(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 560 879**

(51) Int. CI.:

C07D 401/04 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 33/02 (2006.01)
A61P 33/06 (2006.01)
A61P 33/10 (2006.01)
A61P 33/12 (2006.01)
A61P 33/14 (2006.01)

(12) TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA T3

(96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.02.2005 E 10009628 (8)**

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.01.2016 EP 2256112**

(54) Título: **Antranilamidas, proceso para la producción de las mismas y controladores de plagas que contienen las mismas**

(30) Prioridad:

18.02.2004 JP 2004041295
28.04.2004 JP 2004133722
08.09.2004 JP 2004261507
08.10.2004 JP 2004295778

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
23.02.2016

(73) Titular/es:

ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD. (100.0%)
3-15 Edobori 1-chome Nishi-ku
Osaka-shi, Osaka 550-0002, JP

(72) Inventor/es:

KOYANAGI, TORI;
MORITA, MASAYUKI;
NAKAMOTO, KENISHI y
HISAMATSU, AKIHIRO

(74) Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

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

Antranilamidas, proceso para la producción de las mismas y controladores de plagas que contienen las mismas

Campo técnico

Los documentos de patente 1, 2, 3 y 4, respectivamente, describen compuestos de antranilamida que tienen determinadas estructuras químicas específicas. No obstante, en ninguna parte de dichos documentos de patente se divulgan compuestos que tengan un alquilo sustituido con cicloalquilo de C_{3-4} como sustituyente correspondiente a A en la fórmula (I) que se menciona más adelante en la presente invención.

Adicionalmente, en el documento de patente 5 se divulgan compuestos de antranilamida que tienen un grupo ciano en la posición 4 del anillo de benceno. No obstante, en la definición de R^1 de la fórmula (I) que se menciona a continuación de la presente invención no está contenido un grupo ciano, y las estructuras químicas correspondientes son diferentes.

Documento de patente 1: Publicación internacional WO03/24222
Documento de patente 2: Publicación internacional WO03/15518
Documento de patente 3: Publicación internacional WO03/15519
Documento de patente 4: Publicación internacional WO01/70671
Documento de patente 5: Publicación internacional WO04/67528

Divulgación de la invención

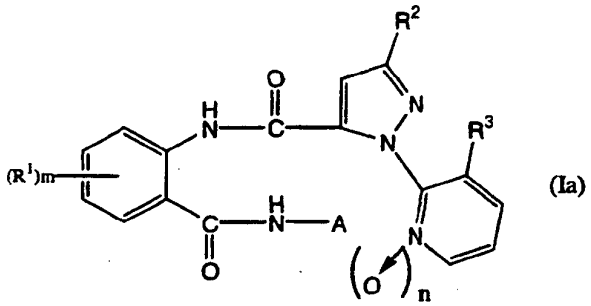
Problemas que se resuelven con la invención

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

Medios para resolver los problemas

Los presentes inventores han llevado a cabo diversos estudios sobre compuestos de antranilamida en un esfuerzo por encontrar un plaguicida superior. Como resultado de ello, han descubierto que un nuevo compuesto de antranilamida o una sal del mismo tienen un efecto plaguicida extremadamente alto contra plagas a una dosis baja, y han completado la presente invención. A saber, la presente invención se refiere a un compuesto de antranilamida representado por la fórmula (I) o su sal:

(18) Un compuesto de la fórmula (I), que está representado por la fórmula (Ia):



donde R^1 es halógeno o alquilo; cada uno de R^2 y R^3 es halógeno o $-CF_3$; A es alquilo sustituido con Y; Y es cicloalquilo C_{3-4} que puede estar sustituido con halógeno o alquilo;
m es 1 o 2; y n es 0 o 1.
Nitro o formilo sustituido; cada uno de R^2 y R^3 que son un proceso para su producción; y un plaguicida que lo contiene.

Efectos de la invención

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

Mejor modo para realizar la invención

Como halógeno o halógeno como el sustituyente en R^1, R^2, R^3 o Y, se puede mencionar un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo. El número de halógenos como sustituyentes puede ser 1 o más y, su es más, los respectivos halógenos pueden ser iguales o diferentes. Adicionalmente, las posiciones para la sustitución de dichos halógenos pueden ser cualquier posición.

El alquilo o resto alquilo en R^1, R^2, R^3, A o Y puede ser lineal o ramificado. Como su ejemplo específico, se puede mencionar alquilo C_{1-6} tal como metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, terc-butilo, pentilo o hexilo.

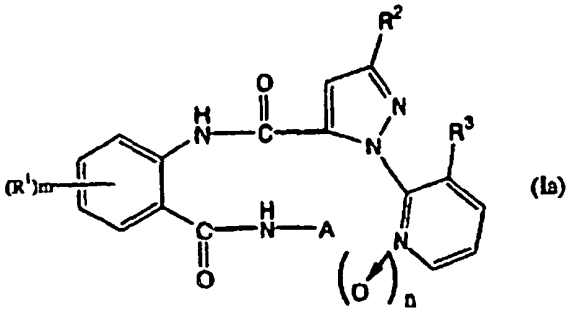
Como ejemplo específico de cicloalquilo C_{3-4} o resto cicloalquilo en Y, y ciclopropilo es particularmente preferido.

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

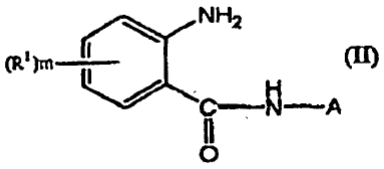
El compuesto de antranilamida de fórmula (I) puede tener isómeros ópticos o isómeros geométricos, y dichos isómeros y mezclas de los mismos quedan incluidos en la presente invención. Adicionalmente, en la presente invención, dentro del alcance del conocimiento habitual en este campo técnico se pueden incluir diversos isómeros distintos a los mencionados anteriormente. Adicionalmente, dependiendo del tipo de dicho isómero, la estructura química puede ser diferente de la fórmula (I) mencionada anteriormente, pero es obvio para un experto en la técnica que una estructura de este tipo está en relación isomérica y, por tanto, entra dentro del alcance de la presente invención.

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

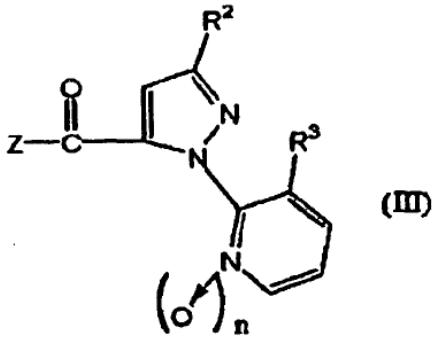
[A]



que comprende (1) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (II);



donde R^1, A y m son como se ha definido anteriormente, con un compuesto representado por la fórmula (III):



(III)

donde R^2, R^3, y n son como se han definido antes, y Z es un átomo de cloro, -OH o un alcoxi de C_{1-4}, (IV);

En el caso donde Z es un átomo de cloro, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de una base.

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

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

En el caso donde Z sea un átomo de cloro, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente a entre -20 y +60 ºC, preferiblemente a entre 0 y 30 ºC. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 1 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 2 y 12 horas.

En el caso donde Z sea -OH, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de un agente de deshidratación condensación y un disolvente.

