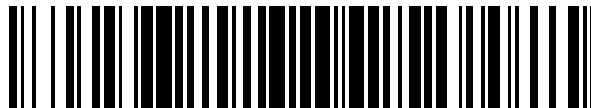


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 490 604**

51 Int. Cl.:

C07C 255/31 (2006.01)

A01N 53/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.03.2008 E 08721974 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.07.2014 EP 2114871**

54 Título: **Un compuesto de éster de ácido ciclopropano carboxílico y su uso en el control de plagas**

30 Prioridad:

07.03.2007 JP 2007056889

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

04.09.2014

73 Titular/es:

**SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
(100.0%)
27-1, SHINKAWA 2-CHOME, CHUO-KU
TOKYO 104-8260, JP**

72 Inventor/es:

**UEKAWA, TORU y
OHSHTA, JUN**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 490 604 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

Un compuesto de éster de ácido ciclopropano carboxílico y su uso en el control de plagas

5 **Campo de la técnica**

La presente invención se refiere a un compuesto éster y uso del mismo.

10 **Técnica anterior**

Las patentes de EE.UU. números 5.135.951 y 5.192.801 divulgan una clase determinada de compuestos de 2,2-dimetil-3-(2-halo-2-cianovinil) ciclopropano carboxilato.

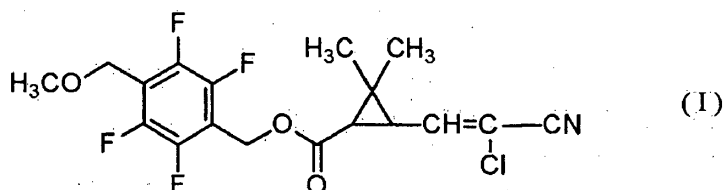
15 **Divulgación de la invención**

Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto que tenga un excelente efecto de control de plagas.

20 Los presentes inventores han estudiado intensamente para descubrir un compuesto de ciclopropano carboxilato que tenga un excelente efecto de control de plagas y, como resultado, han encontrado que un compuesto representado por la fórmula (I) siguiente tiene un excelente efecto de control de plagas. Por tanto, la presente invención se ha realizado.

Es decir, la presente invención proporciona:

25 (1) Un compuesto éster representado por la fórmula (I):

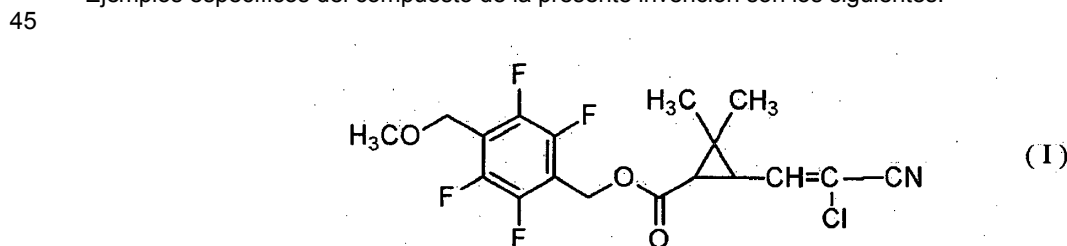


- 30 (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención);
 (2) Una composición de control de plagas que comprende un compuesto éster representado por la fórmula (I);
 (3) Un método de control de plagas que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto éster representado por la fórmula (I) a plagas o hábitat de plagas;
 (4) Uso de un compuesto éster representado por la fórmula (I) para controlar plagas; y
 35 (5) Uso de un compuesto éster representado por la fórmula (I) para fabricar una composición para controlar plagas.

Mejor modo para llevar a cabo la invención

40 El compuesto de la presente invención incluye un isómero derivado de dos átomos de carbono asimétricos existentes en el anillo de ciclopropano y un isómero derivado del doble enlace. La presente invención incluye cada uno de los isómeros y una mezcla de los mismos en cualquier proporción de los mismos.

Ejemplos específicos del compuesto de la presente invención son los siguientes:



50 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración absoluta en la posición 1 del anillo ciclopropano es la configuración R.

El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es la

configuración trans.

5 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es la configuración cis.

El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración relativa entre el doble enlace carbono-carbono existente en el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es la configuración E.

10 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración absoluta en la posición 1 del anillo ciclopropano es la configuración R y la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es la configuración trans.

15 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración absoluta en la posición 1 del anillo ciclopropano es la configuración R y la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es la configuración cis.

20 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración absoluta en la posición 1 del anillo ciclopropano es la configuración R y la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es la configuración trans y la configuración relativa entre el doble enlace carbono-carbono existente en el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es la configuración E.

25 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración absoluta en la posición 1 del anillo ciclopropano es la configuración R y la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano es rica la configuración trans;

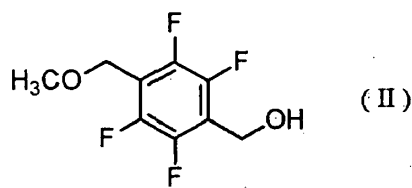
30 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración absoluta en la posición 1 del anillo ciclopropano es la configuración R y el 80% o más de la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano e la configuración trans; y

35 El compuesto éster de la fórmula (I) mencionada anteriormente, en el que la configuración absoluta en la posición 1 del anillo ciclopropano es la configuración R y el 90% o más de la configuración relativa entre el sustituyente en la posición 1 del anillo ciclopropano y el sustituyente en la posición 3 del anillo ciclopropano esta con la configuración trans.

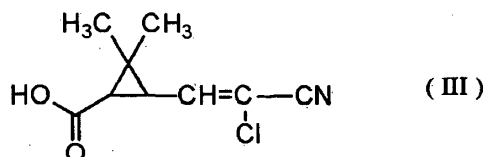
El compuesto de la presente invención se puede producir mediante, por ejemplo, el siguiente método de producción 1.

40 Método de producción 1

Un método que comprende hacer reaccionar un compuesto alcohol representado por la fórmula (II):



45 con un ácido carboxílico representado por la fórmula (III):



50 o un derivado reactivo del mismo (p. ej., haluro ácido y anhídrido ácido, etc.).

