

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 527 607**

51 Int. Cl.:

**C07C 255/31** (2006.01)

**A01N 53/00** (2006.01)

**C07C 323/16** (2006.01)

**A01P 7/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.03.2011 E 11718791 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.12.2014 EP 2552883**

54 Título: **Ésteres de tipo piretrinoide como pesticidas**

30 Prioridad:

**31.03.2010 JP 2010081658**

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

**27.01.2015**

73 Titular/es:

**SUMITOMO CHEMICAL COMPANY LIMITED  
(100.0%)  
27-1 Shinkawa 2-chome, Chuo-ku  
Tokyo 104-8260, JP**

72 Inventor/es:

**MATSUO, NORITADA y  
MORI, TATSUYA**

74 Agente/Representante:

**UNGRÍA LÓPEZ, Javier**

ES 2 527 607 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

Ésteres de tipo piretrinoide como pesticidas

5 **Campo técnico**

La presente invención se relaciona con un compuesto éster y con su utilización.

10 **Técnica anterior**

Hasta ahora, se han sintetizado diversos compuestos con el objeto de controlar plagas. Por ejemplo, se describe un determinado compuesto éster en JP-A-57-158765. La Patente Estadounidense 4.602.038 desvela carboxilatos de ciclopropano específicos y composiciones insecticidas que contienen estos carboxilatos de ciclopropano.

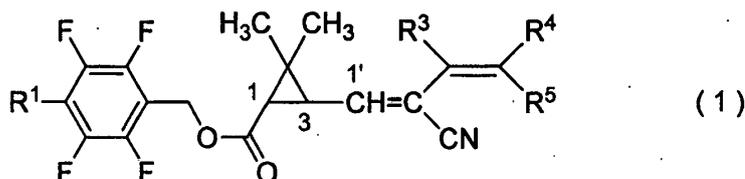
15 **Divulgación de la invención**

Es un objeto de la presente invención proporcionar un nuevo compuesto que tiene un excelente efecto de control sobre las plagas.

20 Los presentes inventores han estudiado intensamente y han visto que un compuesto éster representado por la fórmula (1) mostrada a continuación tiene un excelente efecto de control sobre las plagas, lo que condujo a la presente invención.

Es decir, la presente invención se dirige a la siguiente invención:

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



30 donde R<sup>1</sup> representa hidrógeno, flúor, C1-C4 alquilo, C1-C4 alcoxi, C1-C4 alcoximetilo o C1-C4 alquiltimetilo; R<sup>3</sup> representa hidrógeno o metilo; R<sup>4</sup> representa hidrógeno o C1-C4 alquilo, y R<sup>5</sup> representa hidrógeno o C1-C4 alquilo (al que de aquí en adelante se hará referencia como el compuesto de la presente invención);

35 [2] El compuesto éster según [1], donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans en la fórmula (1).

[3] El compuesto éster según [1], donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es una configuración R en la fórmula (1).

40 [4] El compuesto éster según [1], donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es una configuración R y la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans en la fórmula (1).

[5] El compuesto éster según [1], donde la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z en la fórmula (1).

45 [6] El compuesto éster según [1], donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z en la fórmula (1).

[7] El compuesto éster según [1], donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R, la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z en la fórmula (1).

[8] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[9] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>4</sup> es hidrógeno o metilo en la fórmula (1).

[10] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>4</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[11] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>4</sup> es metilo en la fórmula (1).

55 [12] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[13] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>4</sup> es hidrógeno o metilo en la fórmula (1).

[14] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>4</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[15] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>4</sup> es metilo en la fórmula (1).

60 [16] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1):

[17] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>4</sup> es hidrógeno o metilo y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[18] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>4</sup> es hidrógeno y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[19] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>4</sup> es metilo y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

5 [20] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es hidrógeno o metilo y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[21] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es hidrógeno y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

10 [22] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [7], donde R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es metilo y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

[23] El compuesto éster según cualquiera de [1] a [22], donde R<sup>1</sup> es metoximetilo en la fórmula (1).

[24] Un agente para el control de plagas consistente en el compuesto éster según cualquiera de [1] a [23] y un soporte inerte.

15 [25] Un método de control de plagas, que incluye una etapa de aplicación de una cantidad efectiva del compuesto éster según cualquiera de [1] a [23] a las plagas o al hábitat de las plagas.

[26] Un método de control de plagas, que incluye la etapa de aplicación de una cantidad efectiva del compuesto éster según cualquiera de [1] a [23] a cucarachas o al hábitat de las cucarachas.

[27] El método de control de plagas según [26], donde la cucaracha es la cucaracha americana (*Periplaneta americana*).

20 [28] El método de control de plagas según [26], donde la cucaracha es la cucaracha alemana (*Blattella germanica*).

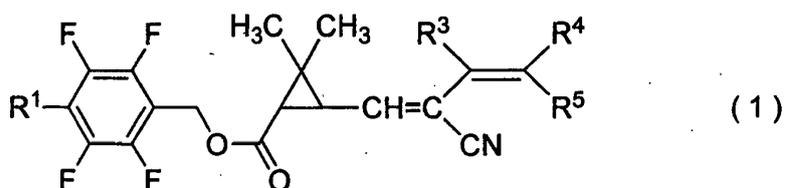
[29] Un método de control de plagas, que incluye una etapa de pulverización de una cantidad efectiva del compuesto éster según cualquiera de [1] a [23] a cucarachas o al hábitat de las cucarachas.

25 [30] El método de control de plagas según [29], donde la cucaracha es la cucaracha americana (*Periplaneta americana*).

[31] El método de control de plagas según [29], donde la cucaracha es la cucaracha alemana (*Blattella germanica*).

30 El compuesto de la presente invención tiene un excelente efecto de control de plagas y es, por lo tanto, útil como principio activo de un agente para el control de plagas.

35 En el compuesto de la presente invención, hay isómeros derivados de dos átomos de carbono asimétricos en la posición 1 y la posición 3 sobre el anillo de ciclopropano, e isómeros derivados del doble enlace presente en el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano. Se incluye en la presente invención cada isómero que tiene actividad de control de plagas o una mezcla de esos isómeros en una proporción arbitraria que tiene actividad de control de plagas.



40 Como ejemplos de alquilo C1-C4 representado por R<sup>1</sup>, se incluye metilo. Como ejemplos de alcoxi C1-C4 representado por R<sup>1</sup>, se incluye metoxi. Como ejemplos de alcoximetilo C1-C4 representado por R<sup>1</sup>, se incluye metoximetilo. Como ejemplos de alquiltiometilo C1-C4 representado por R<sup>1</sup>, se incluye metiltiometilo.

45 Como ejemplos del alquilo C1-C4 representado por R<sup>4</sup>, se incluyen metilo, etilo, propilo, butilo e isopropilo, y como ejemplos del alquilo C1-C4 representado por R<sup>5</sup>, se incluyen metilo, etilo, propilo, butilo e isopropilo.

Como ejemplos del compuesto de la presente invención, se incluyen los siguientes compuestos.

50 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans. Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es una configuración R.

55 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es una configuración R, y la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans.

60 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.























- Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es hidrógeno y  $R^5$  es hidrógeno.
- 5 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans,  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es hidrógeno y  $R^5$  es hidrógeno.
- 10 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R,  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es hidrógeno y  $R^5$  es hidrógeno.
- 15 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R, la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans,  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es hidrógeno y  $R^5$  es hidrógeno.
- 20 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es hidrógeno,  $R^5$  es hidrógeno y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.
- 25 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es hidrógeno,  $R^5$  es hidrógeno, la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R, la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.
- 30 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es metilo y  $R^5$  es hidrógeno.
- 35 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans,  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es metilo y  $R^5$  es hidrógeno.
- 40 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R,  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es metilo y  $R^5$  es hidrógeno.
- 45 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es metilo,  $R^5$  es hidrógeno y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.
- 50 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es metilo,  $R^5$  es hidrógeno y la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.
- 55 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^4$  es metilo,  $R^5$  es hidrógeno, la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R, la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.
- 60 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde  $R^1$  es metoximetilo,  $R^3$  es hidrógeno,  $R^4$  es hidrógeno o metilo y  $R^5$  es hidrógeno.
- 65 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans,  $R^1$  es metoximetilo,  $R^3$  es hidrógeno,  $R^4$  es hidrógeno o metilo y  $R^5$  es hidrógeno.



metoximetilo, R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es metilo y R<sup>5</sup> es hidrógeno.

5 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde R<sup>1</sup> es metoximetilo, R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es metilo, R<sup>5</sup> es hidrógeno y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.

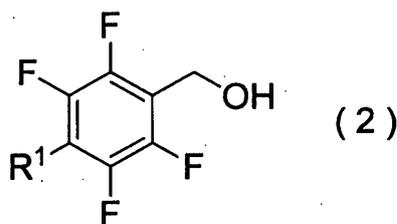
10 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde R<sup>1</sup> es metoximetilo, R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es metilo, R<sup>5</sup> es hidrógeno y la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.

15 Un compuesto éster representado por la fórmula (1) en donde R<sup>1</sup> es metoximetilo, R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es metilo, R<sup>5</sup> es hidrógeno, la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R, la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans y la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z.

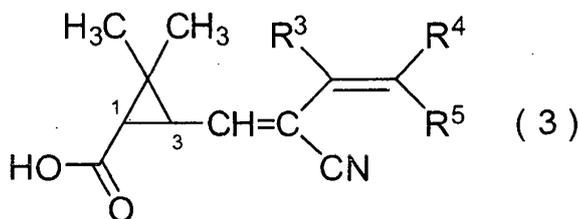
El procedimiento para producir el compuesto de la presente invención será descrito a continuación.

20 El compuesto de la presente invención puede ser producido, por ejemplo, mediante el procedimiento de producción descrito a continuación.

Un procedimiento de reacción de un compuesto alcohólico representado por la fórmula (2):



25 (donde R<sup>1</sup> tiene los mismos significados que como se ha definido anteriormente) con un compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3):



30 (donde R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> tienen los mismos significados que como se ha definido anteriormente), o un derivado reactivo del mismo.