El agente de deshidratación condensación puede consistir por ejemplo en una carbodimida, como N,N'-diciclohexilcarbodimida, 1,3-diisopropilcarbodiimida, o clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida, u otros como 1,1'-carbonil-bis-1H-imidazol, diclorofosfato de fenilo, fosforocianidato de dietilo, 1,3,5-triaza-2,4,6-trifosforin-2,2,4,4,6,6-hexacloruro, cloruro cianúrico, cloroformiato de isobutilo, isocianato de clorosulfonilo o anhídrido trifluoroacético.

El disolvente puede ser cualquier disolvente siempre y cuando sea inerte para la reacción. Por ejemplo, se pueden seleccionar adecuadamente uno o más tipos para su uso entre un éter como éter dietílico, éter butil etílico, tetrahidrofurano, dioxano o dimetoxietano; un hidrocarburo halogenado como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano, tricloroetano o dicloroetileno; un hidrocarburo aromático como benceno, tolueno o xileno; un disolvente aprótico dipolar como acetonitrilo, propionitrilo, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, triamida hexametilfosfórica, sulfolano, dimetilacetamida o N-metilpirrolidona; un éster como acetato de metilo, acetato de etilo o acetato de propilo; una cetona como acetona, dietil cetona, metil etil cetona o metil isobutil cetona; un hidrocarburo alifático como pentano, hexano, heptano, octano o ciclohexano.

En el caso de que Z sea -OH, se puede llevar a cabo la reacción (A) normalmente a entre -20 y +60 ºC, preferiblemente entre 0 y 30 ºC. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 12 horas.

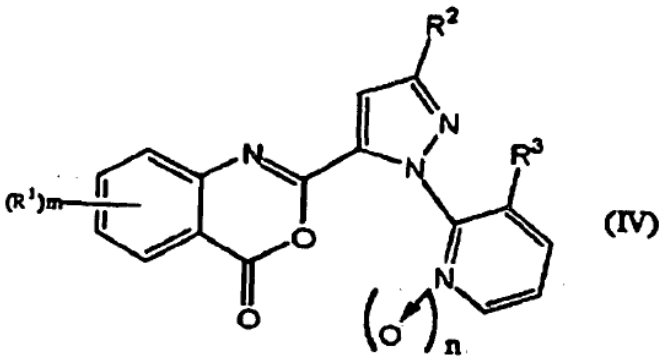
En el caso de que Z sea alcoxi de C_{1-4}, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de una base y un disolvente. Como base, se puede seleccionar adecuadamente una o más tipos para su uso por ejemplo

entre un hidruro de metal alcalino como hidruro sódico o hidruro potásico; un alcóxido de metal alcalino como metóxido sódico, etóxido sódico o terc-butóxido potásico; y una amina terciaria como trimetilamina, trietilamina, triisopropilamina, diisopropiletilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina, 2,6-dimetilpiridina, 4-pirrolidinpiridina, N-metil morfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, N-etil-N-metilanilina, 1,8-diazabiciclo[5.4.0]-7-undeceno o 1,4-diazabiciclo[2.2.2]octano. La base se puede utilizar en una cantidad comprendida entre 1 y 5 veces más por mol, preferiblemente entre 1 y 2,5 veces más por mol del compuesto de fórmula (II).

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

En el caso donde Z sea alcoxi de C_{1-4}, la reacción (A) se puede llevar a cabo normalmente a entre 0 y 120 ºC, preferiblemente entre 20 y 80 ºC. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 12 horas.

El compuesto de la fórmula (II) o (III) anteriores puede consistir en un compuesto conocido o se puede producir con arreglo a los materiales de referencia conocidos. Por ejemplo, se puede producir el compuesto de fórmula (II) a través o de acuerdo con el método descrito en Synthesis, 1980, p. 505. El compuesto de fórmula (III) puede producirse a través, o con arreglo al método descrito en los esquemas 9 a 22 del documento WO 03/24222.
[B] hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IV)



(IV)

donde R^1, R^2, R^3, m, n y q son como se han definido anteriormente, con un compuesto representado por la fórmula (V): A-NH2, donde A es como se ha definido anteriormente.

R^1, R^2, R^3, A, m, n y q son como se han definido anteriormente.

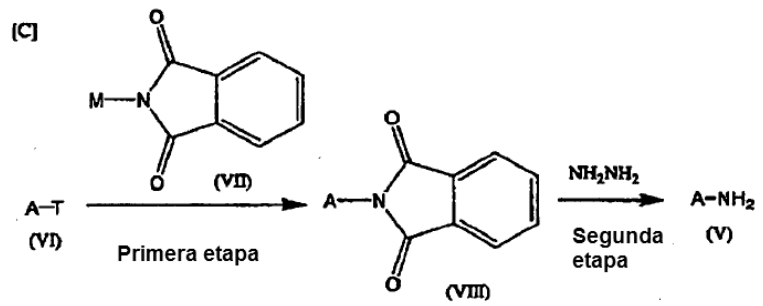
La reacción (B) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de un disolvente.

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

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

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

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



En la reacción (C), A se define como anteriormente y T es un halógeno, $-OSO_2G$ (G es un radical sulfonato) o -OH. Cuando T es halógeno u $-OSO_2G$, M es sodio o potasio, y cuando T es -OH, M es un átomo de hidrógeno. El resto sulfonato mencionado puede ser, por ejemplo, un alquilo de C_{1-6}, como metilo o etilo; o fenilo que puede estar sustituido con un alquilo de C_{1-6}.

En el caso donde T sea halógeno u $-OSO_2G$ y M sea sodio o potasio, la primera etapa de la reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente en presencia de un disolvente.

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

En el caso donde T sea halógeno u $-OSO_2G$ y M sea sodio o potasio, la primera etapa de la reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente a entre 0 y 150 ºC, preferiblemente entre 30 y 110 ºC. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 12 horas.

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

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

En el caso donde T sea -OH y M un átomo de hidrógeno, la primera etapa de reacción (C) se puede llevar a cabo normalmente a una temperatura comprendida entre 0 y 80 ºC, preferiblemente entre 20 y 60 ºC. El tiempo de reacción está comprendido normalmente entre aproximadamente 0,5 y 24 horas, preferiblemente entre aproximadamente 1 y 16 horas.