La reacción normalmente se realiza en un disolvente en presencia de un agente de condensación o a base.

55 Ejemplos del agente de condensación incluyen dicitclohexilcarbodiimida y 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida clorhidrato.

Ejemplos de la base incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N,N-dietilanilina, 4-dimetilaminopiridina y diisopropiletilamina.

5 Ejemplos del disolvente incluyen hidrocarburos tales como benceno, tolueno y hexano, éteres tales como éter dietílico y tetrahidrofurano, e hidrocarburos halogenados tales como diclorometano y 1,2-dicloroetano y clorobenceno. También se puede usar una mezcla de estos disolventes.

El tiempo de reacción está generalmente en el intervalo de 5 minutos a 72 horas.

10 La temperatura de reacción está generalmente en el intervalo de -20 a 100 °C (no obstante, en el caso en el que el punto de ebullición de un disolvente que se va a usar es inferior a 100°C, -20°C hasta el punto de ebullición del disolvente), preferentemente en el intervalo de -5 a 100 °C (no obstante, en el caso en el que el punto de ebullición de un disolvente que se va a usar es inferior a 100°C, -5°C al punto de ebullición del disolvente).

15 En la reacción, la proporción molar del compuesto alcohol representado por la fórmula (II) y el compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (III) o un derivado reactivo del mismo que se va a usar se puede seleccionar adecuadamente. Preferentemente se puede seleccionar una proporción equimolar o una cercana a la misma. Específicamente, preferentemente se usan de 0,5 a 3 mol del compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (III) o un derivado reactivo del mismo respecto a 1 mol del compuesto alcohol representado por la fórmula (II).

20 (II).

El agente de condensación o la base se pueden usar normalmente a una proporción adecuada seleccionada de 1 mol a una cantidad en exceso, preferentemente de 1 a 5 moles, respecto a 1 mol del compuesto alcohol representado por la fórmula (II). El agente de condensación o la base se seleccionan adecuadamente en función de un tipo concreto del compuesto de ácido carboxílico representado por la fórmula (III) o un derivado reactivo del mismo (p. ej., los correspondientes cloruro ácido, compuestos bromuro ácido y anhídridos ácidos, etc.).

25

Una vez completada la reacción, el compuesto de la presente invención se puede aislar de una mezcla de reacción mediante postratamiento convencional, por ejemplo vertiendo agua, extrayendo con un disolvente orgánico y concentración. El compuesto de la presente invención aislado de este modo se puede purificar mediante, por ejemplo, cromatografía, destilación y similares.

30

El compuesto de alcohol representado por la fórmula (II) se describe en, por ejemplo, la patente de EE.UU. Nº 4.405.640 y se puede producir mediante el método descrito en la misma.

35

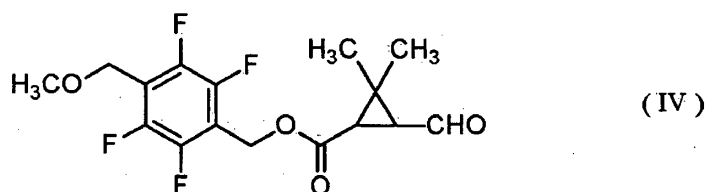
El compuesto de ácido carboxílico representado por la fórmula (III) se describe en, por ejemplo, la patente de EE.UU. Nº 4.565.822 y se puede producir mediante el método descrito en la misma.

El compuesto de la presente invención también se puede producir mediante el siguiente método de producción 2.

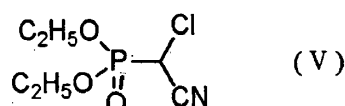
40

Método de producción 2

Un método que comprende hacer reaccionar un compuesto aldehído representado por la fórmula (IV):



45 con un compuesto fosfonato representado por la fórmula (V):



50 La reacción normalmente se realiza en un disolvente en presencia de una base.

Ejemplos de la base incluyen alcóxidos de metales alcalinos, tales como metóxido sódico y terc-butóxido potásico, hidruros de metales alcalinos, tales como hidruro sódico e hidruro potásico, y amidas de metales alcalinos, tales como bistrimetilsililamida sódica, bistrimetilsililamida de litio y diisopropilamida de litio.

55

Ejemplos del disolvente incluyen hidrocarburos tales como benceno, tolueno y hexano, y éteres tales como éter dietílico y tetrahidrofurano. También se puede usar una mezcla de estos disolventes.

El tiempo de reacción está generalmente en el intervalo de 5 minutos a 72 horas.

La temperatura de reacción generalmente está en el intervalo de -80 a 100°C (no obstante, en el caso en el que el punto de ebullición de un disolvente que se va a usar es inferior a 100°C al punto de ebullición del disolvente).

En la reacción, una proporción molar del compuesto aldehído representado por la fórmula (IV) y el compuesto fosfonato representado por la fórmula (V) que se va a usar se puede seleccionar adecuadamente. Preferentemente se puede seleccionar una proporción equimolar o una cercana a la misma. Específicamente, preferentemente se usan de 0,5 a 3 moles del compuesto fosfonato representado por la fórmula (V) respecto a 1 mol del compuesto aldehído representado por la fórmula (IV).

La base se pueden usar normalmente a una proporción adecuada seleccionada de 1 mol a una cantidad en exceso, preferentemente de 1 a 5 moles, respecto a 1 mol del compuesto fosfonato representado por la fórmula (V).

Una vez completada la reacción, el compuesto de la presente invención se puede aislar de una mezcla de reacción mediante postratamiento convencional, por ejemplo vertiendo agua, extrayendo con un disolvente orgánico y concentración. El compuesto de la presente invención aislado de este modo se puede purificar mediante, por ejemplo, cromatografía, destilación y similares.

El compuesto aldehído representado por la fórmula (IV) se describe en, por ejemplo, el documento JP 2002-212138 A y se puede producir mediante el método descrito en el mismo.

El compuesto representado por la fórmula (V) se describe en J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 19, 3311 (2000) y se puede producir mediante el método descrito en el mismo.