35 Como ejemplos del derivado reactivo, se incluyen un haluro de ácido del compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3), un anhídrido de ácido del compuesto ácido carboxílico y ésteres metílicos y etílicos del compuesto ácido carboxílico. Como ejemplos del haluro de ácido, se incluye un compuesto cloruro de ácido.

40 La reacción es normalmente llevada a cabo en presencia de un agente condensante o de una base en un solvente.

Como ejemplos del agente condensante, se incluyen dicitohexilcarbodiimida y clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida.

45 Como ejemplos de la base, se incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N,N-dietilamina, 4-dimetilaminopiridina y diisopropilamina.

Como ejemplos del solvente, se incluyen hidrocarburos, tales como benceno, tolueno y hexano; éteres, tales como éter dietílico y tetrahidrofurano; hidrocarburos halogenados, tales como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano y clorobenceno; y un solvente mixto de éstos.

50 El tiempo de reacción es normalmente de 5 minutos a 72 horas.

La temperatura de reacción es normalmente de -20°C a 100°C (de -20°C al punto de ebullición del solvente en caso de que el punto de ebullición del solvente utilizado sea inferior a 100°C), y preferiblemente de -5°C a 100°C (de -5°C al punto de ebullición del solvente en caso de que el punto de ebullición del solvente utilizado sea inferior a 100°C).

5 En la reacción, se puede establecer eventualmente el uso de una razón molar del compuesto alcohólico representado por la fórmula (2) al compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3) o su derivado reactivo, pero se trata preferiblemente de una razón equimolar o casi equimolar.

10 El agente condensante o base puede ser normalmente utilizado en cualquier cantidad dentro del rango de 0,25 mol a una cantidad en exceso, y preferiblemente de 0,5 mol a 2 mol, en base a 1 mol del compuesto alcohólico representado por la fórmula (2). Estos agentes condensantes o bases son apropiadamente seleccionados según el tipo del compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3) o su derivado reactivo.

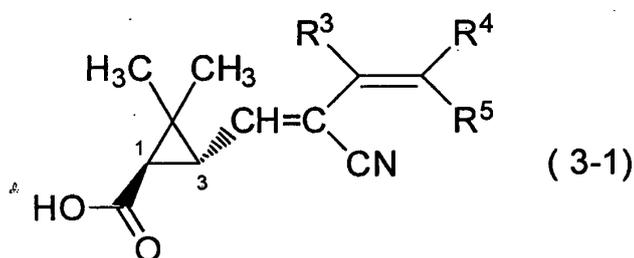
15 Tras completarse la reacción, la mezcla de reacción es normalmente sometida a una operación postratamiento de filtración de la mezcla de reacción y concentración del filtrado, o de vertido de agua en la mezcla de reacción, seguida de extracción con un solvente orgánico y posterior concentración, y de este modo se puede obtener el compuesto de la presente invención. El compuesto obtenido de la presente invención puede ser purificado por operaciones tales como cromatografía y destilación.

20 El compuesto alcohólico representado por la fórmula (2) es un compuesto descrito en JP-A-2000-63329 o JP-A-2001-213848.

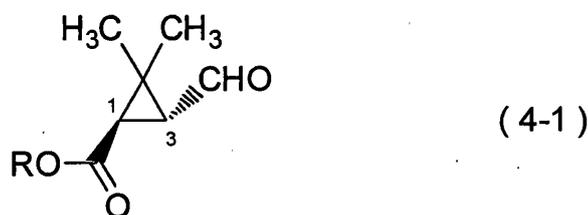
El intermediario de la presente invención puede ser producido, por ejemplo, mediante el procedimiento siguiente.

25 Entre los compuestos ácido carboxílico representados por la fórmula (3), se puede producir el compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-1) en donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans, por ejemplo, mediante el siguiente procedimiento.

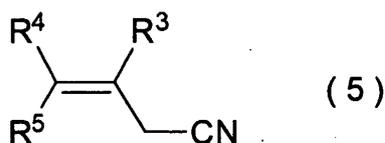
30 Es decir, se puede producir un compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-1):



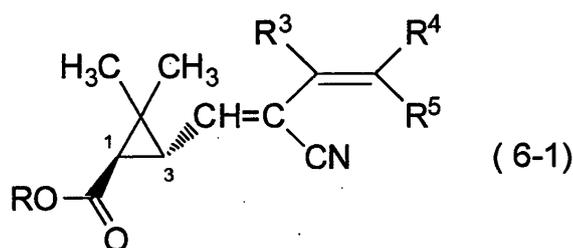
35 (donde R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> tienen los mismos significados que como se ha definido anteriormente) por reacción de un derivado éster de caronaldehído representado por la fórmula (4-1):



40 (donde R representa un grupo alquilo C1-C4) con un compuesto nitrilo representado por la fórmula (5):



45 (donde R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> tienen los mismos significados que como se ha definido anteriormente), en presencia de una base, para obtener el compuesto representado por la fórmula (6-1):



(donde R, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> tienen los mismos significados que como se ha definido anteriormente), e hidrolizando luego el compuesto obtenido en presencia de una base.

5 El compuesto representado por la fórmula (6-1) puede ser normalmente producido por reacción en un solvente polar a una temperatura de 0°C a 80°C, y preferiblemente de 0°C a 30°C, usando el compuesto nitrilo representado por la fórmula (5) en una cantidad de 1,0 a 1,5 mol y una base en una cantidad de 1 a 10 mol, en base a 1 mol del derivado éster de caronaldehído representado por la fórmula (4-1). Como ejemplos de la base, se incluyen carbonatos, tales como carbonato de potasio y carbonato de sodio, y compuestos de metales alcalinos, tales como hidruro de sodio. Como ejemplos del solvente polar, se incluyen amidas de ácidos, tales como N,N-dimetilformamida, y sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo.

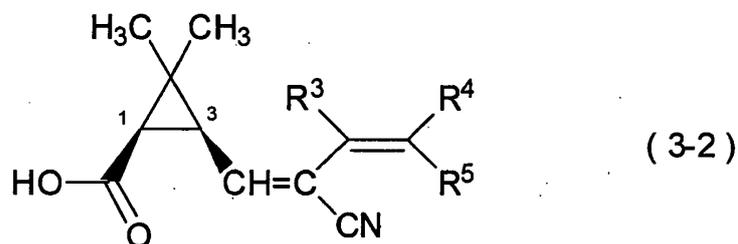
15 Tras completarse la reacción, se somete la mezcla de reacción a una operación postratamiento de adición de agua, seguida de extracción con un solvente orgánico y posterior secado y concentración de la capa orgánica, y de este modo se puede obtener el compuesto representado por la fórmula (6-1).

20 En la etapa de hidrólisis del compuesto representado por la fórmula (6-1), el compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-1) puede ser normalmente producido por reacción en un solvente a una temperatura de 0°C a 80°C, y preferiblemente de 0°C a 30°C, usando una base en una cantidad de 1 a 10 mol en base a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (6-1). Como ejemplos de la base, se incluyen sales de metales alcalinos de ácido carbónico, tales como carbonato de potasio y carbonato de sodio, y compuestos de metales alcalinos, tales como hidruro de sodio. Como ejemplos del solvente, se incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, alcoholes, tales como metanol, agua y una mezcla de los mismos.

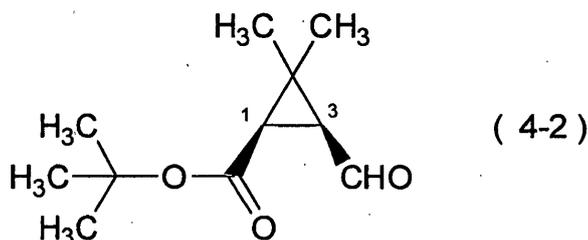
25 Tras completarse la reacción, la solución de reacción es sometida a una operación postratamiento de acidificación, seguida de extracción con un solvente orgánico y posterior secado y concentración de la capa orgánica, y de este modo se puede obtener el compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-1).

30 Entre los compuestos ácido carboxílico representados por la fórmula (3), se puede producir un compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-2) en donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración cis, por ejemplo, mediante el siguiente procedimiento.

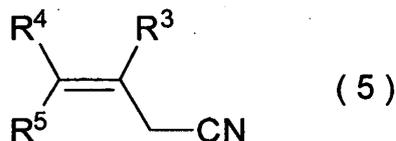
35 Es decir, se puede producir el compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-2):



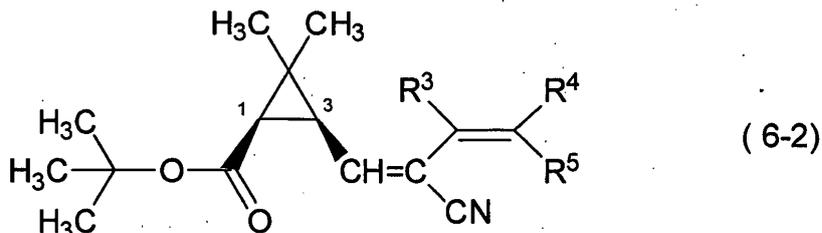
40 (donde R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> tienen los mismos significados que como se ha definido anteriormente) por reacción de un derivado éster de caronaldehído representado por la fórmula (4-2):



con el derivado nitrilo representado por la fórmula (5):



- 5 (donde R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> tienen los mismos significados que como se ha definido anteriormente), en presencia de una base, para obtener un compuesto representado por la fórmula (6-2):



- 10 (donde R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> tienen los mismos significados que como se ha definido anteriormente), y calentando el compuesto obtenido en presencia de un catalizador ácido.

El compuesto representado por la fórmula (6-2) puede ser normalmente producido por reacción en un solvente polar a una temperatura de 0°C a 80°C, y preferiblemente de 0°C a 30°C, usando el compuesto nitrilo representado por la fórmula (5) en una cantidad de 1,0 a 1,5 mol y una base en una cantidad de 1 a 10 mol, en base a 1 mol del derivado éster de caronaldehído representado por la fórmula (4-2). Como ejemplos de la base, se incluyen carbonatos, tales como carbonato de potasio y carbonato de sodio, y compuestos de metales alcalinos, tales como hidruro de sodio. Como ejemplos del solvente polar, se incluyen amidas de ácidos, tales como N,N-dimetilformamida, y sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo.

