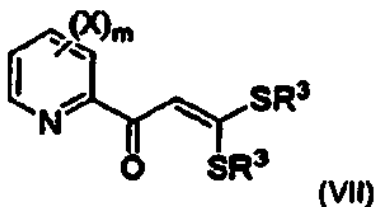
en la que

- 10 X y m son como se ha definido anteriormente,
 R^{1a} es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquenoilo que puede estar sustituido por A, alquinilo que puede estar sustituido por A, arilo o un grupo heterocíclico y R^7 es alquilo

- 15 y un compuesto representado por la fórmula (V):



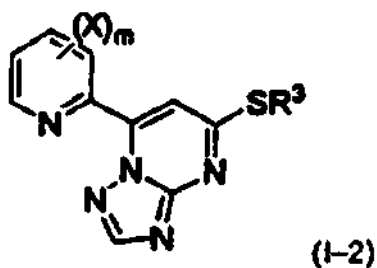
- 20 (2) condensar un derivado cetona α,β -insaturada representada por la fórmula (VII):



en la que R^3 , X y m son como se ha definido anteriormente y el compuesto de la fórmula anterior (V);

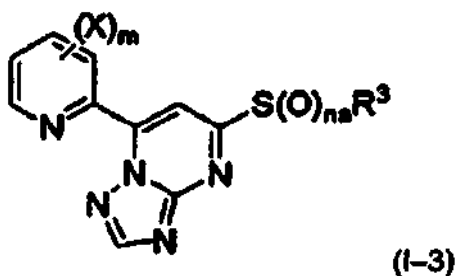
- 25
-

- (3) oxidar un compuesto representado por la fórmula (1-2):



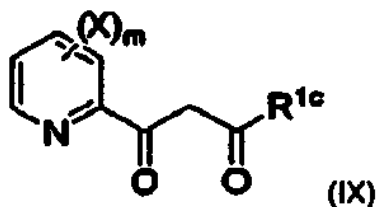
en la que R^3 , X y m son como se ha definido anteriormente,
(4) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (1-3):

5



en la que R^3 , X y m son como se ha definido anteriormente y na es un número entero de desde 1 hasta 2, con un reactivo nucleófilo;

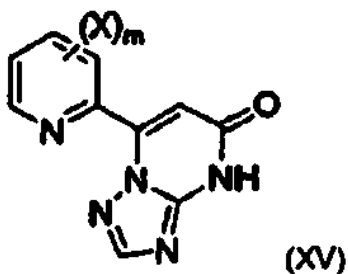
10 (5) condensar un compuesto representado por la fórmula (IX):



en la que X y m son como se ha definido anteriormente y R^{1c} es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alqueno que puede estar sustituido por A, alquino que puede estar sustituido por A, arilo o un grupo heterocíclico y el compuesto de la fórmula anterior (V) o

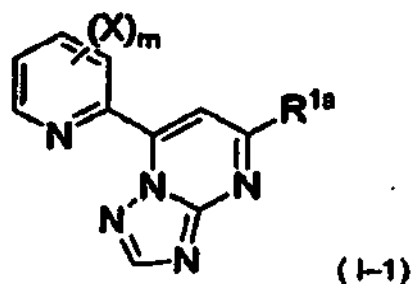
15

(6) halogenar un derivado 4,5-dihidro-5-oxo[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina representado por la fórmula (XV):



20 en la que X y m son como se ha definido anteriormente.

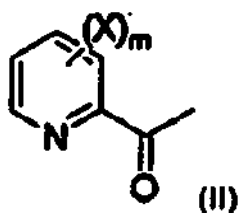
7. Un procedimiento para la producción de un derivado piridil-triazolopirimidina representado por la fórmula (1-1) o su sal:



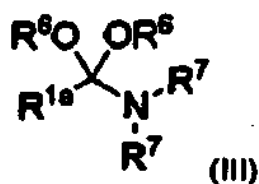
en la que

- 5 R^{1a} es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alquenoilo que puede estar sustituido por A, alquinoilo que puede estar sustituido por A, arilo o un grupo heterocíclico; X es alquilo, alquenoilo, alquinoilo, halógeno, haloalquilo, ciano, o nitro;
 R^2 es hidrógeno, alquilo, alquenoilo, alquinoilo, haloalquilo, o arilo;
 R^3 es alquilo:
 10 R^4 es hidrógeno o alquilo;
 R^5 es hidrógeno o alquilo;
 A es halógeno, OR^2 , $S(O)_nR^3$, NR^4R^5 , ciano, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico;
 m es un número entero de desde 1 hasta 4; y
 n es un número entero de desde 0 hasta 2;