Ejemplos de plagas sobre las cuales el compuesto de la presente invención tiene efecto incluyen artrópodos, tales como insectos y garrapatas, y ejemplos específicos de los mismos son los siguientes.

Lepidópteros:

Pyralidae tales como *Chilo suppressalis* (barrena del tallo del arroz), *Cnaphalocrocis medinalis* (enrollahojas del arroz), *Plodia interpunctella* (polilla de la harina India); Noctuidae tales como *Spodoptera litura* (agrotis del tabaco), *Pseudaletia separata* (esciara del arroz), *Mamestra brassicae* (esciara de la col) y similares; Pieridae tales como *Pieris rapae*. (gusano de la col común) y similares, Tortricidae tales como *Adoxophyes orana* y similares; Carposinidae; Lyonetiidae; Lymantriidae; Plusiinae; Agrotis spp.; tales como *Agrotis segetum* (agrotis del nabo), *Agrotis ipsilon* (agrotis negra) y similares; *Helicoverpa* spp.; *Heliotis* spp.; *Plutella xylostella* (polilla dorso de diamante); *Parnara guttata* (brincador del arroz); *Tinea translucens* (polilla portaestuche de los roperos); *Tineola bisselliella* (polilla común de las pieles); y similares;

Dípteros:

Calicidae tales como *Culex pipiens pallens* (mosquito común), *Culex tritaeniorhynchus* y similares; Aedes spp. tal como *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus* y similares; Anopheles tales como *Anopheles sinensis* y similares; Chironomidae (moscas de agua); Muscidae tales como *Musca domestica* (mosca), *Muscina stabulans* (falsa mosca de establo) Fanniidae y similares; Calliphoridae, Sarcophagidae; Antomyiidae tales como *Delia platura* (cresa del maíz), *Delia antiqua* (cresa de la cebolla) y similares; Tephritidae (moscas de la fruta); Drosophilidae (moscas pequeñas); Psychodidae (moscas polilla); Phoridae; Tabanidae; Simuliidae (moscas negras); Stomoxidae (moscas del establo); Ceratopogonidae; y similares;

Blatodeos:

Blatella germanica (cucaracha Germánica); *Periplaneta fuliginosa* (cucaracha parda ahumada); *Periplaneta americana* (cucaracha americana); *Periplaneta brunnea* (cucaracha parda); *Blatta orientalis* (cucaracha oriental) y similares;

Himenópteros:

Formicidae (hormigas); Vespidae (avispas); Bethyidae; Tenthredinidae tales como *Athalis rosae ruficornis* y similares;

Afanípteros:

Ctenocephalides canis, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans* y similares;

Anopluros:

Pediculus humanus, *Phthirus pubis*, *Pediculus humanus humanus*, *Pediculus humanus corporis* y similares;

5 Isópteros:

Reticulitermes speratus, *Coptotermes formosanus*, y similares;

Hemípteros:

10 Delphacidae (saltadores de plantas) tales como *Laodelphax striatellus* (saltador de plantas pardo pequeño), *Nilaparvata lugens* (saltador de plantas pardo), *Sogatella furcifera* (saltador de plantas del arroz de dorso blanco) y similares; Deltocephalidae (saltadores de hojas) tales como *Nephotettix cincticeps* (saltador de hojas del arroz verde), *Nephotettix virescens* (saltador de hojas del arroz verde) y similares; Aphididae (áfidos); Pentatomidae (chinches de plantas); Aleyrodidae (moscas blancas); Coccidae (pulgonos); Tingidae (chinches de encaje); Psyllidae (sílidos) y similares;

Coleópteros:

20 *Attagenus japonicus*; *Anthrenus verbasci*; Diabrotica spp. (gusanos de la raíz del maíz) tales como *Diabrotica virgifera* (gusano de la raíz del maíz del oeste), *Diabrotica undecimpunctata howardi* (gusano de la raíz del maíz del sur) y similares; Scarabeidae tales como *Anomala cuprea* (la euforia cuprosa), *Anomala rufocuprea* (escarabajo de la soja) y similares; Curculionidae tales como *Sitophilus zeamais* (gorgojo del maíz), *Lissorhoptrus oryophilus* (gorgojo del agua del arroz), *Anthonomus grandis grandis* (gorgojo bola), *Callosobruchus chinensis* (gorgojo de la judía adzuki) y similares; Tenebrionidae (gorgojos cegatos) tales como *Tenebrio molitor* (gusano de la harina amarillo), *Tribolium castaneum* (escarabajo de la harina rojo); Chrysomelidae (escarabajos de las hojas) tales como *Oulema oryzae* (escarabajo de la hoja del arroz), *Phyllotreta striolata* (escarabajo de las pulgas estriado), *Aulacophora femoralis* (escarabajo de las pulgas de las cucurbitáceas) y similares; Anobiidae (escarabajos de droguería); Epilachna spp. tales como *Epilachna vigintioctopunctata* (mariquita de veintiocho puntos); Lyctidae (escarabajos del polvo de la madera); Bostrychidae (falsos escarabajos de la madera); Cerambycidae; *Paederus fuscipes* (escarabajo de túnica) y similares;

Tisanópteros:

35 *Thrips palmi*, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips hawaiiensis* (trips de las flores del oeste) y similares;

Ortópteros:

Grylotalpidae, Acrididae (saltamontes), y similares;

40

Acarina:

45 Epidermoptidae tales como *Dermatophagoides farinae*, *Dermatophagoides pteronyssnus* y similares; Acaridae tales como *Tyrophagus putrescentiae* (ácaro del moho), *Aleuroglyphus ovatus* (ácaro del grano de pata marrón) y similares; Glycyphagidae tales como *Glycyphagus privatus*, *Glycyphagus domesticus*, *Glycyphagus destructor* (ácaro de almacenamiento) y similares; Cheyletidae tales como *Cheyletus malaccensis*, *Cheyletus fortis* y similares; Tarsonemidae; Chortoglyphidae; Haplochthoniidae; Tetranychidae tales como *Tetranychus urticae* (ácaro araña manchado), *Tetranychus kanzawai* (ácaro araña Kanzawa), *Panonychus citri* (ácaro araña de los cítricos), *Panonychus ulmi* (ácaro rojo Europeo) y similares; y Ixodidae tales como *Haemaphysalis longicornis* y similares.