Tras completarse la reacción, se somete la mezcla de reacción a una operación postratamiento de adición de agua, seguida de extracción con un solvente orgánico y posterior secado y concentración de la capa orgánica, y de este modo se puede obtener el compuesto representado por la fórmula (6-2).

En la etapa de producción del compuesto representado por la fórmula (3-2) a partir del compuesto representado por la fórmula (6-2), la reacción es llevada a cabo a una temperatura de reacción normalmente de 50°C a 150°C (de 50°C al punto de ebullición del solvente en caso de que el punto de ebullición del solvente sea inferior a 150°C), usando un catalizador ácido en una cantidad de 0,005 a 0,05 mol en base a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (6-2), y de este modo se puede producir el compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-2). Como ejemplos del catalizador ácido, se incluyen ácido p-toluensulfónico y similares. Como ejemplos del solvente, se incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, hidrocarburos, tales como tolueno, y una mezcla de los mismos.

Tras completarse la reacción, el compuesto ácido carboxílico representado por la fórmula (3-2) puede ser obtenido sometiendo a una operación postratamiento de secado y concentración de la capa orgánica.

El derivado éster de caronaldehído representado por la fórmula (4-1) es un compuesto descrito en Tetrahedron 45, 3039-3052 (1989).

El derivado éster de caronaldehído representado por la fórmula (4-2) es un compuesto descrito en Journal of American Chemical Society, 1982, 104, 4282-4283.

El compuesto nitrilo representado por la fórmula (5) puede ser sintetizado según un método conocido, tal como se describe en Journal of American Chemical Society, 2008, 130, 3734.

Como ejemplos de plagas sobre las que el compuesto de la presente invención tiene un efecto de control, se incluyen plagas de artrópodos nocivos, tales como insectos nocivos y acaríneos nocivos, y más específicamente las siguientes plagas.

Hemiptera: saltadores de plantas, tales como *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens* y *Sogatella furcifera*, saltadores de hojas, tales como *Nephotettix cincticeps* y *Nephotettix virescens*, áfidos, tales como *Aphis gossypii* y *Myzuspersicae*, chinches de plantas, tales como *Nezara antennata*, *Riptortus clavatus*, *Eysarcoris lewisi*, *Eysarcoris parvus*, *Plautia stali* y *Halyomorpha mista*, moscas blancas, tales como *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci* y *Bemisia argentifolii*, escamas, tales como *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciososa*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens* e *Icerya purchasi*, chinches de encaje, chinches de las camas, tales como

*Cimex lectularius*, piojos saltadores de las plantas, etc.

Lepidoptera: Pyralidae, tales como *Chilo suppressalis*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata* y *Plodia interpunctella*, *Spodoptera litura*, *Pseudaletia separata*, Noctuidae, tales como *Trichoplusia spp.*, *Heliothis spp.* y *Earias spp.*, Pieridae, tales como *Pieris rapae*, Tortricidae, tales como *Adoxophyes spp.*, *Grapholita molesta*, *Adoxophyes orana fasciata* y *Cydia pomonella*, Carposinidae, tales como *Carposina niponensis*, Lyonetiidae, tales como *Lyonetia spp.*, Lymantriidae, tales como *Lymantria spp.*, Lymantriidae, tales como *Euproctis spp.*, Yponomeutidae, tales como *Plutella xylostella*, Gelechiidae, tales como *Pectinophora gossypiella*, Arctiidae, tales como *Hyphantria cunea*, Tineidae, tales como *Tinea translucens* y *Tineola bisselliella*, etc.

Diptera: *Culex spp.*, tales como *Culex pipiens pallens*, *Culex tritaeniorhynchus* y *Culex quinquefasciatus*, *Aedes spp.*, tales como *Aedes aegypti* y *Aedes albopictus*, *Anopheles spp.*, tales como *Anopheles sinensis* y *Anopheles gambiae*, Chironomidae, Muscidae, tales como *Musca domestica* y *Muscina stabulans*, Calliphoridae, Sarcophagidae, pequeña mosca doméstica, Anthomyiidae, tales como *Delia platura* y *Delia antiqua*, Tephritidae, Drosophilidae, Phoridae, tales como *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, Psychodidae, Simuliidae, Tabanidae, Stomoxysidae, Agromyzidae, etc.

Coleoptera: *Diabrotica spp.*, tales como *Diabrotica virgifera virgifera* y *Diabrotica undecimpunctata howardi*, Scarabaeidae, tales como *Anomala cuprea* y *Anomala rufocuprea*, Curculionidae, tales como *Sitophilus zeamais*, *Lissorhoptrus oryzophilus* y *Callosobruchus chienensis*, Tenebrionidae, tales como *Tenebrio molitor* y *Tribolium castaneum*, Chrysomelidae, tales como *Oulema oryzae*, *Aulacophora femoralis*, *Phyllotreta striolata* y *Leptinotarsa decemlineata*, Dermestidae, tales como *Dermestes maculatus*, Anobiidae, *Epilachna spp.*, tales como *Epilachna vigintioctopunctata*, Lyctidae, Bostrychidae, Ptinidae, Cerambycidae, *Paederus fuscipes*, etc.

Blattodea: *Blattella germanica*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Blatta orientalis*, etc.

Thysanoptera: *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella intonsa*, etc.

Hymenoptera: Formicidae, tales como *Monomorium pharaonis*, *Formica fusca japonica*, *Ochetellus glaber*, *Pristomyrmex pungens*, *Pheidole noda* y *Linepithema humile*, avispas de patas largas, tales como *Polistes chinensis antennalis*, *Polistes jadwigae* y *Polistes rothneyi*, Vespidae, tales como *Vespa mandarinia japonica*, *Vespa simillima*, *Vespa analis insularis*, *Vespa crabro flavofasciata* y *Vespa ducalis*, Betilidae, Xylocopa, Pompilidae, Sphecoidae, avispa albañil, etc.

Orthoptera: grillos topo, saltamontes, etc.

Shiphonaptera: *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Pulex irritans*, *Xenopsylla cheopis*, etc.

Anoplura: *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Dalmalinia ovis*, etc.

Isoptera: *Reticulitermes spp.*, tales como *Reticulitermes speratus*, *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes tibialis* y *Heterotermes aureus*, *Incisitermes spp.*, tales como *Incisitermes minor*, y *Zootermopsis spp.*, tales como *Zootermopsis nevadensis*, etc.

Acarina: Tetranychidae, tales como *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi* y *Oligonychus spp.*, Eriophyidae, tales como *Aculops pelekassi* y *Aculus schlechtendali*, Tarsonemidae, tales como *Polyphagotarsonemus latus*, Tenuipalpidae, Tuckerellidae, Ixodidae, tales como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor variabilis*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes scapularis*, *Boophilus microplus*, *Amblyomma americanum* y *Rhipicephalus sanguineus*, Acaridae, tales como *Tyrophagus putrescentiae*, Dermanyssidae, tales como *Dermatophagoides farinae*, *Dermatophagoides pteronyssus*, Cheyletidae, tales como *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis* y *Cheyletus moorei*, ácaros de los pollos, tales como *Ornithonyssus bacoti*, *Ornithonyssus sylvaivium* y *Dermanyssus gallinae*, Trombiculidae, tales como *Leptotrombidium akamushi*, etc.

Araneae: araña del follaje japonesa (*Chiracanthium japonicum*), araña de espalda roja (*Latrodectus hasseltii*), *Nephila clavata* (Tetragnathidae), *Cyclosa octotuberculata*, araña cruz de San Andrés (*Argiope amoena*), araña avispa (*Argiope bruennichii*), araña diablo (*Araneus ventricosus*), araña de la hierba (*Agelena silvatica*), araña lobo (*Pardosa astrigera*), araña de la acedera (*Dolomedes sulfurous*), *Carrhotus xanthogramma*, araña común de las casas (*Achaearanea tepidariorum*), *Coelotes insidiosus*, araña saltadora (Salticidae), araña cangrejo gigante (*Heteropoda venatoria*), etc.

Chilopoda: ciempiés, tales como el ciempiés de las casas (*Thereuonema hilgendorfi*), *Scolopendra subspinipes*, *Scolopendra subspinipes japonica*, *Scolopocryptops rubiginosus*, *Bothropolys asperatus*, etc.

Diplopoda: milpiés, tales como el milpiés de jardín (*Oxidus gracilis*), el milpiés de jardín (*Nedyopus tambanus*), el milpiés de los trenes (*Parafontaria laminata*), el milpiés de los trenes (*Parafontaria laminata armigera*), *Parafontaria acutidens*, *Epanerchodus orientalis*, etc.

Isopoda: cochinillas, tales como *Porcellionides pruinosus* (Brandt), *Porcellio scaber* Latreille, bichos bolita, tales como el bicho bolita común (*Armadillidium vulgare*), piojos de mar, tales como el piojo de las piedras (*Ligia exotica*), etc.

Gastropoda: babosa de los árboles (*Limax marginatus*), babosa amarilla (*Limax flavus*), etc.

El agente para el control de plagas de la presente invención contiene el compuesto de la presente invención y un soporte inerte. El agente para el control de plagas de la presente invención es normalmente formado en las formulaciones descritas a continuación. Como ejemplos de la formulación, se incluyen una solución oleosa, un concentrado emulsionable, un polvo humectable, una formulación fluida (v.g., una suspensión acuosa o una emulsión acuosa), una microcápsula, un polvo, un gránulo, una tableta, un aerosol, una formulación con dióxido de carbono, una formulación de transpiración de calor (v.g., un serpiente insecticida, una esterilla insecticida eléctrica o un pesticida de transpiración de calor de tipo núcleo absorbente de líquido), una formulación piezo-insecticida, un

fumigante térmico (v.g., un fumigante de tipo autocombustión, un fumigante de tipo reacción química o un fumigante de placa cerámica porosa), una formulación de transpiración no calentada (v.g., una formulación de transpiración de resina, una formulación de transpiración de papel, una formulación de transpiración de tejido no tejido, una formulación de transpiración de tejido tejido o una tableta sublimante), una formulación aerosol (v.g., una formulación nebulizadora), una formulación para contacto directo (v.g., una formulación de contacto en forma de lámina, una formulación de contacto en forma de cinta o una formulación de contacto en forma de red), una formulación ULV (de volumen ultrabajo) y un cebo envenenado.