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

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

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

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

Los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención son útiles como insecticidas, acaricidas, nematicidas y plaguicidas para el suelo, y resultan efectivos para controlar ácaros parásitos de las plantas, como arañuela roja (Tetranychus urticae), arañuela carmín (Tetranychus cinnabarinus), araña Kanzawa (Tetranychus kanzawai), ácaro rojo de los cítricos (Panonychus citri), ácaro rojo europeo (Panonychus ulmi), ácaro ancho (Polyphagotarsonemus latus), ácaro de la roña de cítricos rosa (Aculops pelekassi), ácaro del bulbo (Rhizoglyphus echinopus), plagas de insectos agrícolas como palomilla dorso de diamante (Plutella xylostella), noctuido de la col (Mamestra brassicae), gusano gris del tabaco (Spodoptera litura), piral del manzano (Laspeyresia pomonella), gusano bellotero (Heliothis zea), gusano tabacalero (Heliothis virescens), palomilla gitana (Lymantria dispar), gusano doblador de hojas (Cnaphalocrocis medinalis), Adoxophyes sp. tortrix de frutas de hueso (Adoxophyes orana fasciata), polilla del melocotón (Carposina niponensis), polilla oriental del melocotonero (Grapholita molesta), gusano cortador (Agrotis ipsilon), gusano gris (Agrotis segetum), escarabajo rayado de la papa (Leptinotarsa decemilineata), escarabajo de las hojas (Aulacophora femoralis), picudo del algodonero (Anthonomus grandis), pulgones, saltamontes, grillos, chinches, moscas blancas, trips, langostas, moscas antromílidas, escarabajos, hormigas, barrenadores; nematodos parásitos de las plantas, como los nematodos de la raíz, nematodos de quiste, nematodos que atacan las raíces, nematodos del arroz blanco (Aphelenchoides besseyi), nematodo de la fresa (Nothotylenchus acris), nematodo del pino (Bursaphelenchus lignicolus), gastrópodos como babosas y caracoles; plagas del suelo como isópodos como bicho bolita (Armadilidium vulgare), y bichos bola (Portcellio scaber), plagas de insectos higiénicas como ácaro de las ratas tropical (Ornithonyssus bacoti), mosca común (Musca domestica), mosquito común (Culex pipiens), y cucarachas; plagas de insectos del grano almacenado como palomita de los cereales (Sitotroga cerealella), gorgojo sureño del frijol (Callosobruchus chinensis), gorgojo castaño de la harina (Tribolium castaneum) y gusanos de la harina; polillas, plagas domésticas y plagas de insectos de la casa, como polillas de las maletas (Tinea pellionella), escarabajo de las alfombras (Anthrenus scrophularidae) y termitas subterráneas; ácaros domésticos como ácaro del moho (Tyrophagus putrescentiae), Dermatophagoides farinae y Chelacaropsis moorel. Entre ellos los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención resultan particularmente efectivos para controlar los ácaros parásitos de las plantas, plagas de insectos agrícolas, nematodos parásitos de las plantas y similares. Asimismo, son efectivos contra plagas de insectos que han adquirido resistencia contra organofósforo, insecticidas piretroides sintéticos y/o de carbamato. Asimismo, los compuestos de la presente invención presentan excelentes propiedades sistémicas, y a través de la aplicación de los compuestos de la presente invención para el tratamiento del suelo, no solamente se pueden controlar insectos nocivos, ácaros nocivos, nematodos nocivos, gastrópodos nocivos e isópodos nocivos en el suelo, sino también plagas de las hojas.

Otras realizaciones preferibles de plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención pueden ser plaguicidas agrícolas u hortícolas con los que se controlan de forma colectiva los ácaros parásitos de las plantas, las plagas de insectos agrícolas, los nematodos parásitos de las plantas, gastrópodos y plagas del suelo que se han mencionado antes.

El plaguicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención se formula normalmente mezclando el compuesto con varios adyuvantes agrícolas y se utiliza en forma de una formulación como, por ejemplo, polvos, granulados, granulados dispersables en agua, polvos humectables, concentrados en suspensión de base acuosa, concentrados en suspensión de base oleosa, granulados solubles en agua, concentrados emulsionables, concentrados solubles, pastas, aerosoles o una formulación de volumen ultra bajo. No obstante, siempre y cuando sea adecuado para los fines de la presente invención, puede formularse en cualquier tipo de formulación que se utilice comúnmente en este campo. Dichos adyuvantes agrícolas incluyen vehículos sólidos como tierra de diatomeas, cal muerta, carbonato cálcico, talco, carbono blanco, caolín, bentonita, una mezcla de caolitina y sericita, arcilla, carbonato sódico, bicarbonato sódico, mirabilita, zeolita y almidón; disolventes como agua, tolueno, xileno, nafta disolvente, dioxano, acetona, isoforona, metil isobutil cetona, clorobenceno, ciclohexano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona y alcohol; agentes de extensión y tensioactivos aniónicos como sal de ácido graso, benzoato, alquilsulfosuccinato, dialquilsulfosuccinato, policarboxilato, sal de éster de ácido alquilsulfúrico, sulfato de alquilo, sulfato de alquilarilo, sulfato de éter alquil diglicólico, sal de éster de ácido sulfúrico de alcohol, sulfonato de alquilo, sulfonato de alquilarilo, sulfonato de arilo, sulfonato de lignina, disulfonato de éter alquildifenílico, sulfonato de poliestireno, sal de éster de ácido alquilfosfórico, fosfato alquilarílico, fosfato de estirilarilo, sal de éster de ácido sulfúrico de éter de polioxietilen alquilo, sulfato de éter de polioxietilen alquil arilo, sal de éster de ácido sulfúrico de éter polioxietilen alquilarílico, fosfato de éter de polioxietilen alquilo, sal de éster de ácido fosfórico de éter polioxietilen alquil arílico, y una sal de condensado de sulfonato de naftaleno con formalina; agentes de extensión y tensioactivos no iónicos como éster de ácido graso de sorbitano, éster de ácido graso de glicerina, poliglicérido de ácido graso, éter poliglicólico de alcohol de ácido graso, acetilenglicol, acetilen alcohol, polímero de bloque de oxialquileno, éter de polioxietilen alquilo, éter de polioxietilen alquilarilo, éter de polioxietilen estirilarilo, éter de polixoxietilenglicol alquilo, polietilenglicol, éster de ácido graso de polioxietileno, éster de ácido graso de polioxietilen sorbitano, éster de ácido graso de polioxietilen glicerina, aceite de

ricino hidrogenado de polioxietileno, éster de ácido graso de polioxipropileno, y aceites vegetales y minerales como aceite de oliva, aceite de ceiba pentandra, aceite de ricino, aceite de palma, aceite de camelia, aceite de coco, aceite de sésamo, aceite de maíz, aceite de salvado de arroz, aceite de cacahuete, aceite de semilla de algodón, aceite de soja, aceite de colza, aceite de linaza, aceite tung y parafinas líquidas. Cada uno de dichos componentes, como tales adyuvantes, puede consistir en uno o más de ellos seleccionados adecuadamente para su uso siempre y cuando el propósito de la presente invención se pueda cumplir. Asimismo, se pueden emplear también diversos aditivos como los utilizados comúnmente, como por ejemplo cargas, espesantes, agentes anti sedimentación, agentes anticongelantes, estabilizantes de la dispersión, agentes para reducir la fitotoxicidad, y agentes antimoho.

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

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

La aplicación del plaguicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención no se puede definir de forma general, ya que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, el tipo de formulación, la estación donde se aplica, el lugar de aplicación o los tipos o grado de brote de los insectos plaga. No obstante, por lo general se aplica en una concentración del ingrediente activo comprendida entre 0,05 y 800.000 ppm, preferiblemente entre 0,5 y 500.000 ppm, y la dosis por área unitaria es la adecuada para que el compuesto de la presente invención esté comprendido entre 0,05 y 50.000 g, preferiblemente entre 1 y 30.000 g, por hectárea. Por otra parte, los plaguicidas agrícolas y hortícolas, como otra realización preferible de los plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención, se pueden aplicar con arreglo a los modos de aplicación de plaguicidas que se han descrito. La presente invención incluye dichos métodos para el control de plagas, en particular para el control de ácaros parásitos de plantas, plagas de insectos agrícolas o nematodos parásitos de las plantas a través de dichas formas de aplicación.