50

El compuesto de la presente invención se puede usar como agente para el control de plagas, pero normalmente el compuesto de la presente invención se formula como un ingrediente eficaz en una composición para el control de plagas.

55 Ejemplos de la composición para el control de plagas incluyen una formulación a base de aceite, una emulsión, un polvo humectable, una formulación fluida (tal como una suspensión acuosa y emulsión acuosa), un polvo espolvoreable, gránulos, una formulación inhaladora en aerosol, una formulación volátil mediante calentamiento (tal como una bobina insecticida, un lecho insecticida para calentador eléctrico y una formulación volátil con mecha de absorción para calentar) un fumigador térmico (tal como un fumigador de tipo de autocombustión, un fumigador de tipo de reacción química y un fumigador de placa de cerámica porosa), una formulación volátil sin calentamiento (tal como una formulación volátil de resina y una formulación volátil de papel impregnado), una formulación de humo (tal como niebla), una formulación ULV y cebos venenosos.

60

Ejemplos de un método de formulación de la composición para el control de plagas incluyen los métodos siguientes.

65

(1) Un método para mezclar el compuesto de la presente invención con un vehículo sólido, un vehículo líquido, un vehículo o cebo gaseoso y, en caso necesario, añadir un tensioactivo y otros auxiliares de la formulación.

(2) Un método para impregnar el compuesto de la presente invención en un material base que no contiene un ingrediente eficaz.

5 (3) Un método para mezclar el compuesto de la presente invención en un material base y, opcionalmente, añadir un tensioactivo y otros auxiliares para la preparación, y después moldear.

Normalmente, la composición para el control de plagas puede contener el compuesto de la presente invención en una cantidad que varía de 0,001 a 95% en peso en función de su forma concreta.

10 Entre los ejemplos del vehículo sólido para formular la composición para el control de plagas se incluyen vehículos sólidos (tales como arcillas (tales como arcilla de caolín, tierra de diatomeas, óxido de silicio hidratado sintético, bentonita, arcilla Fubasami y arcilla ácida), talco, cerámicas, otros minerales inorgánicos (tales como sericita, cuarzo, azufre, carbón activo, carbonato de calcio, sílice hidratada y montmorillonita) y fertilizantes químicos (tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio), vehículos líquidos (tales como agua, alcoholes (tales como metanol y etanol), cetonas (tales como, acetona y metiletilcetona), hidrocarburos aromáticos (tales como benceno, tolueno, xileno, etilbenceno, metilnaftaleno y fenilxililetano), hidrocarburos alifáticos (tales como hexano, ciclohexano, queroseno y aceite ligero), ésteres (tales como acetato de etilo y acetato de butilo), nitrilos (tales como acetonitrilo e isobutironitrilo), éteres (tales como éter diisopropílico y dioxano), amidas ácidas (tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida), hidrocarburos halogenados (tales como diclorometano, tricloroetano y tetracloruro de carbono), dimetilsulfóxido y aceites vegetales (tales como aceite de soja, aceite de semilla de algodón) y vehículos gaseosos (tales como gas fleón, gas butano, LPG (gas de petróleo licuado), éter dimetílico y dióxido de carbono).

25 Entre los ejemplos del tensioactivo se incluyen las sales alquilsulfato, las sales alquilsulfonato, las sales de sulfonato de alquilarilo, productos polioxitilados de éteres de alquilarilo, éteres de polietilenglicol, ésteres de alcoholes polihídricos y derivados alcohólicos de azúcares.

30 Entre los ejemplos de otros auxiliares de la formulación incluyen un agente de fijación, un dispersante y un estabilizante tales como caseína, gelatina, polisacáridos (tales como almidón, goma arábiga, derivados de celulosa y ácido algínico), derivados de lignina, bentonita, macromoléculas hidrosolubles sintéticas (tales como alcohol polivinílico y polivinilpirrolidona), ácidos poliacrílicos), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol) y BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol).

35 Entre los ejemplos de los materiales base para una bobina insecticida se incluyen una mezcla de polvos vegetales tales como polvo de madera y Pyrethrum marc, y aglutinantes tales como polvo de Tabu (polvo de *Machilus thunbergii*), almidón y gluten.

40 Entre los ejemplos de los materiales base para un lecho insecticida para calentamiento eléctrico incluyen una placa obtenida endureciendo hebras de algodón, y una placa obtenida endureciendo fibrillas de una mezcla de hebras de algodón y pulpa.

45 Entre los ejemplos de los materiales base para un fumigador de tipo autocombustión se incluyen agentes exotérmicos llameantes tales como nitrato, nitrito, sal de guanidina, clorato potásico, nitrocelulosa, etilcelulosa y harina de madera, estimulantes pirolíticos tales como sales de metales alcalinos, sales de metales alcalino térreos, dicromatos y cromatos, vehículos de oxígeno tales como nitrato potásico, mejoradores de la combustión tales como melamina y almidón de trigo, expansores tales como tierras diatomeas y aglutinantes tales como estabilizantes sintéticos.

50 Ejemplos del material de base para un fumigador de tipo de reacción química incluyen agentes exotérmicos tales como sulfuro, polisulfuro e hidrosulfuro de metales alcalinos y óxido de calcio, catalizadores tales como material carbonáceo, carburo de hierro y arcilla activada, agentes de formación de orgánicos tales como azodicarbonamida, bencenosulfonil hidrazina, dinitropentametilentetramina, poliestireno y poliuretano, y cargas tales como piezas de fibra natural y piezas de fibra sintética.

55 Ejemplos del material de base para una preparación volátil no calentadora incluyen resinas termoplásticas y papeles, tales como papel de filtro y papel japonés.

60 Ejemplos del material de base para cebos envenenados se incluyen ingredientes de cebos, tales como harina de cereal, aceite vegetal, azúcar, celulosa cristalina, antioxidantes tales como dibutilhidroxitolueno y ácido nordihidroguaiarético, un conservante tal como ácido deshidroacético, agentes para prevenir la ingestión errónea por niños y mascotas, tales como polvo de pimienta roja, y perfumes atrayentes, tales como aroma de queso, aroma de cebolla, aroma de cacahuete.

