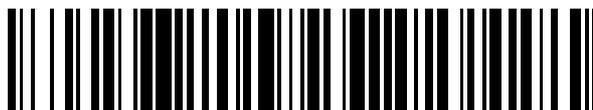


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 586 455**

51 Int. Cl.:

<b>A01N 43/40</b>	(2006.01) <b>A01N 43/90</b>	(2006.01)
<b>A01N 31/14</b>	(2006.01) <b>A01N 47/02</b>	(2006.01)
<b>A01N 37/50</b>	(2006.01) <b>A01N 47/40</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/22</b>	(2006.01) <b>A01N 53/00</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/42</b>	(2006.01) <b>A01N 55/00</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/52</b>	(2006.01) <b>A01P 7/00</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/707</b>	(2006.01) <b>C07D 401/06</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/76</b>	(2006.01) <b>C07D 213/75</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/80</b>	(2006.01) <b>C07D 213/76</b>	(2006.01)
<b>A01N 43/82</b>	(2006.01) <b>C07D 417/06</b>	(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.02.2013** **E 13157134 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.07.2016** **EP 2633756**

54 Título: **Composición para el control de plagas que comprende un derivado de iminopiridina**

30 Prioridad:

**29.02.2012 JP 2012044514**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**14.10.2016**

73 Titular/es:

**MEIJI SEIKA PHARMA CO., LTD. (100.0%)  
4-16, Kyobashi 2-chome  
Chuo-ku, Tokyo 104-8002, JP**

72 Inventor/es:

**MITOMI, MASAOKI;  
HORIKOSHI, RYO;  
ONOZAKI, YASUMICHI;  
NAKAMURA, SATOSHI;  
NOMURA, MASAHIRO y  
MATSUMURA, MAKOTO**

74 Agente/Representante:

**VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro**

**Observaciones :**

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

ES 2 586 455 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

Composición para el control de plagas que comprende un derivado de iminopiridina

5 **Antecedentes de la invención****1. Campo de la invención**

10 La presente invención se refiere a una composición para el control de plagas que contiene un derivado de iminopiridina y al menos uno de otros agentes para el control de plagas.

**2. Descripción de la técnica relacionada**

15 Aunque se han descubierto numerosos agentes para el control de plagas hasta la fecha, aún se requiere el desarrollo de nuevos fármacos que tengan una alta seguridad en vista del problema de la reducción de la sensibilidad a los fármacos, el problema de la eficacia a largo plazo, la seguridad de los trabajadores o la seguridad en términos de impacto medioambiental. Además, en la agricultura, con el fin de conseguir una reducción en el esfuerzo por el trabajo para el control de plagas, es general mezclar una pluralidad de componentes de un compuesto químico para el control de plagas y tratar las semillas o los productos agrícolas durante el período de crecimiento de las plantas de semillero con el producto químico, y en estas circunstancias, se requiere un compuesto químico de tipo eficacia residual a largo plazo que tenga propiedades de penetración y migración. Además, también es posible solucionar problemas tales como la dispersión de un compuesto químico en el medio ambiente circundante fuera de las tierras agrícolas o la exposición de una persona que realiza el control de plagas mediante tratamiento de semillas o el tratamiento durante el período de crecimiento de las plantas de semillero.

25 El documento de Solicitud de Patente Europea Abierto a Inspección Pública n.º 432600 desvela una pluralidad de compuestos que tienen la misma estructura de anillo que la de un compuesto representado por la Fórmula (I), pero los compuestos se usan como herbicidas y no existe ninguna descripción acerca del control de plagas.

30 El documento de Solicitud de Patente Japonesa Abierto a Inspección Pública (JP-A) n.º 5-78323 desvela la fórmula estructural de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto n.º 3 de la Tabla 1 del documento JP-A n.º 5-78323), pero falla en desvelar un método de preparación del mismo y el compuesto no se incluye en una lista del grupo de compuestos que se reconoce que tienen actividad para el control de plagas (Tablas 2 y 3 del documento JP-A n.º 5-78323).

35 El documento de Solicitud de Patente Europea Abierto a Inspección Pública n.º 268915 desvela la fórmula estructural de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Ejemplo n.º 12 de la Tabla 7 del documento de Solicitud de Patente Europea Abierto a Inspección Pública n.º 268915), pero falla en desvelar un método de preparación del mismo y el Ejemplo no incluye el compuesto como un ejemplo de los compuestos que tienen actividad para el control de plagas.

45 Chemische Berichte (1955), 88, 1103-8 desvela una pluralidad de compuestos que tienen una estructura de anillo similar a la de un compuesto representado por la Fórmula (I) que se describe posteriormente, pero los compuestos se desvelan solo como compuestos intermedios sintéticos.