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

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

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

Los compuestos activos de los agentes de control de plagas para insectos como insecticidas, acaricidas, nematocidas o plaguicidas para el suelo en los productos químicos agrícolas distintos que se han mencionado incluyen por ejemplo (según los nombres comunes, algunos de ellos están aún en etapa de aplicación) compuestos de fosfato orgánicos como profenofos, diclorvos, fenamifos, fenitrotion, epn, diazinon, clorpirifosmetilo, acefato, protiofos, fostiazato, fosfocarb, cadusafos, disulfoton, clorpirifos, demeton-s-metilo, dimetoato, metamidofos y paration; compuestos de carbamato como carbarilo, propoxur, aldicarb, carbofurano, tiodicarb, metomilo, oxamilo,

etiofencarb, pirimicarb, fenobucarb, carbosulfan, y benfuracarb; derivados de nereistoxina como cartap y tiociaclam y bensultap; compuestos de cloro orgánicos como dicofol, tetradifon y endosulfan; compuestos organometálicos como óxido de fenbutatina; compuestos piretroides como fenvalerato, permetrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, teflutrina, etofenprox, fenpropatrina y bifentrina; compuestos de benzoíl urea como diflubenzurón, clorfluazurón, teflubenzurón, flufenoxurón, lufenurón, novalurón, bistriflurón y noviflumurón; compuestos de tipo hormona juvenil como metopreno, piriproxifeno y fenoxicarb; compuestos de piridazinona como piridaben; compuestos de pirazol como fenpiroximato, fipronil, tebufenpirad, etiprol, tolfenpirad, acetoprol, pirafluprol y piriprol; neonicotinoides como imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid, tiametoxam, clotianidina y dinotefuran; compuestos de hidrazina como tebufenozida, metoxifenozida, clomafenozida y halofenozida, compuestos de dinitro; compuestos de azufre orgánicos; compuestos de urea; compuestos de triazina; compuestos de hidrazona; y otros compuestos como flonicamid, buprofezin, hexitiazox, amitraz, clordimeform, silafluofen, triazamato, pimetrozina, pirimidifen, clorfenapir, indoxacarb, acequinocilo, etoxazol, ciromazina, 1,3-dicloropreno, diafentiurón, benclotiaz, flufenerim, piridalilo, spirodiclofen, bifenazato, spiromesifen, propargita, clofentezina, fluacripirim, flubendiamida, cifluometofen, metaflumizona y amidoflumet. Asimismo, se pueden utilizar mezclados o en combinación productos químicos agrícolas microbianos como agentes BT, virus de insectos, hongos entomopatógenos y hongos nematófagos, antibióticos como avermectina, emamectina-benzoato, milbemectina, spinosad, ivermectina y lepimectina o productos naturales como azadiractina, y rotenona.

Los compuestos activos de fungicidas entre los productos químicos agrícolas distintos mencionados incluyen por ejemplo (según los nombres comunes, algunos están todavía en la etapa de aplicación), compuestos de pirimidinamina como mepanipirim, pirimetanil y ciprodinil; compuestos azol como triadimefón, bitertanol, triflumizol, etaconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, miclobutanil, ciproconazol, terbuconazol, hexaconazol, furconazol-cis, procloraz, metconazol, epoxiconazol, tetraconazol, oxpoconazol y sipconazol; compuestos de quinoxalina como quinometionato; compuestos de ditiocarbamato como maneb, zineb, mancozeb, policarbamato, propineb; compuestos de cloro orgánicos como ftalida, clorotalonil, quintozeno; compuestos de imidazol como benomil, tiofanato-metilo, carbendazim y ciazofamid; compuestos de piridinamina como fluazinam, compuestos de cianoacetamida como cimoxanilo; compuestos de fenilamida como metalaxilo, oxadixilo, ofurace, benalaxilo, furalaxilo, y ciprofuram; compuestos de ácido sulfénico como diclofluanid; compuestos de cobre como hidróxido cúprico y cobre oxina; compuestos de isoxazol como hidroxiisoxazol; compuestos organofosforosos como fosetil-al, tolclofos-metilo, o,o-diisopropilfosforotioato de s-bencilo, s,s-difenilfosforoditioacto de o-etilo, y hidrógenofosfonato de aluminometilo; compuestos de n-halogenotioalquilo como captano, captafol y folpet; compuestos de dicarboximida como procimidona, iprodiona y vinclozolina; compuestos de benzanilida como flutolanil, mepronil y zoxamida; compuestos de piperazina como triforina; compuestos de piridina como pirifenox; compuestos de carbinol como fenarimol; y flutriafol; compuestos de piperidina como fenpropidina; compuestos de morfolina como fenpropimorfo; compuestos de órgano estaño como hidróxido de fentin y acetato de fentin; compuestos de urea como pencicuron; compuestos de ácido cinámico como dimetomorfo, compuestos de carbamato de fenilo como dietofencarb; compuestos de ciano pirrol como fludioxonil y fenpiclonil; compuestos de estrobilurina como azoxistrobina, kresoxim-metilo, metominofen; trifloxistrobina, picoxistrobina y piraclostrobina; compuestos de oxazolidindiona como famoxadona; compuestos de tiazol carboxamida como etaboxam; compuestos de silil amida como siltiofam; compuestos de amidocarbamato de aminoácido como iprovalicarb; compuestos de imidazolidina como fenamidona; compuestos de hidroxianilida como fenhexamid; compuestos de benceno sulfonamida como flusulfamida; compuestos de antraquinona; compuestos de ácido crotónico; antibióticos y otros compuestos como isoprotiolano; triciclazol, piroquilon, diclomezina, probenazol, quinoxilfen; clorhidrato de propamocarb, espiroxamina, cloropicrin, dazomet y metam-sodio.

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

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

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

Los ácaros parásitos animales pueden consistir por ejemplo en garrapatas como Boophilus microplus, Rhipicephalus sanguineus, Haemaphysalis longicornis, Haemaphysalis flava, Haemaphysalis campanulata, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis japonica, Haemaphysalis kitaokai, Haemaphysalis ias, Ioxodes ovatus, Ixodes nipponensis, Ixodes persulcatus, Amblyomma testudinarium, Haemaphysalis megaspinosa, Dermacentor reticulatus y Dermacentor taiwanensis; ácaros rojos comunes (Dermanyssus gallinae); ácaros de palomas silvestres como Ornithonyssus syviarum y Ornithonyssus bursa; trombidioides como Eutrombicula wichmanni, Leptotrombidium akamushi, Leptotrombidium pallidum, Leptotrombidium fuji, Leptotrombidium tosa; Neotrombicula autumnalis, Eutrombicula alfreddugesi y Helenicula miyagawai; queilétidos como Cheyletiella yasguri, Cheyletiella parasiltivorax

y Cheyletiella blakei; ácaros de la sarna sarcóptica como Psoroptes cuniculi, Chorioptes bovis, Otodectes cynotis, Sarcoptes scabiei y Notoedres cati; y Demodicidae como Demodex canis. Los plaguicidas contra parásitos en animales que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente efectivos para el control de garrapatas entre ellos.

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

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

Los animales huésped pueden ser, por ejemplo, animales mascotas, animales domésticos y aves de corral, tales como perros, gatos, ratones, ratas, hámsteres, cobayas, ardillas, conejos, hurones, aves (como palomas, loros, mainás del Himalaya, gorriones de Java, loros, tórtolas y canarios), vacas, caballos, cerdos, ovejas, patos y pollos. Los plaguicidas contra los parásitos en los animales que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente efectivos para el control de parásitos plaga sobre animales mascotas o animales domésticos, especialmente para el control de parásitos externos, entre ellos. Entre los animales mascota y los animales domésticos son particularmente efectivos para perros, gatos, vacas y caballos.