Como ejemplos del método de formulación, se incluyen los siguientes métodos.

(1) Un método consistente en mezclar el compuesto de la presente invención con un soporte sólido, un soporte líquido, un soporte gaseoso o un cebo envenenado, seguido de adición de un surfactante y otros agentes auxiliares de formulación, y, en caso de ser necesario, con un ulterior procesamiento.

(2) Un método consistente en la impregnación de un material de base que no contiene ningún principio activo con el compuesto de la presente invención.

(3) Un método consistente en mezclar el compuesto de la presente invención y un material de base, sometiendo a continuación la mezcla a procesamiento de moldeo.

Estas formulaciones normalmente contienen de un 0,001 a un 98% en peso del compuesto de la presente invención, dependiendo de las formas de formulación.

Como ejemplos del soporte sólido utilizado en la formulación, se incluyen polvos o gránulos finos de arcillas (v.g., arcilla de caolín, tierra de diatomeas, bentonita, arcilla Fubasami o arcilla blanca ácida), óxido de silicio hidratado sintético, talco, cerámica, otros minerales inorgánicos (v.g., sericita, cuarzo, azufre, carbón activo, carbonato de calcio o sílice hidratada) y sustancias en polvo fino y granuladas, tales como fertilizantes químicos (v.g., sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, cloruro de amonio o urea); sustancias que son sólidas a temperatura ambiente (v.g., 2,4,6-triisopropil-1,3,5-trioxano, naftaleno, p-diclorobenceno o alcanfor, adamantina); y fieltro, fibra, tela, tejido, lámina, papel, hilo, espuma, material poroso y multifilamento, que comprende una o más sustancias seleccionadas entre el grupo consistente en lana, seda, algodón, cáñamo, pulpa, resinas sintéticas (v.g., resinas de polietileno, tales como polietileno de baja densidad, polietileno de baja densidad de cadena lineal y polietileno de alta densidad; copolímeros de etileno-éster de vinilo, tales como un copolímero de etileno-acetato de vinilo; copolímeros de etileno-metacrilato, tales como un copolímero de etileno-metacrilato de metilo y un copolímero de etileno-metacrilato de etilo; copolímeros de etileno-acrilato, tales como un copolímero de etileno-acrilato de metilo y un copolímero de etileno-acrilato de etilo; copolímeros de etileno-ácido vinilcarboxílico, tales como un copolímero de etileno-ácido acrílico; copolímeros de etileno-tetraciclododeceno; resinas de polipropileno, tales como un homopolímero de propileno y un copolímero de propileno-etileno; poli-4-metilpenteno-1, polibutadieno, poliestireno; resina de acrilonitrilo-estireno; resinas de acrilonitrilo-butadieno-estireno; elastómeros de estireno, tales como un copolímero de bloques de estireno-dieno conjugado y un copolímero de bloques de estireno hidrogenado-dieno conjugado; resinas de flúor; resinas acrílicas, tales como polimetacrilato de metilo; resinas de poliamida, tales como nilón 6 y nilón 66; resinas de poliéster, tales como tefefalato de polietileno, naftalato de polietileno, tereftalato de polibutileno y tereftalato de policiclohexilendimetileno; o resinas porosas, tales como policarbonato, poliactal, poliacrilsulfona, poliariolato, poliéster de ácido hidroxibenzoico, poliéter imida, poliéster carbonato, resinas de éter polifenilénico, cloruro de polivinilo, cloruro de polivinilideno, poliuretano, poliuretano espumado, polipropileno espumado y etileno espumado), vidrio, metal y cerámica.

Como ejemplos del soporte líquido, se incluyen hidrocarburos aromáticos o alifáticos (v.g., xileno, tolueno, alquilnaftaleno, fenilxiletano, queroseno, aceite ligero, hexano o ciclohexano), hidrocarburos halogenados (v.g., clorobenceno, diclorometano, dicloroetano o tricloroetano), alcoholes (v.g., metanol, etanol, alcohol isopropílico, butanol, hexanol, alcohol bencílico o etilenglicol), éteres (v.g., éter dietílico, etilenglicol dimetil éter, dietilenglicol monometil éter, dietilenglicol monoetil éter, propilenglicol monometil éter, tetrahidrofurano o dioxano), ésteres (v.g., acetato de etilo o acetato de butilo), cetonas (v.g., acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona), nitrilos (v.g., acetonitrilo o isobutironitrilo), sulfóxidos (v.g., sulfóxido de dimetilo), amidas de ácido (v.g., N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida o N-metilpirrolidona), carbonato de alquilideno (v.g., carbonato de propileno), aceites vegetales (v.g., aceite de soja o aceite de semillas de algodón), aceites esenciales de plantas (v.g., aceite de naranja, aceite de hisopo o aceite de limón), y agua.

Como ejemplos del soporte gaseoso, se incluyen gas butano, clorofluorocarburos, gas de petróleo licuado (GPL), éter dimetílico y dióxido de carbono.

Como ejemplos del surfactante, se incluyen sulfato de alquilo, sulfonato de alquilo, sulfonato de alquilarilo, éteres alquilarílicos, éteres alquilarílicos polioxitilenados, éteres de polietilenglicol, ésteres de alcoholes polihídricos y derivados de alcoholes de azúcares.

Como ejemplos de los otros agentes auxiliares para la formulación, se incluyen un ligante, un dispersante y un estabilizador. Específicamente, se pueden citar, por ejemplo, caseína, gelatina, polisacáridos (v.g., almidón, goma arábiga, derivados de celulosa o ácido algínico), derivados de lignina, bentonita, sacáridos, polímeros hidrosolubles

sintéticos (v.g., alcohol polivinílico o polivinilpirrolidona), ácido poliacrílico, BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol) y BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol).

5 Como ejemplos de material base para el serpentín insecticida, se incluye una mezcla de polvo vegetal, tal como harina y polvo de heces de madera, y un ligante, tal como polvo de material de incienso, almidón y gluten.

10 Como ejemplos de material base para la esterilla insecticida eléctrica, se incluyen una placa obtenida por endurecimiento de pelusa de algodón y una placa obtenida por endurecimiento de fibrillas de una mezcla de pelusa de algodón y pulpa.

15 Como ejemplos de material base para el fumigador de tipo autocombustión, se incluyen agentes exotérmicos combustibles, tales como nitrato, nitrito, sal de guanidina, clorato de potasio, nitrocelulosa, etilcelulosa y harina de madera, estimulantes de la descomposición térmica, tales como sales de metales alcalinos, sales de metales alcalinotérreos, dicromato y cromato, soportes de oxígeno, tales como nitrato de potasio, agentes soportadores de la combustión, tales como melamina y almidón de harina, expansores, tales como tierra de diatomeas, y ligantes, tales como cola sintética.

20 Como ejemplos de material base para el fumigador de tipo reacción química, se incluyen agentes exotérmicos, tales como sulfuros de metales alcalinos, polisulfuros, hidrosulfuros y óxido de calcio, agentes catalíticos, tales como un material carbonado, carburo de hierro y arcilla blanca activa, agentes espumantes orgánicos, tales como azodicarbonamida, bencenosulfonilhidrazida, dinitropentametilentetramina, poliestireno y poliuretano, y cargas, tales como tiras de fibra natural y fibra sintética.

25 Como ejemplos de resina usada como material base de la formulación de transpiración de resina, se incluyen resinas de polietileno, tales como polietileno de baja densidad, polietileno de baja densidad de cadena lineal y polietileno de alta densidad; copolímeros de etileno-ésteres de vinilo, tales como un copolímero de etileno-acetato de vinilo; copolímeros de etileno-metacrilato, tales como un copolímero de etileno-metacrilato de metilo y un copolímero de etileno-metacrilato de etilo; copolímeros de etileno-acrilato, tales como un copolímero de etileno-acrilato de metilo y un copolímero de etileno-acrilato de etilo; copolímeros de etileno-ácido vinilcarboxílico, tales como un copolímero de etileno-ácido acrílico; copolímeros de etileno-tetraciclododeceno; resinas de polipropileno, tales como un copolímero de propileno y un copolímero de propileno-etileno; poli-4-metilpenteno-1, polibuteno-1, polibutadieno, poliestireno, resinas de acrilonitrilo-estireno; resinas de acrilonitrilo-butadieno-estireno; elastómeros de estireno, tales como un copolímero de bloques de estireno-dieno conjugado y un copolímero de bloques de estireno hidrogenado-dieno conjugado; resinas de flúor; resinas acrílicas, tales como polimetacrilato de metilo; resinas de poliamida, tales como nilón 6 y nilón 66; resinas de poliéster, tales como tereftalato de polietileno, naftalato de polietileno, butalato de polibutileno y tereftalato de policiclohexilendimetileno; policarbonato, poliacetato, poliacrilsulfona, poliariolato, poliéster de ácido hidroxibenzoico, poliéter imida, poliéster carbonato, resina de éter polifenilénico, cloruro de polivinilo, cloruro de polivinilideno y poliuretano. Estos materiales base pueden ser usados solos o como una combinación de dos o más tipos. Si es necesario, se puede añadir un plastificante, tal como ésteres de ftalato (v.g., ftalato de dimetilo, ftalato de dioctilo, etc.), ésteres de ácido adípico y ácido esteárico, a estos materiales base. La formulación de transpiración de resina puede ser preparada mezclando el compuesto de la presente invención con el material base, amasando la mezcla y moldeándola luego por moldeo de inyección, moldeo de extrusión o moldeo de presión. Se puede someter la formulación de resina resultante a un posterior procedimiento de moldeo o de corte, si es necesario, para procesarla en formas tales como una forma de placa, de película, de cinta, de red o de cuerda. Estas formulaciones de resina pueden ser procesadas en collares para animales, etiquetas de oreja para animales, productos en lámina, cuerdas para trampas, soportes de jardinería y otros productos.