65 El método para el control de plagas de la presente invención generalmente se realiza aplicando la composición para el control de plagas de la presente invención a plagas o a un hábitat de plagas.

Ejemplos del método de aplicación de la composición para el control de plagas de la presente invención incluyen los métodos siguientes, que se pueden seleccionar adecuadamente de acuerdo con una forma concreta, un lugar de aplicación concreto de la composición para el control de plagas de la presente invención etc.

- 5 (1) Un método de aplicar directamente la composición para el control de plagas de la presente invención a plagas o a un hábitat de plagas.
 (2) Un método de aplicar la composición para el control de plagas de la presente invención diluida con un disolvente tal como agua a plagas o a un hábitat de plagas mediante rociado.
 En este caso, normalmente, la composición para el control de plagas de la presente invención se formula en
 10 forma de una emulsión, un polvo espolvoreable, un pesticida de tipo fluido y microcápsulas y la composición se diluye de forma que la concentración del compuesto de la presente invención llega a 0,1 a 10.000 ppm.
 (3) Un método de calentar la composición para el control de plagas de la presente invención en un hábitat de plagas para volatilizar el ingrediente eficaz de la misma.
- 15 En este caso, la cantidad y la concentración del compuesto de la presente invención que se va a aplicar se puede determinar adecuadamente de acuerdo con una forma concreta de la composición, periodo de aplicación, lugar de aplicación, método de aplicación de la composición para el control de plagas de la presente invención, así como del tipo concreto y la situación de daño de las plagas.
- 20 La composición para el control de plagas de la presente invención también se puede usar mediante mezcla o junto con uno o más insecticidas, nematocidas, composiciones para el control de plagas de insectos, bactericidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, repelentes, sinergistas, fertilizantes y acondicionadores del suelo.
- 25 Ejemplos del ingrediente eficaz de dicho insecticida y un acaricida incluyen compuestos organofosforados tales como fenitrotión, diazinón, clorpirifos, acefato, metidatión, disulfotón, DDVP, sulprofos, cianofos, dioxabenzofos, dimetoato, fentoato, malatión, triclorfón, azinfosmetilol, monocrotofos y etion, compuestos de carbamato tales como BPMC, benfuracarb, propoxur, carbosulfan, carbarilo, metomilo, etiofencarb, aldicarb, oxamilo y fenotiocarb, compuestos piretroides tales como etoenprox, fenvalerato, etfenvalerato,
 30 fenpropatrina, cipermetrina, permetrina, cihalotrina, deltametrina, cicoprotrina, fluvalinato, bifentrina, 2-metil-2-(4-bromodifluorometoxifenil)propil(3-fenoxibencil)éter, tralometrina, silafluofen, d-fenotrina, cifenotrina, d-resmetrina, acrinatrina, ciflutrina, teflutrina, transflutrina, tetrametrina, aletrina, d-furametrina, praletrina, empentrina y 2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato de 5-(2-propinil)furfurilo y derivado de nitroimidazolidina, derivado de N-cianoamidina tal como acetamiprid, compuestos de hidrocarburos clorados tales como endosulfan, γ -BHC y 1,1-bis(clorofenil)-2,2,2-tricloroetanol, derivados de benzoilfenilurea tales como clorfluazuron, teflubenzuron y flufenoxuron, compuestos de fenilpirazol, metoxadiazona, bromopropilato, tetradifon, cianometionato, piridaben, fenpiroximato, diafentiuon, tebufenpirad, complejo de polinactina [tetranactin, dinactina y trinactina], pirimidifen, milbemectina, abamectina, ivermectina y azadiractina.
- 35 Ejemplos de los repelentes incluyen 3,4-caranediol, N,N-dietil-m-toluamida, 1-metilpropil 2-(2-hidroxietyl)-1-piperidinocarboxilato, p-mentan-3,8-diol y aceites esenciales vegetales tales como aceite de *Hyssopus officinalis*.

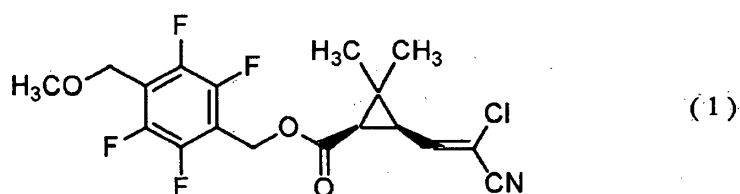
Entre los ejemplos de los compuestos sinérgicos se incluyen bis(2,3,3,3-tetracloropropil) éter (S-421), N-(2-etilhexil)biciclo[2,2,1]hept-5-eno-2,3-dicarboxamida (MGK-264) y α -[2-(2-butoxi)etoxi]-4,5 - metilenedioxi-2-propiltolueno (piperonilbutóxido)

La presente invención se ilustrará adicionalmente con detalle mediante los siguientes ejemplos de producción, ejemplos de formulación y ejemplos de ensayo, pero la presente invención no se limita a los mismos.

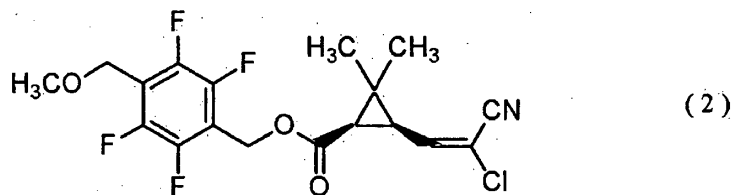
50 En primer lugar se ilustrará la producción del compuesto de la presente invención.