Cuando el compuesto de la presente invención se usa como plaguicida contra parásitos en animales, se puede utilizar como tal o se puede utilizar con un adyuvante adecuado, tal como se formula en diversas formulaciones como polvos, granulados, tabletas, polvos, cápsulas, concentrados solubles, concentrados emulsionables, un concentrado en suspensión de base acuosa y un concentrado en suspensión de base oleosa. Además de dichas formulaciones, se puede formular en cualquier tipo de formulación que se utilice comúnmente en este campo, siempre y cuando sea adecuada para los propósitos de la presente invención. Los adyuvantes que se utilizan en las formulaciones pueden consistir por ejemplo en agentes tensioactivos aniónicos o agentes tensioactivos no iónicos, cuyos ejemplos se han mencionado anteriormente como adyuvantes para la formulación de plaguicidas agrícolas y hortícolas; un agente tensioactivo catiónico como bromuro de cetil trimetilamonio; un disolvente como agua, acetona, acetonitrilo, monometilacetamida, dimetilacetamida, dimetilformamida, 2-pirrolidona, N-metil-2-pirrolidona, queroseno, triacetina, metanol, etanol, isopropanol, alcohol bencílico, etilen glicol, propilenglicol, polietilenglicol, polioxietilenglicol líquido, butil diglicol, éter monometílico de etilenglicol, éter monoetílico de etilenglicol, éter monoetílico de dietilenglicol, éter n-butílico de dietilenglicol, éter monometílico de dipropilenglicol, éter n-butílico de dipropilenglicol; un antioxidante como butilhidroxianisol, butilhidroxitolueno, ácido ascórbico, hidrógenometanosulfito sódico, galato de propilo o tiosulfato de sodio; un agente para formar película de recubrimiento como polivinil pirrolidona, polialcohol vinílico o un copolímero de acetato de vinilo y vinil pirrolidona; aceites vegetales y aceites minerales como los que se han indicado como ejemplos antes como adyuvantes para la formulación y plaguicidas agrícolas y hortícolas; y un vehículo como lactosa, sacarosa, glucosa, almidón, harina de trigo, harina de maíz, torta de soja y harina; salvado de arroz desgrasado, carbonato cálcico y otros materiales alimenticios comercialmente disponibles. Se puede seleccionar adecuadamente uno o más de los componentes correspondientes de estos adyuvantes para su uso siempre y cuando no se alejen del propósito de la presente invención. Asimismo, se pueden seleccionar adecuadamente para su uso otros adyuvantes distintos a los mencionados entre los conocidos en este campo, y también se pueden seleccionar adecuadamente para su uso algunos de los distintos adyuvantes utilizados en el campo de la agricultura y la horticultura mencionados anteriormente.

La proporción de mezclado del compuesto de la presente invención y los distintos adyuvantes está comprendida normalmente entre 0,1:99,9 y 90:1,0. En el uso real de dicha formulación, se puede utilizar como tal o se puede diluir hasta una concentración determinada previamente con un diluyente como agua, y se pueden añadir diversos agentes de extensión (por ejemplo, agentes tensioactivos, aceites vegetales y aceites minerales), según lo requiera el caso.

La administración del compuesto de la presente invención a un animal huésped se lleva a cabo por vía oral o parenteral. Como método de administración oral, se puede mencionar un método de administración de una tableta, un agente líquido, una cápsula, una oblea, una galleta, carne triturada u otro alimento, que contenga el compuesto

de la presente invención. Como método de administración parenteral se puede mencionar por ejemplo un método donde se formula el compuesto de la presente invención en una formulación adecuada e introducirse después en el cuerpo por ejemplo, por administración intravenosa, administración intramuscular, administración intradérmica, administración hipodérmica, etc.; un método donde se administra en la superficie del cuerpo por tratamiento en un punto, tratamiento de vertido o tratamiento por rociado; o un método de embebido de un fragmento de resina o similar que contenga el compuesto de la presente invención bajo la piel del animal huésped.

La dosis del compuesto de la presente invención en el animal huésped varía dependiendo del método de administración, el propósito de la administración, el síntoma de la enfermedad, etc., pero normalmente se administra en una proporción comprendida entre 0,01 mg y 100 g, preferiblemente entre 0,1 mg y 10 g, por cada 1 kg de peso corporal del animal huésped.

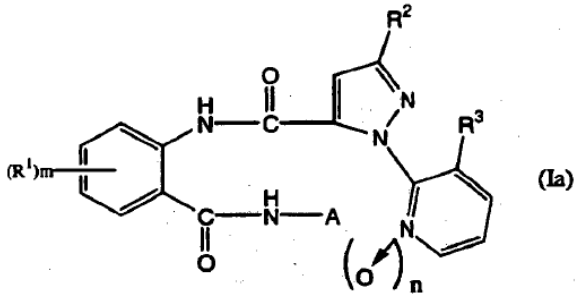
La presente invención incluye también un método de control de una plaga a través del método de administración que se ha mencionado o a través de la dosis citada, en particular un método de control de parásitos externos o parásitos internos.

Asimismo, en la presente invención, puede darse el caso donde al controlar las plagas parásitas en los animales, tal como se ha descrito, es posible prevenir o curar las distintas enfermedades del animal huésped causadas por ellas. Por lo tanto, la presente invención incluye también un agente preventivo o terapéutico para una enfermedad animal causada por un parásito que contiene el compuesto de la presente invención como ingrediente activo, y un método para prevenir o curar una enfermedad animal causada por un parásito.

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

A continuación, se ilustrarán varias realizaciones preferibles de los compuestos de la presente invención. En los ejemplos, se pueden combinar dos o más adecuadamente, y los compuestos que se basan en dichas combinaciones también son realizaciones preferibles de los compuestos de la presente invención. Asimismo, son también realizaciones preferibles de la presente invención plaguicidas, plaguicidas para agricultura y horticultura, insecticidas, acaricidas, nematocidas, plaguicidas contra parásitos en animales, plaguicidas contra parásitos externos en animales y agentes preventivos o terapéuticos para enfermedades animales causadas por parásitos, que contienen los siguientes compuestos como ingredientes activos. Por otra parte, los métodos para controlar las plagas aplicando así cantidades eficaces de los siguientes compuestos también son realizaciones preferibles de la presente invención. No obstante, debe entenderse que la presente invención de ningún modo está restringida, por ellos.

(18) Un compuesto de la fórmula (I) que está representado por la fórmula (Ia):



donde R^1 es halógeno o alquilo; cada uno de R^2 y R^3 es halógeno o $-CF_3$; A es alquilo sustituido con Y; Y es ciclopropilo C_{3-4} que puede estar sustituido con halógeno o alquilo; m es 1 o 2; y n es 0 o 1.(19) Un compuesto de la fórmula (I) que está representado por la fórmula (Ia) anterior, donde R^1 es halógeno o alquilo; cada uno de R^2 y R^3 que son independientes entre sí es halógeno o $-CF_3$; A es -X-Y; X es alquileno; Y es ciclopropilo C_{3-4} que puede estar sustituido con halógeno o alquilo; m es 1 o 2; y n es 0 o 1.