50 Como ejemplos de material base para el cebo envenenado, se incluyen ingredientes para cebos, tales como polvo de cereales, aceite vegetal, sacáridos y celulosa cristalina, antioxidantes, tales como dibutilhidroxitolueno y ácido nordihidroguayarático, conservantes, tales como ácido deshidroacético, inhibidores de la ingestión accidental para niños y mascotas, tales como polvo de chile; y fragancias para la atracción de insectos, tales como sabor de queso, sabor de cebolla y aceite de cacahuete.

55 El método de control de plagas de la presente invención es normalmente llevado a cabo aplicando una cantidad efectiva del compuesto de la presente invención a una plaga o a su hábitat (v.g. cuerpos de plantas, suelo, el interior de una vivienda, cuerpos de animales, el interior de un vehículo o un espacio abierto exterior) en forma de un agente para el control de plagas de la presente invención.

60 Un método de aplicación del agente para el control de plagas de la presente invención incluye los siguientes métodos y es apropiadamente seleccionado dependiendo de la forma del agente para el control de plagas de la presente invención, del área de aplicación, etc.

65 (1) Un método consistente en aplicar un agente para el control de plagas de la presente invención tal cual a una plaga o al hábitat de la plaga.

(2) Un método consistente en diluir un agente para el control de plagas de la presente invención con un solvente,

tal como agua, y pulverizar luego la dilución sobre una plaga o el hábitat de la plaga. En este método, el agente para el control de plagas de la presente invención es normalmente formulado en un concentrado emulsionable, un polvo hidratable, una formulación fluida, una microcápsula o similares. La formulación es normalmente diluida de tal forma que la concentración del compuesto de la presente invención pueda ser de 0,1 a 10.000 ppm.

5 (3) Un método consistente en calentar un agente para el control de plagas de la presente invención en el hábitat de una plaga, dejando así que el principio activo se volatilice y difunda a partir del agente para el control de plagas.

10 En este caso, se puede determinar la cantidad o la concentración de aplicación del compuesto de la presente invención apropiadamente dependiendo de la forma, del período de aplicación, del área de aplicación, del método de aplicación, del tipo de plaga, del daño en el que se pueda incurrir, etc.

15 Cuando se usa el compuesto de la presente invención para la prevención de epidemias, la cantidad que se ha de aplicar es normalmente de 0,0001 a 1.000 mg/m<sup>3</sup> del compuesto de la presente invención en caso de aplicarlo a un espacio, y de 0,0001 a 1.000 mg/m<sup>2</sup> del compuesto de la presente invención en caso de aplicarlo a un plano. Se aplica un serpentín insecticida o una esterilla insecticida eléctrica calentando para volatilizar y difundir el principio activo, dependiendo de la forma de la formulación. Se deja que una formulación de transpiración de resina, una formulación de transpiración de papel, una formulación de transpiración de tejido no tejido, una formulación de transpiración de tejido tejido o una tableta sublimante permanezcan tal cual en un espacio en el que se debe realizar la aplicación y se ponen bajo insuflación de aire.

20 Cuando se aplica el agente para el control de plagas de la presente invención a un espacio con el fin de prevenir epidemias, como ejemplos del espacio se incluyen un clóset, un armario japonés, un baúl japonés, una despensa, un aseo, un cuarto de baño, un cobertizo, una sala de estar, un salón comedor, un garaje, el interior de un vehículo, etc. El agente para el control de plagas puede ser también aplicado a un espacio abierto exterior.

25 Cuando el agente para el control de plagas de la presente invención es usado para controlar parásitos externos del ganado, tal como vacas, caballos, cerdos, ovejas, cabras y pollos, y pequeños animales, tales como perros, gatos, ratas y ratones, el agente para el control de plagas de la presente invención puede ser aplicado a los animales mediante un método conocido en el campo de la veterinaria. Específicamente, cuando se pretende realizar un control sistémico, el agente para el control de plagas de la presente invención es administrado a los animales como una tableta, una mezcla con el alimento o un supositorio, o por inyección (incluyendo la inyección intramuscular, subcutánea, intravenosa e intraperitoneal). Por otro lado, cuando se pretende realizar un control no sistémico, el agente para el control de plagas de la presente invención es aplicado a los animales por pulverización de la solución oleosa o solución acuosa, tratamiento "pour-on" o "spot-on" o lavado del animal con una formulación en champú, o poniendo un collar o etiqueta de oreja hechos de la formulación de transpiración de resina al animal. En caso de administración al cuerpo de un animal, la dosificación del compuesto de la presente invención es normalmente de 0,1 a 1.000 mg por 1 kg de peso corporal del animal.

30 Cuando se usa el agente para el control de plagas de la presente invención para controlar una plaga en el terreno agrícola, la cantidad puede variar ampliamente dependiendo del período de aplicación, del área de aplicación, del método de aplicación y de otros factores, y es normalmente de 1 a 10.000 g en términos del compuesto de la presente invención por 10.000 m<sup>2</sup>. Cuando se formula el agente para el control de plagas de la presente invención en un concentrado emulsionable, un polvo hidratable, una formulación fluida, etc. el agente para el control de plagas es normalmente aplicado tras diluirlo con agua de tal forma que la concentración del principio activo resulte de 0,01 a 10.000 ppm, y un gránulo o un polvo es normalmente aplicado tal cual.

35 Estas formulaciones o diluciones en agua de las formulaciones pueden ser directamente pulverizadas sobre las plagas o sobre las plantas, tales como plantas de cultivo, que han de ser protegidas de las plagas, o pueden ser usadas en tratamiento de suelos para el control de las plagas que habitan en el suelo de la tierra cultivada.

40 También se puede realizar la aplicación por un método de envolvimiento directo de la formulación de resina formada en forma de lámina, o de la formulación en forma de cuerda o de cordón, alrededor de las plantas, arrojamiento de la formulación en la proximidad de las plantas o dispersión de la formulación sobre la superficie del suelo a nivel de la raíz.

45 El compuesto de la presente invención puede ser usado como agente para el control de plagas en un campo de cultivo, tal como granja, arrozal, césped o huerto, o en un campo no cultivado. El compuesto de la presente invención puede controlar plagas que habitan en el campo de cultivo en que se cultivan las siguientes "plantas de cultivo".

50 Cultivos agrícolas: maíz, arroz, trigo, cebada, centeno, avena, sorgo, algodón, soja, cacahuete, trigo sarraceno, remolacha azucarera, colza, girasol, caña de azúcar, tabaco, etc.  
 55 Hortalizas: hortalizas Solanaceae (berenjena, tomate, pimiento verde, chile picante, patata etc.), hortalizas Cucurbitaceae (pepino, calabaza, calabacín, sandía, melón, etc.), hortalizas Cruciferae (rábano japonés, nabo, rábano picante, colirrábano, col china, col, mostaza morena, brécol, coliflor, etc.), hortalizas Compositae

(bardana, crisantemo guirnalda, alcachofa, lechuga, etc.), hortalizas Liliaceae (cebollita, cebolla, ajo, espárrago, etc.), hortalizas Umbelliferae (zanahoria, perejil, apio, chirivía, etc.), hortalizas Chenopodiaceae (espinaca, acelga, etc.), hortalizas Labiatae (albahaca japonesa, menta, albahaca, etc.), fresa, boniato, ñame, aráceas, etc.

5 Árboles frutales: frutas en pomo (manzana, pera común, pera japonesa, membrillo chino, membrillo, etc.), frutas carnosas con hueso (melocotón, ciruela, nectarina, níspero, cereza, albaricoque, ciruela pasa, etc.), plantas cítricas (mandarina Satsuma, naranja, limón, lima, pomelo, etc.), frutos secos (castaña, nuez, avellana, almendra, pistacho, anacardo, nuez de macadamia, etc.), frutos en baya (arándano azul, arándano, zarzamora, frambuesa, etc.), uva, caqui, aceituna, níspero japonés, plátano, café, dátil, cocotero, palma de aceite, etc.

10 Árboles distintos de árboles frutales: té, moral, plantas leñosas (azalea, camelia, hortensia, sasanqua, *Illicium religiosum*, cerezo, tulipero, árbol de Júpiter, olivo fragante, etc.), árboles de calle (fresno, abedul, cornejo, eucalipto, ginkgo, lilo, arce, roble, álamo, árbol del amor, liquidámbar chino, plátano, zelkova, tuya japonesa, abeto, tsuga, enebro de las pagodas, pino, picea, tejo, olmo, castaño de indias, etc.), viburno dulce, *Podocarpus macrophyllus*, cedro japonés, ciprés japonés, crotón, bonetero, majuelo chino, etc.

15 Pastos: zoysia (césped japonés, hierba de las Mascarenas, etc.), hierba bermuda (*Cynodon dactylon*, etc.), agrostis (agrostis trepador, *Agrostis stolonifera*, *Agrostis tenuis*, etc.), poa (pasto azul de Kentucky, poa común, etc.), festuca (festuca alta, festuca roja, festuca trepadora, etc.), césped inglés (cizaña, césped inglés perenne, etc.), pasto ovillo, hierba timotea, etc.

20 Otros: flores (rosa, clavel, crisantemo, *Eustoma grandiflorum* Shinnery (genciana pratense), gypsophila, gerbera, caléndula de maceta, salvia, petunia, verbena, tulipán, áster, genciana, lirio, pensamiento, ciclamen, orquídea, lirio del valle, lavanda, alelí, col rizada ornamental, prímula, flor de Pascua, gladiolo, cattleya, margarita, verbena, cymbidium, begonia, etc.), plantas para biocombustibles (jatrofa, cártamo, camelia, pasto varilla, Miscanthus, hierba cinta, junco gigante, kenaf, mandioca, sauce, etc.), plantas de follaje, etc.

25 Las anteriores "plantas de cultivo" incluyen plantas de cultivo de genes transgénicos.

El compuesto de la presente invención puede ser mezclado o usado en combinación con otros insecticidas, acaricidas, nematocidas, agentes para el control de plagas en suelos, fungicidas, herbicidas, agentes reguladores del crecimiento de las plantas, repelentes, sinergistas, fertilizantes o modificadores de suelos.