Ejemplo de producción 1

55 A una mezcla de 0,35 g de (1R,3S)-2,2-dimetil-3-formilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetilbencilo, 0,21 g de dietil(clorocianometil)fosfonato y 5 ml de tetrahidrofurano anhidro se añadió gota a gota una solución de 0,14 g de terc-butóxido potásico en 1 ml de tetrahidrofurano con enfriamiento con hielo en una atmósfera de nitrógeno. Después de agitar con enfriamiento con hielo durante 15 minutos, la mezcla de reacción se vertió en una solución salina saturada y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato magnésico anhidro y después se filtró, y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,13 g de 1R,3S)-3-((Z)-2-cloro-2-cianovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetilbencilo representado por la fórmula (1):



5 (en lo sucesivo en el presente documento denominado compuesto (1) de la presente invención y 0,05 g de (1R,3S)-3-((E)-2-cloro-2-cianovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetibencilo representado por la fórmula (2):



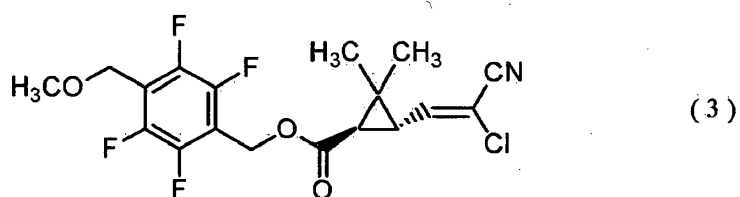
10 (en lo sucesivo denominado el compuesto (2) de la presente invención).

El compuesto (1) de la presente invención RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,04 (1H, d), 5,24 (2H, dd), 4,59 (2H, t), 3,41 (3H, s), 2,21 (1H, dd), 2,05 (1H, d), 1,32 (3H, s), 1,30 (3H, s)

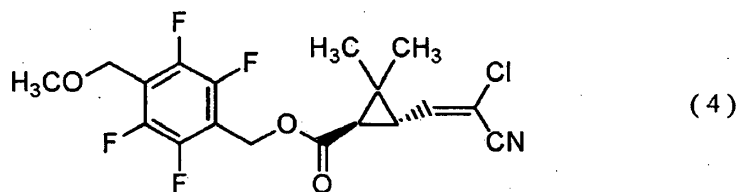
15 El compuesto de la presente invención (2) RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 7,09 (1H, d), 5,24 (2H, dd), 4,59 (2H, t), 3,41 (3H, s), 2,25 (1H, dd), 2,07 (1H, d), 1,31 (3H, s), 1,30 (3H, s)

Ejemplo de producción 2

20 A una mezcla de 0,70 g de (1R,3S)-2,2-dimetil-3-formilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetibencilo, 0,42 g de dietil(clorocianometil)fosfonato y 5 ml de tetrahidrofurano anhidro se añadió una solución de 0,27 g de terc-butóxido potásico en 2 ml de tetrahidrofurano anhidro con enfriamiento con hielo en una atmósfera de nitrógeno. Después de agitar con enfriamiento con hielo durante 15 minutos, la mezcla de reacción se vertió en una solución salina saturada y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato magnésico anhidro y después se filtró, y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice para obtener 0,03 g de 1R,3S)-3-((Z)-2-cloro-2-cianovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetibencilo representado por la fórmula (3):



30 (en lo sucesivo en el presente documento denominado compuesto (3) de la presente invención y 0,02 g de (1R,3S)-3-((E)-2-cloro-2-cianovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetibencilo representado por la fórmula (4):



35 (en lo sucesivo denominado el compuesto (4) de la presente invención).

El compuesto (3) de la presente invención RMN de ^1H (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 6,30 (1H, d), 5,27 (2H, s), 4,59 (2H, s), 3,41 (3H, s), 2,50 (1H, dd), 1,88 (1H, d), 1,34 (3H, s), 1,25 (3H, s)

40

El compuesto (4) de la presente invención RMN de ¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 6,23 (1H, d), 5,26 (2H, s), 4,59 (2H, s), 3,41 (3H, s), 2,45 (1H, dd), 1,85 (1H, d), 1,34 (3H, s), 1,25 (3H, s)

5 A continuación se ilustrará la formulación de la composición del control de plagas. Todas las "partes" se expresan en peso.

Ejemplo de formulación 1

10 En 65 partes de xileno se disuelven 20 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención y se añaden 15 partes de SORPOL 3005X (una marca registrada de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) y se mezclan completamente con agitación para obtener una emulsión.

Ejemplo de formulación 2

15 A 40 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención y se añaden 5 partes de SORPOL 3005X y la mezcla de mezcla completamente y se añaden 32 partes de tierras diatomeas de malla 300, seguido de mezclado con agitación con un mezclador para obtener un polvo humectable. Ejemplo de formulación 3

20 Una mezcla de 1,5 partes de de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención se pulverizan 1 parte de TOKUSIL GUN (óxido de silicio hidratado sintético, fabricado por Tokuyama Corporation), 2 partes de REAX 85A (sulfonato de lignina sódica, fabricada por West Vaco Chemicals), 30 partes de bentonita FUJI (bentonita, fabricada por Houjun) y 65,5 partes de arcilla SHOUKOUZAN A (arcilla caolín, fabricada por Shoukouzan Kougyousho) y se añade agua. La mezcla de amasa completamente, se granula mediante un granulador de extrusión y después se

25 seca para obtener 1,5% de gránulos.

Ejemplo de formulación 4

30 A una mezcla de 10 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención, 10 partes de fenilxilietano y 0,5 partes de SUMIDUR L-75 (diisocianato de tolueno, fabricado por Sumika Bayer Urethane Co., Ltd.) se añaden 20 partes de una solución acuosa al 10% de goma arábica y la mezcla se agita con un homomezclador para obtener una emulsión co un diámetro medio de partícula de 20 μm. A la emulsión, se añaden 2 partes de etilenglicol y la mezcla se agita adicionalmente en un baño caliente a una temperatura de 60°C durante 24 horas para obtener una pasta en microcápsulas. Por otro lado, 0,2 partes de goma xantana y 1,0 partes de

35 VEEGUMR (silicato de aluminio magnesio, fabricado por Sanyo Chemical Industries, Ltd.) se dispersan en 56,3 partes de agua intercambiada con iones para obtener una solución espesante. Después, 42,5 partes de la pasta en microcápsulas mencionada anteriormente y 57,5 partes de la solución espesante mencionada anteriormente se mezclan para obtener una formulación en microcápsulas.