Ejemplos

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

Ejemplo de preparación 1

Preparación de N-[6-[[(ciclopropilmetil)amino]carbonil]-2-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridil)-3-trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (en adelante denominado compuesto N.º1)

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

Ejemplo de preparación 2

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

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

Ejemplo de preparación 3

Preparación de N-[4-cloro-2-metil-6-[[α-metil-(ciclopropilmetil)amino]carbonil]-fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida (en adelante denominado compuesto N.º9)

Se añadieron gota a gota gradualmente 1,07 g de trietilamina a una solución mixta que comprende 0,65 g de clorhidrato de α-metil-ciclopropilmetilamina y 40 ml de tetrahidrofurano, con enfriamiento con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 30 minutos. A continuación, se añadió gota a gota gradualmente una solución mixta que comprendía 0,8 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-il)]6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona y 10 ml de tetrahidrofurano. Una vez completada la adición gota a gota, se hizo reaccionar la solución mixta durante 4 horas a reflujo. Una vez completada la reacción, se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se añadió al residuo acetato de etilo y agua para extracción. Se lavó la capa orgánica con agua y una solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se purificó el residuo por cromatografía de columna sobre gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 0,33 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 183,6 ºC.

Ejemplo de preparación 4

Preparación de N-[2-bromo-4-cloro-6-[[α-metil-(ciclopropilmetil)-amino]carbonil]-fenil]-3-bromo-1-(5-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida (en adelante denominado compuesto N.º 15)

Se añadió gota a gota gradualmente 1 g de trietilamina a una solución mixta que comprendía 0,6 g de clorhidrato de α-metil-ciclopropilmetilamina y 40 ml de tetrahidrofurano con enfriamiento con hielo, seguido de agitación durante 1 hora a temperatura ambiente. A continuación, se añadió gota a gota gradualmente una solución mixta que comprendía 0,85 g de 2-[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-bromo-4H-3,1-benzoxazin-4-ona y 10 ml de tetrahidrofurano. Una vez completada la adición gota a gota, se hizo reaccionar la solución mixta durante 4 horas a reflujo. Una vez completada la reacción, se eliminó por destilación el disolvente y se añadieron al residuo

acetato de etilo y agua para extracción. Se lavó la capa orgánica con agua y solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Se eliminó por destilación el disolvente a presión reducida y se purificó el residuo por cromatografía de columna sobre gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/2) para obtener 0,7 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 260,6 ºC.

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

En la tabla 1, N.º representa compuesto N.º. Asimismo, en la tabla 1, Me representa un grupo metilo, Et un grupo etilo, iPr un grupo isopropilo, CPr un grupo ciclopropilo, CBu un grupo ciclobutilo, y pH un grupo fenilo. Asimismo, en la tabla 1, A1 representa-CH_2-[CPr], A2 -CH(Me)-[CPr], A3 -CH_2-[2-Me-CPr], A4 -CH_2-[2,2-Cl_2-1-Me-CPr], A5 -CH_2-[1-Me-CPr] Asimismo, en la tabla 1, 2-Me-CPr representa un grupo ciclopropilo que tiene un grupo metilo sustituido en la posición -2 y CO_2Ph(4-Cl) representa un grupo fenoxicarbonilo que tiene un átomo de cloro sustituido en la posición 4- del grupo fenilo. Lo mismo se aplica en otras descripciones similares.

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

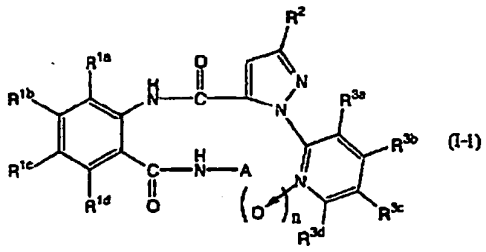


TABLA 1

N.º	R^{1a}	R^{1b}	R^{1c}	R^{1d}	R^2	R^{3a}	R^{3b}	R^{3c}	R^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: ºC)
1	Me	H	H	H	CF_3	Cl	H	H	H	A1	199,4
2	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A1	216,4
3	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	210,0
4	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A3	
5	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A4	219,3
6	Me	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A1	
7	Me	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A1	
8	Me	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	186,7
9	Me	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	183,6
10	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A5	161,2
11	Br	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	158,2
12	I	H	Br	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	145,5
13	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	230,9
14	Cl	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	238,8
15	Cl	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	236,8
16	Br	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	260,6
17	I	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	251,4
18	Br	H	F	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	220,1

N.º	R^{1a}	R^{1b}	R^{1c}	R^{1d}	R^2	R^{3a}	R^{3b}	R^{3c}	R^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: ºC)
19	I	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	241,0
20	Cl	H	F	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	214,0
21	I	H	I	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	251,9
22	Br	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	219,2
23	Me	H	Cl	H	CF_3	Br	H	H	H	A2	162-164
24	Me	H	Cl	H	Cl	CF_3	H	H	H	A2	154-156
25	Me	H	Cl	H	Br	Br	H	H	H	A2	128-132
26	Cl	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
27	I	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
28	F	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
29	F	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
30	I	H	F	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
31	F	H	F	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
32	F	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
33	Me	H	F	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
34	Me	H	F	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
35	Me	H	CO_2Me	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
36	Me	H	CO_2-iPr	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
37	Me	H	CO_2Ph	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
38	Br	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	233,2
39	Br	H	F	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	179,1
40	Me	H	$COCH_3$	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	143,4
41	Me	H	CHO	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	152,3
42	Me	H	CHF_2	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	212,9
43	Me	H	CHF_2	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
44	Me	H	CHF_2	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
45	Et	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	215,4
46	Et	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
47	Et	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
48	Me	H	NO_2	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	197,9
49	Me	H	NO_2	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
50	Me	H	NO_2	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
51	Me	H	CF_3	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
52	Me	H	CF3	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
53	Me	H	CF_3	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
54	CF_3	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
55	Me	H	OMe	H	Br	Cl	H	H	H	A2	

N.º	R^{1a}	R^{1b}	R^{1c}	R^{1d}	R^2	R^{3a}	R^{3b}	R^{3c}	R^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: ºC)
56	Me	H	OMe	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
57	Me	H	OMe	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
58	$OCHF_2$	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
59	$OCHF_2$	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
60	$OCHF_2$	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
61	CHF_2	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
62	CHF_2	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
63	CHF_2	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
64	Me	H	$CH=CH_2$	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
65	Me	H	C≡CH	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
67	Me	H	$COCF_3$	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
68	Me	H	$CH=CCl_2$	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
69	Me	H	C≡Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
70	Me	H	$CO_2Ph(4\text{-}Cl)$	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
71	Me	H	$CO_2Ph(4\text{-}Me)$	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
72	Me	H	$CO_2Ph(\text{-}NO_2)$	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
73	Me	H	$CO_2Ph(4\text{-}CN)$	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
74	Me	H	$CO_2Ph(4\text{-}SMe)$	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
75	Et	H	Cl	H	OCH_2CF_3	Cl	H	H	H	A2	
76	Me	H	NO_2	H	OCH_2CF_3	Cl	H	H	H	A2	
77	Me	H	CHF_2	H	CF_3	H	H	Cl	H	A2	
78	Et	H	Cl	H	Br	H	H	F	H	A2	
79	I	H	Cl	H	Br	F	H	F	H	A2	
80	I	H	Cl	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	220,6
81	Me	H	Cl	H	OCH_2CF_3	Cl	H	H	H	A2	175,1
82	Br	H	CHF_2	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
83	Br	H	CHF_2	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
84	Br	H	CHF_2	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
85	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	Cl	H	A2	
86	Me	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	F	H	A2	
87	Br	H	NO_2	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
88	Br	H	NO_2	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
89	Br	H	NO_2	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	
90	I	H	Br	H	Cl	Cl	H	H	H	A2	222,9
91	I	H	Br	H	Br	Cl	H	H	H	A2	221,0
92	Me	H	Me	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	172,3
93	Me	H	CO_2-iPr	H	Br	Cl	H	H	H	A2	176-179