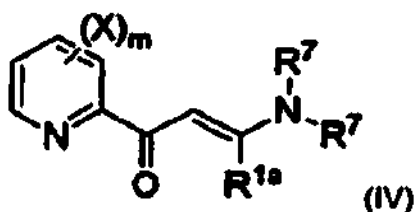
15 el cual comprende condensar un compuesto representado por la fórmula (II):



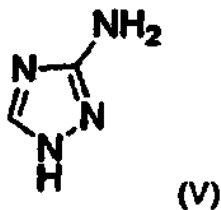
- 20 en la que X y m son como se ha definido anteriormente y un compuesto representado por la fórmula (III):



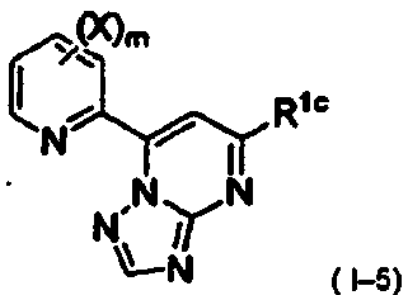
- 25 en la que R^{1a} es como se ha definido anteriormente;
 y cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es alquilo, para obtener un derivado cetona α,β -insaturada representado por la fórmula (IV):



- 30 en la que R^{1a} , R^7 , X y m son como se ha definido anteriormente y condensar el derivado cetona obtenido y un compuesto representado por la fórmula (V):



8. Un procedimiento para la producción de un derivado piridil-triazolopirimidina representado por la fórmula (I-5) o su sal:



en la que

R^{1c} es alquilo que puede estar sustituido por A, cicloalquilo que puede estar sustituido por A, alqueno que puede estar sustituido por A, alquino que puede estar sustituido por A, arilo o un grupo heterocíclico;

X es alquilo, alqueno, alquino, halógeno, haloalquilo, ciano o nitro;

R^2 es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo o arilo;

R^3 es alquilo;

R^4 es hidrógeno o alquilo;

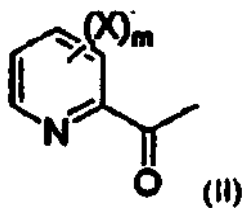
R^5 es hidrógeno o alquilo;

A es halógeno, OR^2 , $S(O)_nR^3$, NR^4R^5 , ciano, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico;

m es un número entero de desde 1 hasta 4 y

n es un número entero de desde 0 hasta 2, el cual comprende

(1) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (II):

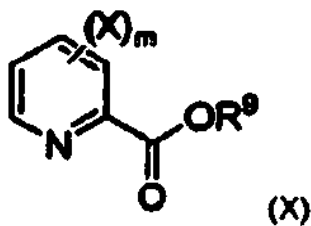


en la que X y m son como se ha definido anteriormente, con un compuesto representado por la fórmula (VIII):

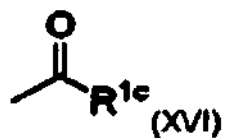


en la que R^{1c} es como se ha definido anteriormente y R^8 es alquilo, o

(2) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (X):

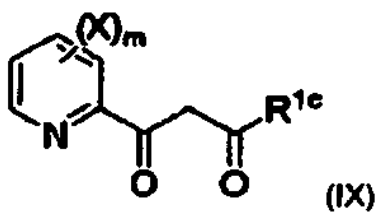


en la que X y m son como se ha definido anteriormente y R⁹ es alquilo, con un compuesto representado por la fórmula (XVI):



5

en la que R^{1c} es como se ha definido anteriormente, para obtener un compuesto representado por la fórmula (IX):



10

en la que R^{1c}, X y m son como se ha definido anteriormente y
(3) condensar el compuesto de la fórmula anterior (IX) y un compuesto representado por la fórmula (V):