Ejemplo de formulación 5

40 Una mezcla de 10 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención y 10 partes de fenilxilietano se añade a 20 partes de una solución acuosa al 10% de polietilenglicol y la mezcla se agita con un homomezclador para obtener una emulsión co un diámetro medio de partícula de 3 μm. Por otro lado, 0,2 partes de goma xantana y 1,0 partes de VEEGUMR (silicato de aluminio magnesio, fabricado por Sanyo Chemical Industries, Ltd.) se dispersan en 58,8 partes de agua intercambiada con iones para obtener una solución espesante. Después,

45 40 partes de la solución en emulsión mencionada anteriormente y 60 partes de la solución espesante mencionada anteriormente se mezclan para obtener un pesticida de tipo fluido.

Ejemplo de formulación 6

50 A 5 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención, 3 partes de CARPLEX #80 (óxido de silicio hidratado sintético, una marca registrada de SHIONOGI & CO., LTD.), se añaden 0,3 partes de PAP (una mezcla de monoisopropilfosfato y diisopropilfosfato) y 91,7 partes de talco (malla 300) y la mezcla se agita con un mezclador para obtener un polvo espolvoreable.

55 Ejemplo de formulación 7

60 Una solución de 0,1 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención en 10 partes de diclorometano se mezcla con 89,9 partes de querosina desodorizada para obtener una formulación basada en aceite.

Ejemplo de formulación 8

65 Una solución de 1 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención, 5 partes de diclorometano y 34 partes de querosina desodorizada se carga en un envase aerosol y se instala una porción de válvula. Después se cargan 60 partes de propelente en polvo (gas petróleo licuado) a presión a través de la porción

valvular para obtener una formulación en aerosol basada en aceite.

Ejemplo de formulación 9

5 Una solución de 0,6 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención, 5 partes de xileno, 3,4 partes de querosina desodorizada y 1 parte de ATOMOS 300 (emulsionante, una marca registrada de Atlas Chemical) se carga en un envase aerosol y se instala una porción de válvula. Después se cargan 50 partes de agua y 40 partes del propelente en polvo (gas petróleo licuado) a presión a través de la porción valvular para obtener una formulación en aerosol acuosa.

10 Ejemplo de formulación 10

15 Una solución de 0,3 g de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención en 20 ml de acetona se mezcla uniformemente con agitación con 99,7 g de un material base para una bobina (obtenida mezclando polvo Tabu, Pyrethrum marc y polvo de madera a una proporción de 4 : 3 : 3). Después se añaden 100 ml de agua y la mezcla se amasa completamente, se seca y se moldea para obtener una bobina insecticida.

Ejemplo de formulación 11

20 Una mezcla de 0,8 g de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención y 0,4 g de butóxido de piperonilo se disuelve en acetona y el volumen total se ajusta a 10 ml con acetona. Después, 0,5 ml de esta solución se impregnan uniformemente en un material base para un lecho insecticida para un calentador eléctrico (una placa obtenida endureciendo fibrillas de una mezcla de hebras de algodón y pulpa) que tiene un tamaño de 2,5 cm × 1,5 cm y un espesor de 0,3 cm para obtener un lecho insecticida para calentador eléctrico.

25 Ejemplo de formulación 12

30 Una solución de 3 partes de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención en 97 partes de querosina desodorizada se vierte en un vaso fabricado con cloruro de vinilo. Un núcleo de absorción líquido cuya parte superior se puede calentar con un calentador (un polvo pulverizado inorgánico se endurece con un aglutinante y se sinteriza) se inserta en el mismo para obtener una parte a usar para un aparato de transpiración líquida de tipo núcleo de absorción líquida.

35 Ejemplo de formulación 13

Una solución de 100 mg de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención en una cantidad adecuada de acetona se impregna en una placa cerámica porosa que tiene un tamaño de y 4,0 cm × 4,0 cm y un espesor de 1,2 cm para obtener un fumigador térmico.

40 Ejemplo de formulación 14

Una solución de 100 µg de cada uno de los compuestos (1) a (4) de la presente invención en una cantidad adecuada de acetona se aplica uniformemente a papel de filtro que tiene un tamaño de 2 cm × 2 cm y un espesor de 0,3 mm y se seca al aire para eliminar la acetona y obtener un agente volátil para usar a temperatura ambiente.

45 Los siguientes ejemplos de ensayo ilustrarán que los compuestos de la presente invención son eficaces como ingrediente eficaz de una composición para el control de plagas.

50 Ejemplo de ensayo 1

Cada una de las composiciones de los compuestos (1), (2), (3) y (4) de la presente invención obtenida mediante el ejemplo de formulación 7 se diluyó con disolvente mixto de diclorometano/querosina desodorizada= 1/9 (p/p) de modo que la concentración eficaz del ingrediente alcanzó el 0,1% (p/v) para preparar una solución de ensayo.

55 Diez imagos de mosca doméstica (5 machos y 5 hembras) se liberaron en una taza de polietileno (diámetro de la base de 10,6 cm para cubrir con pelo de nailon de malla 16. La taza de polietileno se colocó en el fondo de un contenedor de ensayo (un tamaño de 46 cm × 46 cm y una altura de 70 cm) y 0,5 ml de la solución de ensayo se rociaron desde una altura de 30 cm por encima de la cara superior de la taza de polietileno a una presión de pulverización de 0,9 kg/cm² con una pistola de pulverización. La taza se sacó del contenedor de ensayo inmediatamente después de rociar para contar el número de moscas muertas un día después (dos repeticiones).

60 Como resultado, la tasa letal de moscas analizadas fue del 90% o más mediante el tratamiento con cada uno de los compuestos (1), (2), (3) y(4) de la presente invención (media de las dos repeticiones).