N.º	R^{1a}	R^{1b}	R^{1c}	R^{1d}	R^2	R^{3a}	R^{3b}	R^{3c}	R^{3d}	A	Propiedades físicas (pf: ºC)
94	Et	H	Br	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	175,2
95	Et	H	NO_2	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	116,8
96	Me	H	CO_2Me	H	Br	Cl	H	H	H	A2	190-198
97	CF_3	H	Cl	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
98	CF_3	H	Br	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	234,8
99	CF_3	H	Cl	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	230,0
100	Cl	H	CF_3	H	Br	Cl	H	H	H	A2	
101	Br	H	CF_3	H	CF_3	Cl	H	H	H	A2	
102	Cl	H	CF_3	H	CF3	Cl	H	H	H	A2	
103	N-óxido del compuesto N.º1 (n = 1)										
104	N-óxido del compuesto N.º3 (n = 1)										
105	N-óxido del compuesto N.º9 (n = 1)										
106	N-óxido del compuesto N.º16 (n = 1)										
107	N-óxido del compuesto N.º22 (n = 1)										
108	N-óxido del compuesto N.º42 (n = 1)										

A continuación, se describirán ejemplos de ensayo

Ejemplo de ensayo 1

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

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

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

Ejemplo de ensayo 2

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

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

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

Ta: número de larvas en último estadio + número de pupas después del tratamiento en la sección tratada
Tb: número de eclosiones antes del tratamiento en la sección tratada
Ca: Número de larvas en último estadio + número de pupas tras el tratamiento en la sección tratada
Cb: Número de eclosiones antes del tratamiento en la sección tratada

Ejemplo de ensayo 3

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

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

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

Ejemplo de ensayo 4

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

Se recubrió con una sustancia pegajosa el pecíolo de una berenjena que tenía solamente la hoja principal y se plantó en un tiesto; a continuación se soltaron aproximadamente 3-4 hembras vivíparas ápteras del pulgón del algodón sobre la hoja principal. Al cabo de dos días desde que se soltaron, se quitaron los insectos adultos y se hizo el recuento del número de larvas. Se sumergió la hoja de la berenjena infestada con las larvas en una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 50 ppm, durante aproximadamente 10 segundos, a continuación se secó al aire y se dejó en una cámara de temperatura constante a 25 ºC con iluminación. Se hizo el recuento del número de insectos supervivientes 5 días después del tratamiento y se obtuvo el índice de mortalidad de la misma manera que en el ensayo del ejemplo 3 anterior. Se obtuvo el índice de mortalidad en relación con los compuestos antes mencionados N.º 16, 18 y 22, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con una mortalidad de al menos un 90 %.

Ejemplo de ensayo 5

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

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

Valor de protección (%) = (1-((número de larvas en último estadio + número de pupas en la sección tratada)/ (número de larvas en último estadio + número de pupas en la sección sin tratar))) x 100

Ejemplo de ensayo 6

Ensayo para controlar los efectos contra Thrips palmi

Se cortaron todas las hojas de un pepino plantado en un tiesto excepto la hoja principal. Se sumergió la hoja que quedaba durante aproximadamente 10 segundos en una solución insecticida preparada para obtener una

concentración del compuesto de la presente invención a 50 ppm y se secó al aire. A continuación, se colocó un segmento de la hoja de pepino con larvas en primer estadio sobre la hoja tratada anterior. Al día siguiente, se quitó el segmento de la hoja de pepino y se hizo el recuento del número de larvas trasladadas a la hoja tratada. Se colocó un papel de filtro mojado en un vaso de plástico que tenía un diámetro de 9 cm y una altura de 4 cm, y se colocó encima la hoja tratada cortada. A continuación, después de colocar una cubierta encima, se dejó en una cámara de temperatura constante a 25 ºC con iluminación. Se hizo el recuento del número de insectos supervivientes durante 12 a 15 días después del tratamiento y se obtuvo el valor de protección de la misma manera que en el ejemplo de ensayo 2 anterior. Se obtuvo el valor de protección en relación con los compuestos anteriores N.º 11, 12, 16, 22, 38, y 39 en virtud de lo cual los compuestos presentaron altos efectos de control con un valor de protección de al menos 90 %.

Ejemplo de ensayo 7

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

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

Ejemplo de ensayo 8

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

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

Porcentaje de inhibición de emergencia (%) = (1-(número de adultos/número de larvas soltadas)) x100

Ejemplo de ensayo 9

Ensayo sobre los efectos contra termita subterránea (Coptotermes formosanus)

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

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

Mortalidad (%) = (número de obreras muertas/10) x 100

Ejemplo de ensayo 10

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

Se aplicaron 10 ml de una solución insecticida preparada para obtener una concentración del compuesto de la presente invención de 800 ppm y 200 ppm, al pie de una calabaza en el estadio de la hoja 5º a 6º plantada en un tiesto. Se colocó un papel de filtro mojado en una placa petri que tenía un diámetro de 9 cm, y se colocó encima un

segmento de la hoja de la calabaza cortada diez días después del tratamiento. Se soltaron larvas en el segundo-tercer estadio de gusano gris del tabaco y después de colocar una cubierta se dejó en una cámara de temperatura constante a 25 ºC con iluminación. Se hizo el recuento de las larvas muertas durante 4 a 5 días después de soltarlas y se obtuvo el índice de mortalidad de la misma manera que la del ejemplo de ensayo 1 anterior. En este punto, se contó como insectos muertos, los insectos moribundos. Se obtuvo el índice de mortalidad a 800 ppm en relación con el compuesto mencionado anteriormente N.º 8, en virtud de lo cual presentó altos efectos de control con un índice de mortalidad de al menos 90 % y se obtuvo el índice de mortalidad a 200 ppm en relación con los compuestos anteriores mencionados N.º 3, 9, 11, 16, 18 y 22, en virtud de lo cual todos los compuestos presentaron altos efectos de control con una mortalidad de al menos 90 %.

Ejemplo de ensayo 11

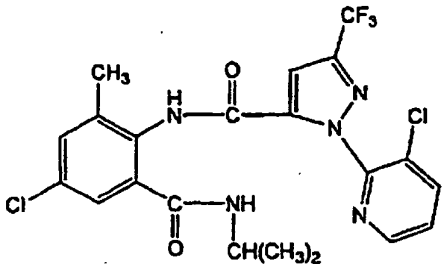
Ensayo sobre el control contra Hemaphysalis longicornis

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

Se corrigió el índice de abatimiento en cada tiempo de observación con la fórmula de corrección de Abbott que se indica a continuación. A continuación, se trazó una línea probit -tiempo y se obtuvo el tiempo de abatimiento medio (valor KT50). En relación con los valores KT50 de los compuestos de muestra correspondientes, fueron 9 minutos y 8 minutos con el compuesto N.º3 anterior y 7,5 minutos y 6 minutos con el compuesto anterior N.º 9, mientras que fueron 80 minutos y 40 minutos con el siguiente compuesto comparativo A y 120 minutos y 80 minutos con el siguiente compuesto comparativo B.

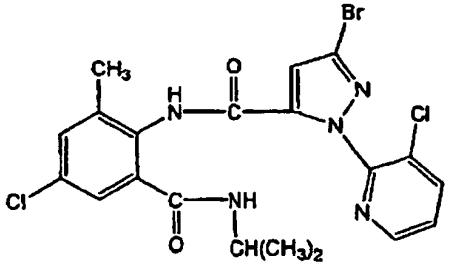
Índice de abatimiento corregido (%) = [(índice de no abatimiento en la sección de control - índice de no abatimiento en la sección tratada)/ índice de no abatimiento en la sección de control] x 100

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



Compuesto comparativo A

El compuesto comparativo B es el compuesto que se representa a continuación 509 en el documento WO 03/24222, el compuesto 530 en el documento WO 03/15518 y el compuesto 27 en el documento WO 03/15519.