30 Como ejemplos de principios activos de dichos insecticidas y acaricidas, se incluyen:

(1) Compuestos piretroides sintéticos:

35 acrinatrina, aletrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, empentrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofén, teflutrina, tralometrino, transflutrina, tetrametrina, fenotrino, cifenotrino, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, lambda-cihalotrino, gamma-cihalotrino, furametrino, tau-fluvalinato, metoflutrina, carboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbencil=2,2-dimetil-3-(1-propenil)ciclopropano, carboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-

40 (metoximetil)bencil=2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropano, carboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencil=2,2,3,3-tetrametilciclopropano, etc.

(2) Compuestos de fósforo orgánico:

45 acefato, fosfuro de aluminio, butatíofós, cadusafós, cloretoxifós, clorfenvinfós, clorpirifós, clorpirifós-metilo, cianofós: CYAP, diazinón, DCIP (éter diclorodiisopropílico), diclofentión:ECP, diclorvós: DDVP, dimetoato, dimetilvinfós, disulfotón, EPN, etión, etoprofós, etrimfós, fentión:MPP, fenitrotión: MEP, fostiazato, formotión, fosfuro de hidrógeno, isofenfós, isoxatión, malatión, mesulfenfós, metidatión:DMTP, monocrotofós, naled:BRP, oxideprofós:ESP, paratión, fosadona, fosmet:PMP, pirimifós-metilo, piridafentión, quinalfós,

50 fentoato:PAP, profenfós, propafós, protiofós, piraclorfós, salitión, sulprofós, tebupirimfós, temefós, tetraclorvinfós, terbufós, tiometón, triclorfón:DEP, vamidotión, forato, cadusafós, etc.

(3) Compuestos carbamato:

55 alanicarb, bendiocarb, benfurcarb, BPMC, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb:MIPC, metolcarb, metomilo, metiocarb, NAC, oxamilo, pirimicarb, propoxur:PHC, XMC, tiodicarb, xililcarb, aldicarb, etc.

(4) Compuestos nereistoxina:

60 cartap, bensultap, tiociclam, monosultap, bisultap, etc.

(5) Compuestos neonicotinoides:

65 imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, dinotefurán, clotianidina, etc.

## (6) Compuestos benzoilurea:

clorfluazurón, bistriflurón, diafentiurón, diflubenzurón, fluazurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón, triflumurón, triazurón, etc.

## (7) Compuestos fenilpirazol:

acetoprol, etiprol, fipronilo, vaniliprol, pirirol, pirafluprol, etc.

## (8) Insecticidas de toxina Bt:

Esporas vivas derivadas de, y toxinas cristalinas producidas por, *Bacillus thuringiensis* y una mezcla de las mismas.

## (9) Compuestos hidrazina:

cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, etc.

## (10) Compuestos de cloro orgánico:

aldrina, dieldrina, dienoclor, endosulfano, metoxiclor, etc.

## (11) Insecticidas naturales:

aceite de máquinas, sulfato de nicotina.

## (12) Otros insecticidas:

avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciromazina, D-D (1,3-dicloropropeno), benzoato de emamectina, fenazaquina, flupirazofós, hidropreno, metopreno, indoxacarb, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetrozina, piridalilo, piriproxifén, espinosad, sulfluramid, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, lepimectina, ácido arsénico, benclotiaz, cianamiduro de calcio, polisulfuro de calcio, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamid, flurimfén, formetanato, metam-amonio, metam-sodio, bromuro de metilo, oleato de potasio, protrifenbuto, espiromesifén, azufre, metaflumizona, espirotetramat, pirfluquinazona, espinetoram, clorantraniliprol, tralopirilo, etc.

Como ejemplos del principio activo del repelente, se incluyen N,N-dietil-m-toluamida, limoneno, linalool, citronelal, mentol, mentona, hinokitiol, geraniol, eucaliptol, indoxacarb, carano-3,4-diol, MGK-R-326, MGK-R-874 y BAYKBR-3023.

Como ejemplos del principio activo del sinergista, se incluyen 5-[2-(2-butoxi)etoximetil]-6-propil-1,3-benzodioxol, N-(2-etilhexil)biciclo[2.2.1]hept-5-eno-2,3-dicarboxiimida, éter octaclorodipropílico, ácido tiocianoacético isobornilo, N-(2-etilhexil)-1-isopropil-4-metilbiciclo[2.2.2]oct-5-eno-2,3-dicarboxiimida.

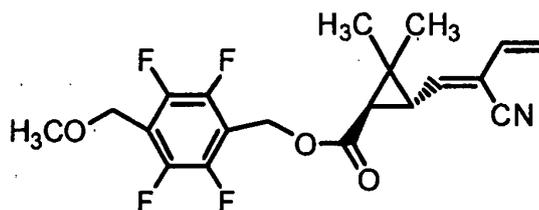
**Ejemplos**

De aquí en adelante, se describirá la presente invención con más detalle por medio de Ejemplos de Producción, Ejemplos de Formulación y Ejemplos de Ensayo, pero la presente invención no se limita a ellos.

En primer lugar, se describirán Ejemplos de Producción del compuesto de la presente invención.

**Ejemplo de Producción 1**

A una solución en cloroformo (10 ml) de alcohol 4-metoximetil-2,3,5,6-tetrafluorobencílico (594 mg, 2,65 mmol) y ácido (1R)-trans-3-[(1Z)-2-ciano-1,3-butadienil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxílico (478 mg, 2,50 mmol), se le añadieron clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (516 mg, 2,70 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (15 mg). Después de agitar a temperatura ambiente durante 3 horas, se vertió agua en la solución de reacción y se extrajo la solución con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio y se concentró después en condiciones de presión reducida, y se sometió el residuo a cromatografía en columna de gel de sílice, para obtener 771 mg de carboxilato de 4-metoximetil-2,3,5,6-tetrafluorobencil=(1R)-trans-3-[(1Z)-2-ciano-1,3-butadienil]-2,2-dimetilciclopropano (al que en adelante se hará aquí referencia como el compuesto (1) de la presente invención), representado por la siguiente fórmula:



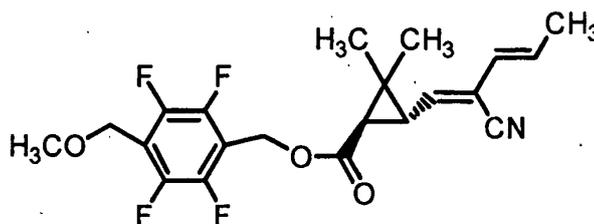
Líquido amarillo claro:  $^1\text{H-RMN}$  ( $\text{CDCl}_3, \text{TMS}$ )  $\delta$  (ppm): 1,21 (s,3H), 1,35 (s,3H), 1,81 (d,1H), 2,54 (m, 1H), 3,41 (s,3H), 4,58 (d,2H); 5,26 (s,2H), 5,28 (d, 1H), 5,56 (d, 1H), 5,95 (d, 1H), 6,24 (dd, 1H).

5

### Ejemplo de Producción 2

Se disolvió alcohol 4-metoximetil-2,3,5,6-tetrafluorobencílico (560 mg, 2,50 mmol) en tetrahidrofurano (10 ml) y se añadieron 0,35 ml de piridina. Se añadió a la solución una solución en tetrahidrofurano (5 ml) de cloruro del ácido (1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxílico (Z/E = 85/15) (570 mg, 2,55 mmol) enfriando con hielo. Después de agitar a temperatura ambiente durante 12 horas, se vertió agua en la solución de reacción y se extrajo la solución con acetato de etilo. Se lavó la capa orgánica por turnos con ácido clorhídrico al 5%, bicarbonato de sodio saturado, agua y solución salina acuosa saturada y se secó después sobre sulfato de magnesio. Tras concentración en condiciones de presión reducida, se sometió el residuo a cromatografía en columna de gel de sílice, para obtener 760 mg de carboxilato de 4-metoximetil-2,3,5,6-tetrafluorobencil=(1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropano (al que en adelante se hará aquí referencia como el compuesto (2) de la presente invención), representado por la siguiente fórmula:

15



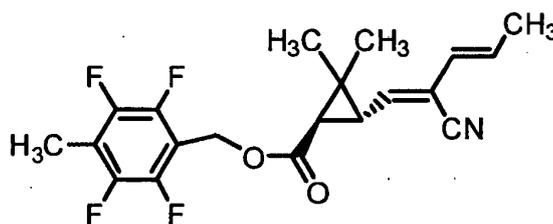
20

Líquido incoloro:  $^1\text{H-RMN}$  ( $\text{CDCl}_3, \text{TMS}$ )  $\delta$  (ppm): 1,21 (s,3H), 1,34 (s,3H), 1,75 (d, 1H, J=5,6 Hz), 1,82 (d,3H, J=6,8 Hz), 2,52 (dd, 1H, J=9,5, 5,3 Hz), 3,40 (s, 3H), 4,58 (s,2H), 5,25 (s,2H), 5,79 (d,1H), 5,95 (d,1H), 6,10 (m, 1H).

Se describirán a continuación ejemplos específicos del compuesto de la presente invención.