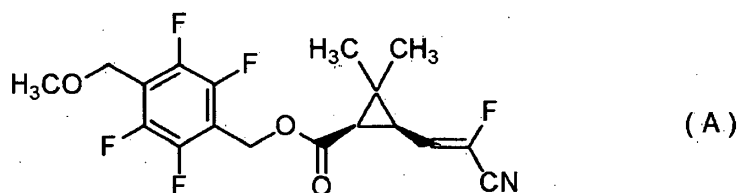
65

Ejemplo de ensayo 2

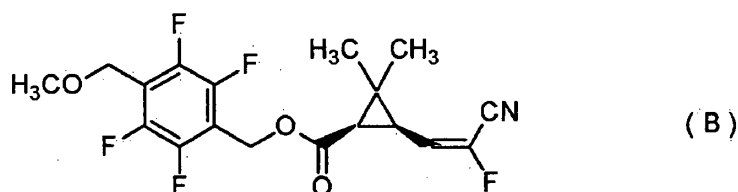
Cada una de las composiciones de los compuestos (1) y (2) de la presente invención obtenida mediante el ejemplo de formulación 7 se diluyó con líquido mixto de diclorometano/querosina desodorizada= 1/9 (p/p) de modo que la concentración eficaz del ingrediente alcanzó el 0,00625% (p/v) para preparar una solución de ensayo.

Se liberaron diez moscas domésticas en una cámara cúbica con un lateral de 70 cm para rociar 0,7 ml de la preparación a base de aceite mencionada anteriormente en la cámara a través de una ventana pequeña en la cara lateral de la cámara a una presión de pulverización de 0,9 kg/cm² con una pistola de pulverización. Después, se contó el número de moscas destruidas con el tiempo hasta 10 minutos después (dos repeticiones cada una). El efecto se evaluó con 4 grados de □ a × como se describe más adelante por medio de un valor de KT₅₀ calculado a partir de los resultados obtenidos.

Como ensayo control, los ensayos similares se realizaron usando compuestos de referencia comparativos (1R,3S)-3-((E)-2-ciano-2-clorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetibencilo



(en lo sucesivo en el presente documento denominado compuesto control (A)) y (1R,3S)-3-((E)-2-ciano-2-clorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoximetibencilo



(en lo sucesivo en el presente documento denominado compuesto control (B)) descrito en la patente de EE.UU. N° 5.135.951.

Los resultados de cada ensayo se muestran en la tabla 1.

Tabla 1

| Compuestos de ensayo | Concentración (p/v) | Eficacia |
|---|---------------------|----------|
| El compuesto (1) de la presente invención | 0,00625 | ○ |
| El compuesto (2) de la presente invención | 0,00625 | ⊙ |
| Compuesto control (A) | 0,00625 | × |
| Compuesto control (B) | 0,00625 | Δ |

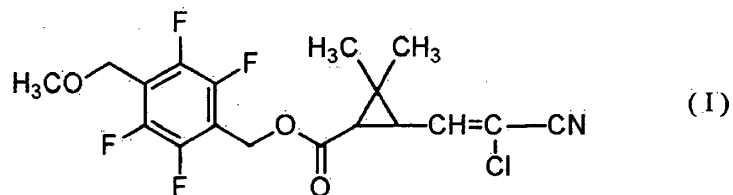
⊙: El valor de KT₅₀ es inferior a 2 minutos
 ○: El valor de KT₅₀ es de 2 minutos o más e inferior a 3 minutos
 Δ: El valor de KT₅₀ es de 3 minutos o más e inferior a 4 minutos
 ×: El valor de KT₅₀ es de 4 minutos o más

Aplicación industrial

Como se ha descrito anteriormente en el presente documento, el compuesto de la presente invención tiene un excelente efecto de control de plagas y, por tanto, es útil como ingrediente eficaz de una composición para el control de plagas.

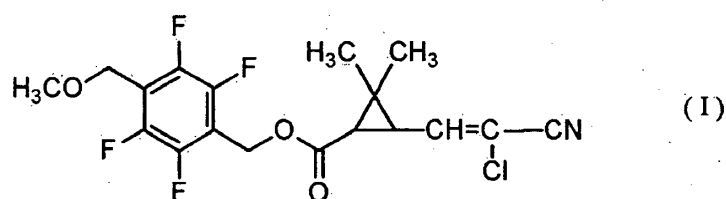
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto éster representado por la fórmula (I):



5

2. Una composición de control de plagas que comprende un compuesto éster representado por la fórmula (I):

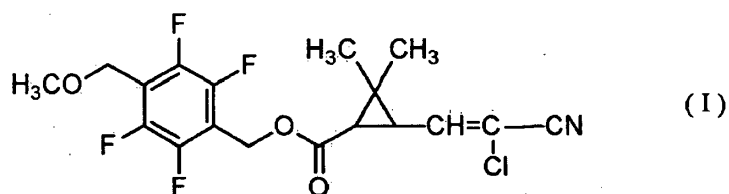


10

como ingrediente eficaz.

3. Un método de control de plagas que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto éster representado por la fórmula (I):

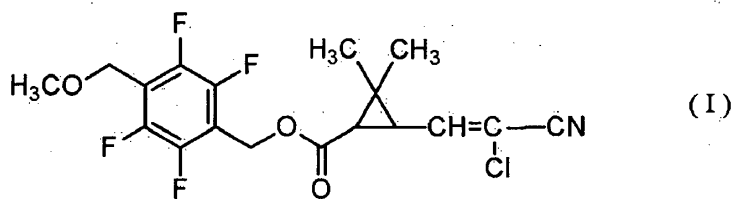
15



20

a plagas o a un hábitat de plagas.

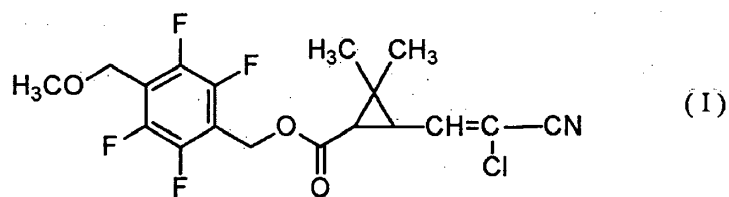
4. Uso de un compuesto éster representado por la fórmula (I):



25

para controlar plagas.

5. Uso de un compuesto éster representado por la fórmula (I):



30

para fabricar una composición para el control de plagas.