Compuesto comparativo B

Ejemplo de ensayo 12

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

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

Se hizo el recuento de las pulgas muertas 48 horas después de la exposición y se obtuvo el índice de mortalidad de la misma manera que la del ejemplo de ensayo 1 anterior. Se obtuvo el índice de mortalidad en relación con el compuesto anterior n.º 16, en virtud de lo cual se demostraron altos efectos de control con una mortalidad de al menos 90 %.

Ejemplo de formulación 1

(1) Compuesto de la presente invención	20 partes en peso
(2) Arcilla	72 partes en peso
(3) Sulfonato de sodio lignina	8 partes en peso

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

Ejemplo de formulación 2

(1) Compuesto de la presente invención	5 partes en peso
(2) Talco	95 partes en peso

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

Ejemplo de formulación 3

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

Se mezclan uniformemente los componentes indicados y se disuelven para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 4

(1) Arcilla	68 partes en peso
(2) Sulfonato de sodio lignina	2 partes en peso
(3) Sulfato de polioxietilenalquilarilo	5 partes en peso
(4) Polvo de sílice fino	25 partes en peso

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

Ejemplo de formulación 5

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

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

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

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

Ejemplo de formulación 6

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

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

Ejemplo de formulación 7

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

Se mezclan uniformemente los componentes indicados y se disuelven para obtener una formulación de volumen ultra bajo.

Ejemplo de formulación 8

(1) Compuesto de la presente invención	40 partes en peso
(2) Polialquilfenilfosfato oxilado -trietanolamina	2 partes en peso
(3) Silicona	0,1 parte en peso
(4) Goma xantana	93,9 partes en peso
(5) Etilenglicol	5 partes en peso
(6) Agua	52,7 partes en peso

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

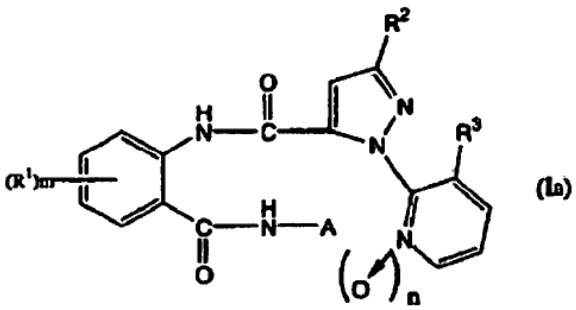
Ejemplo de formulación 9

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

Se mezclan uniformemente los componentes anteriores para obtener un concentrado soluble.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de antranilamida representado por la fórmula (Ia) o su sal:



(Ia)

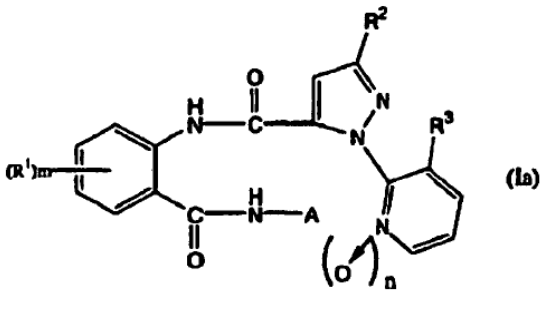
donde R^1 es halógeno o alquilo; cada uno de R^2 y R^3 es halógeno o CF_3; A es alquilo sustituido con Y; Y es ciclopropilo que puede estar sustituido con halógeno o alquilo; m es 1 o 2; n es 0 o 1, siempre que cuando R^1 es un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o metilo sustituido en la posición 2 del anillo de benceno y otro R^1 es halógeno sustituido en la posición 4 del anillo de benceno, el halógeno en la posición 4 es un átomo de flúor o de cloro.

2. N-[6-[[(ciclopropilmetil)amino]carbonil]-2-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida.

3. N-[4-cloro-2-metil-6-[[α-metil-(ciclopropilmetil)amino]carbonil]-fenil]-3-(trifluorometil)-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida.

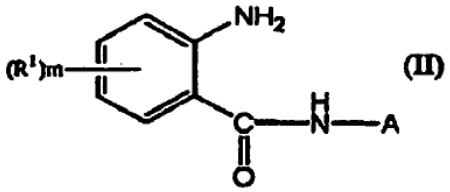
4. N-[4-cloro-2-metil-6-[[a-metil-(ciclopropilmetil)amino]carbonil]-fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida.

5. Un proceso para producir un compuesto de antranilamida representado por la fórmula (I) o su sal como se ha definido adicionalmente mediante la reivindicación 1:



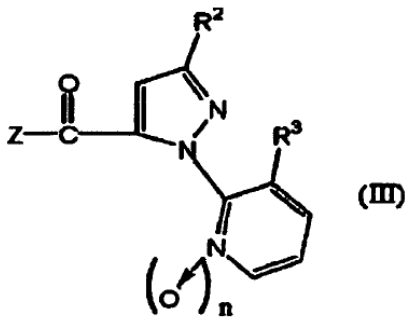
(Ia)

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



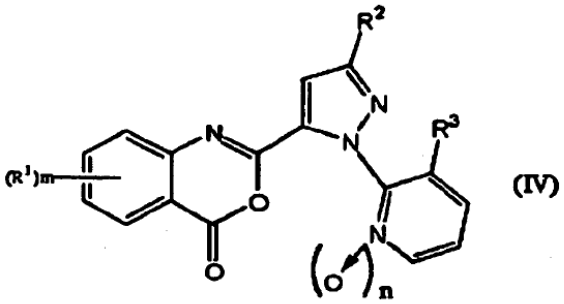
(II)

donde R^1, A y m son como se ha definido anteriormente, con un compuesto representado por la fórmula (III):



(III)

donde R^2, R^3 y n son como se ha definido anteriormente y Z es un átomo de cloro, -OH o alcoxi C_{1-4}, o (2) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IV):



(IV)

donde R^1,R^2, R^3, m, n y q son como se ha definido anteriormente, con un compuesto representado por la fórmula (V): A-NH_2, donde A es como se ha definido anteriormente.

6. Un plaguicida que contiene el compuesto de antranilamida o su sal como se ha definido en la reivindicación 1, como ingrediente activo.

7. El plaguicida según la reivindicación 6

(i) para su uso como plaguicida en agricultura u horticultura.
(ii) para su uso como insecticida, acaricida o nematicida,
(iii) para su uso como plaguicida contra parásitos en animales, o
(iv) para su uso como plaguicida contra parásitos externos en animales.

8. Un agente preventivo o terapéutico para una enfermedad animal causada por un parásito, que contiene el compuesto de antranilamida o su sal como se ha definido en la reivindicación 1, como ingrediente activo.

9. Un método para controlar una plaga, que comprende la aplicación de una cantidad eficaz del compuesto antranilamida o su sal como se ha definido en la reivindicación 1, excepto para un método para el tratamiento de un organismo humano o animal a través de terapia.

10. Un plaguicida para agricultura u horticultura que contiene un compuesto de antranilamida como se ha definido en la reivindicación 1 o su sal, y otras sustancias químicas agrícolas.