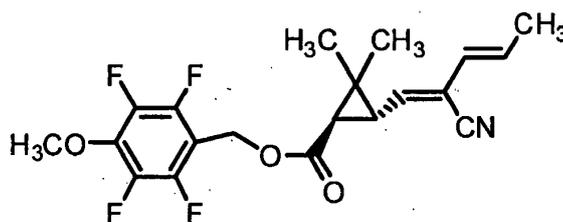
25

Carboxilato de 4-metil-2,3,5,6-tetrafluorobencil=(1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropano representado por la siguiente fórmula:



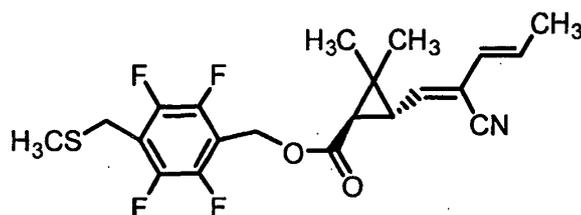
30

Carboxilato de 4-metoxi-2,3,5,6-tetrafluorobencil=(1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropano representado por la siguiente fórmula:



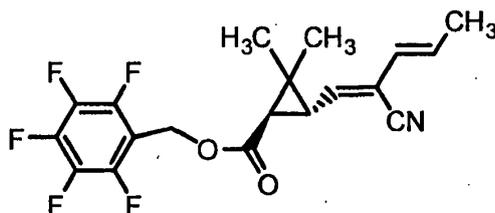
35

Carboxilato de 4-metiltiometil-2,3,5,6-tetrafluorobencil=(1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropano representado por la siguiente fórmula:



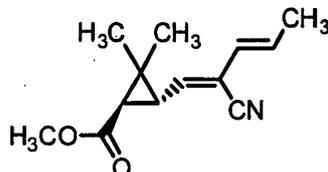
Carboxilato de 2,3,4,5,6-pentafluorobencil=(1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropano representado por la siguiente fórmula:

5



#### Ejemplo de Producción de Referencia 1

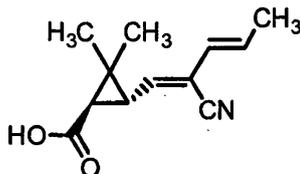
- 10 Se añadieron carboxilato de metil=(1R)-trans-3-formil-2,2-dimetilciclopropano (2,53 g, 16,2 mmol), 3-pentenitrilo (1,90 g, 23,5 mmol) y carbonato de potasio anhidro (3,22 g, 23,3 mmol) a 30 ml de N,N-dimetilformamida y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 24 horas. Se añadió la solución de reacción a 100 ml de agua helada y se extrajo la solución dos veces con 100 ml cada una de acetato de etilo. Se combinaron las capas obtenidas de acetato de etilo, se lavaron una vez con 50 ml de solución salina acuosa saturada y se secaron después sobre sulfato de magnesio. Tras concentración en condiciones de presión reducida, se sometió el residuo a cromatografía en columna de gel de sílice, para obtener 0,94 g de carboxilato de metil=(1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropano, representado por la siguiente fórmula:



- 20 Líquido incoloro:  $^1\text{H-RMN}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 1,22 (s,3H), 1,35 (s,3H), 1,75 (d,1H,J = 5,2 Hz), 1,82 (d,3H,J = 5,2 Hz), 2,5 (m,1H,J = 10,0,5,2 Hz), 3,7 (s, 3H), 5,82 (d,1H,J = 10,0 Hz), 5,96 (d,1H,J = 16,8 Hz), 6,10 (m,1H).

#### Ejemplo de Producción de Referencia 2

- 25 Se disolvió carboxilato de metil=(1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropano (502 mg, 2,29 mmol) en un líquido mixto de 3 ml de metanol y 1 ml de agua y se añadió entonces hidróxido de potasio (300 mg, 5,36 mmol) y se agitó la solución mixta a temperatura ambiente durante 24 horas. Se añadió la solución de reacción a 20 ml de agua helada y se extrajo la solución con 20 ml de acetato de etilo. Se añadió a la capa acuosa obtenida ácido clorhídrico al 5% hasta que el pH se hizo de 2 y se extrajo luego la solución con 30 ml de acetato de etilo. Se lavó la capa de acetato de etilo dos veces con 20 ml de solución salina acuosa saturada y se secó después sobre sulfato de magnesio. Tras concentración en condiciones de presión reducida, se obtuvieron 452 mg de ácido (1R)-trans-3-[(1Z,3E)-2-ciano-1,3-pentadienil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxílico, representado por la siguiente fórmula:

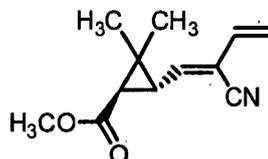


- 35 Líquido incoloro:  $^1\text{H-RMN}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 1,23 (s,3H), 1,38 (s,3H), 1,76 (d,1H,J = 5,2 Hz), 1,82 (d,3H,J = 6,4 Hz), 2,54 (dd,1H,J = 10,0, 5,2 Hz), 5,82 (d,1H,J = 10,0 Hz), 5,97 (d,1H,J = 15,6 Hz), 6,11 (m,1H).

#### Ejemplo de Producción de Referencia 3

40 Se añadieron carboxilato de metil=(1R)-trans-3-formil-2,2-dimetilciclopropano (2,53 g, 16,2 mmol), 3-butenonitrilo

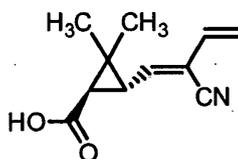
(3,62 g, 54,0 mmol) y carbonato de potasio anhidro (3,22 g, 23,3 mmol) a 30 ml de N,N-dimetilformamida y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 24 horas. Se añadió la solución de reacción a 100 ml de agua helada y se extrajo la solución dos veces con 100 ml cada una de acetato de etilo. Se combinaron las capas de acetato de etilo, se lavaron una vez con 50 ml de solución salina acuosa saturada y se secaron después sobre sulfato de magnesio. Tras concentración en condiciones de presión reducida, se sometió el residuo a cromatografía en columna de gel de sílice, para obtener 0,37 g de carboxilato de metil=(1R)-trans-3-[(1Z)-2-ciano-1,3-butadienil]-2,2-dimetilciclopropano, representado por la siguiente fórmula:



Líquido incoloro:  $^1\text{H-RMN}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 1,24 (s,3H), 1,335 (s,3H), 1,81 (d,1H,J = 5,2 Hz), 2,4 (dd,1H,J = 10,4, 5,2 Hz), 3,71 (s, 3H), 5,30 (d,1H,J = 10,8 Hz), 5,61 (d,1H,J = 17,2 Hz), 5,98 (d, 1H,10,4 Hz), 6,26 (dd,1H,J = 10,4, 17,2 Hz).

#### 15 Ejemplo de Producción de Referencia 4

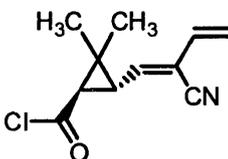
Se disolvió carboxilato de metil=(1R)-trans-3-[(1Z)-2-ciano-1,3-butadienil]-2,2-dimetilciclopropano (483 mg, 2,36 mmol) en un líquido mixto de 3 ml de tetrahidrofurano y 1 ml de agua y se añadió luego hidróxido de potasio (215 mg, 3,84 mmol), y se agitó la solución a temperatura ambiente durante 24 horas. Se añadió la solución de reacción a 20 ml de agua helada y se extrajo la solución con 20 ml de acetato de etilo. Se añadió a la capa acuosa obtenida ácido clorhídrico al 5% hasta que el pH se hizo de 2 y se extrajo entonces la solución con 30 ml de acetato de etilo. Se lavó la capa de acetato de etilo dos veces con 20 ml de solución salina acuosa saturada y se secó después sobre sulfato de magnesio. Tras concentración en condiciones de presión reducida, se obtuvieron 440 mg de ácido (1R)-trans-3-[(1Z)-2-ciano-1,3-butadienil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxílico, representado por la siguiente fórmula:



Líquido incoloro:  $^1\text{H-RMN}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta$  (ppm): 1,25 (s,3H), 1,38 (s,3H), 1,82 (d,1H,J = 5,2 Hz), 2,56 (dd,1H,J = 10,4, 5,2 Hz), 5,32 (d,1H,J = 10,8 Hz), 5,62 (d,1H,J = 17,2 Hz), 6,01 (d, 1H,10,4 Hz), 6,25 (dd,1H, J = 10,4,17,2 Hz).

#### 30 Ejemplo de Producción de Referencia 5

Se disolvió ácido (1R)-trans-3-[(1Z)-2-ciano-1,3-butadienil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxílico (440 mg, 2,30 mmol) en 3 ml de tetrahidrofurano y se añadieron luego cloruro de tionilo (301 mg, 2,53 mol) y 10 mg de N,N-dimetilformamida y se agitó la solución a temperatura ambiente durante 1 hora, y luego a 60°C durante 3 horas. Se concentró la solución de reacción en condiciones de presión reducida, para obtener 460 mg de cloruro del ácido (1R)-trans-3-[(1Z)-2-ciano-1,3-butadienil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxílico, representado por la siguiente fórmula:



40 como un líquido amarillo claro.

A continuación se muestran Ejemplos de Formulación. Las partes son en masa.

#### 45 Ejemplo de Formulación 1

Se disuelven 20 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención en 65 partes de xileno y se añaden 15 partes de SOLPOL 3005X (una marca registrada de TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) y se mezclan bien con agitación, para obtener concentrados emulsionables.

**Ejemplo de Formulación 2**

5 Se añaden 5 partes de SORPOL 3005X a 40 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención y se mezcla bien la mezcla, y se añaden 32 partes de CARPLEX #80 (óxido de silicio hidratado sintético, una marca registrada de SHIONOGI & CO., LTD.) y 23 partes de tierra de diatomeas de 300 de malla, seguido de mezcla con agitación mediante una mezcladora, para obtener polvos hidratables.

**Ejemplo de Formulación 3**

10 Se pulveriza y mezcla bien una mezcla de 1,5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención, 1 parte de TOKUSIL GUN (óxido de silicio hidratado sintético, fabricado por Tokuyama Corporation), 2 partes de REAX 85A (ligninsulfonato de sodio, fabricado por West Vaco Chemicals), 30 partes de BENTONITE FUJI (bentonita, fabricada por Houjun) y 65,5 partes de arcilla SHOUKOUZAN A (arcilla de caolín, fabricada por Shoukouzan Kougyousho) y se añade agua. Se amasa bien la mezcla, se granula mediante una granuladora de extrusión y se seca después, para obtener un 1,5% de gránulos.

**Ejemplo de Formulación 4**

20 A una mezcla de 10 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención, 10 partes de fenilxilietano y 0,5 partes de SUMIDUR L-75 (tolilendiisocianato, fabricado por Sumitomo Bayer Urethane Co., Ltd.) se le añaden 20 partes de una solución acuosa al 10% de goma arábica y se agita la mezcla con un a homomezcladora, para obtener una emulsión que tiene un diámetro medio de partícula de 20 µm. Se añaden a la emulsión 2 partes de etilenglicol y se vuelve a agitar la mezcla en un baño caliente a una temperatura de 60°C durante 24 horas, para obtener una suspensión de microcápsulas. Por otro lado, se dispersan 0,2 partes de goma xantana y 1,0 parte de VEEGUM R (silicato de aluminio y magnesio, fabricado por Sanyo Chemical Industries, Ltd.) en 56,3 partes de agua de intercambio de iones, para obtener una solución espesante. Se mezclan entonces 42,5 partes de la suspensión de microcápsulas antes mencionada y 57,5 partes de la solución espesante antes mencionada, para obtener microcápsulas.

**Ejemplo de Formulación 5**

30 Se añade una mezcla de 10 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención y 10 partes de fenilxilietano a 20 partes de una solución acuosa al 10% de polietilenglicol y se agita la mezcla mediante una homomezcladora, para obtener una emulsión que tiene un diámetro medio de partícula de 3 µm. Por otro lado, se dispersan 0,2 partes de goma xantana y 1,0 parte de VEEGUM R (silicato de aluminio y magnesio, fabricado por Sanyo Chemical Industries, Ltd.) en 58,8 partes de agua de intercambio de iones, para obtener una solución espesante. Se mezclan entonces 40 partes de la emulsión antes mencionada y 60 partes de la solución espesante antes mencionada, para obtener formulaciones fluidas.

**Ejemplo de Formulación 6**

40 A 5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención, se les añaden 3 partes de CARPLEX #80 (óxido de silicio hidratado sintético, una marca registrada de SHIONOGI & CO., LTD.), 0,3 partes de PAP (una mezcla de fosfato de monoisopropilo y fosfato de diisopropilo) y 91,7 partes de talco (300 de malla) y se agita la mezcla mediante una mezcladora, para obtener polvos.

**Ejemplo de Formulación 7**

50 Se disuelve 0,1 parte de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención en 10 partes de diclorometano y se mezcla la solución con 89,9 partes de queroseno desodorizado, para obtener soluciones oleosas.

**Ejemplo de Formulación 8**

55 Se mezclan y disuelven 0,1 parte de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención y 39,9 partes de queroseno desodorizado y se carga la solución en un recipiente aerosol y se instala una porción de válvula. Se cargan entonces 60 partes de propulsor de potencia (gas de petróleo licuado) bajo presión a través de la porción de válvula, para obtener formulaciones aerosol de base oleosa.

**Ejemplo de Formulación 9**

60 Se mezclan y disuelven 0,6 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención, 5 partes de xileno, 3,4 partes de queroseno desodorizado y 1 parte de Reodol MO-60 (emulsor, una marca registrada de Kao Corporation) y se cargan la solución y 50 partes de agua en un recipiente aerosol, y luego se cargan 40 partes de propulsor de potencia (gas de petróleo licuado) bajo presión a través de una porción de válvula, para obtener formulaciones aerosol acuosas.

65

**Ejemplo de Formulación 10**

5 Se disuelven 0,3 g de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención en 20 ml de acetona y se mezcla uniformemente la solución con agitación con 99,7 g de un material de base para un serpentín (obtenido mezclando polvo Tabu, Pyrethrum marc y polvo de madera en una proporción de 4:3:3). Se añaden luego 100 ml de agua y se amasa bien la mezcla, se seca y se moldea, para obtener serpentines insecticidas.

**Ejemplo de Formulación 11**

10 Se disuelve una mezcla de 0,8 g de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención y 0,4 g de butóxido de piperonilo en acetona y se ajusta el volumen total a 10 ml. Se impregnan entonces 0,5 ml de esta solución de manera uniforme en un material de base para una esterilla insecticida para calentamiento eléctrico (una placa obtenida endureciendo fibrillas de una mezcla de pelusas de algodón y pulpa) que tiene un tamaño de 2,5 cm × 1,5 cm y un grosor de 0,3 cm, para obtener esterillas insecticidas para calentamiento eléctrico.

**Ejemplo de Formulación 12**

15 Se vierte una solución obtenida disolviendo 3 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención en 97 partes de queroseno desodorizado en un recipiente hecho de cloruro de vinilo. Se inserta un núcleo absorbente de líquido cuya parte superior puede ser calentada mediante un calentador (se endurece un polvo pulverizado inorgánico con un ligante y se sinteriza), para obtener partes para uso en un aparato de transpiración térmica de tipo núcleo absorbente de líquidos.

**Ejemplo de Formulación 13**

20 Se disuelven 100 mg de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención en una cantidad apropiada de acetona y se impregna la solución en una placa cerámica porosa que tiene un tamaño de 4,0 cm × 4,0 cm y un grosor de 1,2 cm, para obtener fumigadores térmicos.

**Ejemplo de Formulación 14**

25 Se disuelven 100 µg de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención en una cantidad apropiada de acetona y se aplica uniformemente la solución a papel de filtro que tiene un tamaño de 2 cm × 2 cm y un grosor de 0,3 mm, y se seca al aire para eliminar la acetona, y de este modo se obtienen agentes volátiles para uso a temperatura ambiente.

**Ejemplo de Formulación 15**

30 Se mezclan 10 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (2) de la presente invención, 35 partes de carbón blanco que contiene 50 partes de una sal de amonio de polioxietilén alquil éter sulfato y 55 partes de agua y se trituran luego finamente mediante un método de trituración húmeda, para obtener formulaciones al 10%.

35 A continuación, se demostrará mediante Ejemplos de Ensayo que el compuesto de la presente invención es efectivo como principio activo de un agente para el control de plagas.

**Ejemplo de Ensayo 1**

40 Se disolvió cada uno de los compuestos (1) y (2) de la presente invención (0,00625 partes) producidos en los Ejemplos de Producción antes mencionados en 10 partes de diclorometano y se mezcló la solución resultante con 89,99375 partes de un solvente de isoparafina (Isper M, marca registrada de Exxon Chemical Company), para preparar una solución oleosa al 0,00625% (p/v).

45 Se liberaron diez moscas domésticas (mechos y hembras, 5 de cada) en una cámara cúbica que tenía una longitud de lado de 70 cm y se pulverizaron luego 0,7 ml del compuesto (1) de la presente invención a través de una pequeña ventana en una entrada de la cámara usando una pistola pulverizadora (presión de pulverización: 0,9 kg/cm<sup>2</sup>). Se contó el número de moscas derribadas después de transcurrido un tiempo dado desde que se completó la pulverización y se determinó el índice de derribo (índice KD) (se repitió dos veces). Se realizó la prueba del mismo modo, excepto por usar el compuesto (2) de la presente invención en lugar del compuesto (1) de la presente invención, y se determinó luego el índice de derribo después de un tiempo dado (se repitió dos veces).

60 Los resultados son mostrados en la Tabla 1.

Tabla 1

Compuesto de ensayo	Índice de derribo (%) después de 7 minutos
Compuesto (1) de la presente invención	100
Compuesto (2) de la presente invención	100

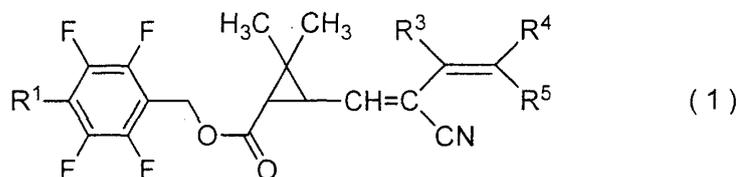
**Aplicabilidad industrial**

5

El compuesto de la presente invención tiene un excelente efecto de control de plagas y es, por lo tanto, útil como principio activo de un agente para el control de plagas.

## REIVINDICACIONES

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



donde R<sup>1</sup> representa hidrógeno, flúor, C1-C4 alquilo, C1-C4 alcoxi, C1-C4 alcoximetilo o C1-C4 alquiltiometilo; R<sup>3</sup> representa hidrógeno o metilo; R<sup>4</sup> representa hidrógeno o C1-C4 alquilo, y R<sup>5</sup> representa hidrógeno o C1-C4 alquilo.

2. El compuesto éster según la reivindicación 1, donde la configuración relativa del sustituyente en la posición 1 del anillo de ciclopropano y del sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es una configuración trans en la fórmula (1).

3. El compuesto éster según la reivindicación 1 ó 2, donde la configuración absoluta de la posición 1 del anillo de ciclopropano es la configuración R en la fórmula (1).

4. El compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde la configuración relativa del sustituyente de la posición 1' existente sobre el sustituyente en la posición 3 del anillo de ciclopropano es la configuración Z en la fórmula (1).

5. El compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, donde R<sup>3</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

6. El compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, donde R<sup>4</sup> es hidrógeno o metilo en la fórmula (1).

7. El compuesto éster según la reivindicación 6, donde R<sup>4</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

8. El compuesto éster según la reivindicación 6, donde R<sup>4</sup> es metilo en la fórmula (1).

9. El compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, donde R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

10. El compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, donde

- (i) R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>4</sup> es hidrógeno en la fórmula (1); o
- (ii) R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>4</sup> es metilo en la fórmula (1); o
- (iii) R<sup>3</sup> es hidrógeno y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

11. El compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, donde

- (i) R<sup>4</sup> es hidrógeno y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1); o
- (ii) R<sup>4</sup> es metilo y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

12. El compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, donde

- (i) R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es hidrógeno y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1); o
- (ii) R<sup>3</sup> es hidrógeno, R<sup>4</sup> es metilo y R<sup>5</sup> es hidrógeno en la fórmula (1).

13. El compuesto éster según la reivindicación 1, donde R<sup>1</sup> es metoximetilo en la fórmula (1).

14. Un agente para el control de plagas que comprende el compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 y un soporte inerte.

15. Un método de control de plagas, que incluye una etapa de aplicación de una cantidad efectiva del compuesto éster según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 a las plagas o al hábitat de las plagas.

16. Un método de control de plagas según la reivindicación 15, donde las plagas son cucarachas.

17. El método de control de plagas según la reivindicación 16, donde la cucaracha es la cucaracha americana (*Periplaneta Americana*) o la cucaracha alemana (*Blattella germanica*).

18. Un método de control de plagas según cualquiera de las reivindicaciones 15 a 17, donde la aplicación del compuesto éster es realizada por pulverización.