El documento de Solicitud de Patente Europea Abierto a Inspección Pública n.º 259738 desvela una pluralidad de compuestos que tienen una estructura de anillo similar a la de un compuesto representado por la Fórmula (I), pero falla en desvelar o sugerir un compuesto que tiene una estructura de imino ácido trifluoroacético.

50 Además, estos documentos no describen la actividad para el control de plagas cuando el derivado de iminopiridina de la presente invención se mezcla con otro agente para el control de plagas.

**Sumario de la invención**

55 La presente invención consigue proporcionar un nuevo agente para el control de plagas que soluciona los problemas que tienen los compuestos químicos de la técnica relacionada, tales como reducción de la sensibilidad a los fármacos, eficacia a largo plazo, seguridad durante el uso de los mismos y similares en el campo del control de plagas.

60 Con el fin de solucionar los problemas, los presentes inventores han realizado estudios exhaustivos y, como resultado, han descubierto que un derivado específico de iminopiridina tiene excelentes efectos de control de plagas frente a plagas y han descubierto una composición que muestra excelentes efectos de control de plagas al contener estos derivados de iminopiridina y al menos uno de otros agentes para el control de plagas, en comparación cuando se usa un agente individual. La presente invención se basa en el descubrimiento.

65

De ese modo, la invención se refiere a una composición para el control de plagas que comprende al menos un derivado de iminopiridina seleccionado entre el grupo que consiste en N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida y N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroetanotioamida y una sal de adición de ácido del mismo; y al menos un agente para el control de plagas distinto,

5 (i) en la que el otro agente para el control de plagas es un insecticida y se selecciona entre el grupo que consiste en imidacloprid, clotianidina, dinotefurán, tiametoxam, pimetozina, espinosad, fipronil, clorantraniliprol, ciantraniliprol, etofenprox, silafluofén, sulfoxaflor, flupiradifurona, flometoquina, benzoato de emamectina, cicloxaprid, 1-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato y afidopiropeno, o una sal de adición de ácido agrícolamente y zootécnicamente aceptable del mismo, o

10 (ii) en la que el otro agente para el control de plagas es un fungicida seleccionado entre el grupo que consiste en azoxistrobina, orisastrobina, tifluzamida, furametpir, tiadinil, isotianil, diclocimet, triciclazol, tebufloquina, simeconazol, validamicina, kasugamicina y pencicurón, o

15 (iii) en la que el otro agente para el control de plagas es un agente de control para plagas parasitarias animales y se selecciona entre el grupo que consiste en fipronil, imidacloprid, dinotefurán, amitraz, piriproxifén, espinosad, o una sal de adición de ácido agrícolamente y zootécnicamente aceptable del mismo.

20 Se proporciona un método para proteger contra plagas plantas o animales útiles, incluyendo: tratamiento de plagas, plantas útiles, semillas de plantas útiles, suelo, vehículos de cultivo o animales como diana con una cantidad eficaz de la composición para el control de plagas.

25 Se proporciona el uso de la composición para el control de plagas para proteger contra plagas plantas o animales útiles.

#### Descripción detallada de realizaciones

30 El derivado de iminopiridina que se usa en la invención se selecciona entre el grupo que consiste en N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto P212) y N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroetanotioamida (Compuesto 1-20).

35 Además, en la presente invención, también se puede usar una sal de adición de ácido del derivado de iminopiridina (preferentemente, una sal de adición de ácido agrícolamente y zootécnicamente aceptable), y algunos ejemplos de la misma incluyen una sal de adición de ácido tal como clorhidrato, nitrato, sulfato, fosfato, o acetato y similares.

40 El propio derivado de iminopiridina muestra excelentes efectos de control de plagas frente a plagas de insectos, y se mezcla y usa con otros agentes para el control de plagas, mostrando de ese modo excelentes efectos de control de plagas en comparación a cuando se usa un agente individual. Por lo tanto, la presente invención proporciona una composición para el control de plagas preparada para que contenga al menos uno de los derivados de iminopiridina y al menos uno de otros agentes para el control de plagas. Además, la presente invención proporciona una excelente composición para el control de plagas preparada para que contenga al menos uno de los derivados de iminopiridina y al menos uno de los otros insecticidas y/o fungicidas.

45 Algunos ejemplos de una composición para el control de plagas proporcionada por la presente invención incluyen un agente para el control de plagas para agricultura y horticultura, un agente para el control de plagas parasitarias animales, un agente para controlar plagas de higiene, un agente para controlar plagas molestas, un agente para controlar plagas de grano almacenado y productos almacenados, un agente para controlar plagas domésticas y similares, incluyendo ejemplos preferentes de las mismas un agente para el control de plagas para agricultura y horticultura y un agente para el control de plagas parasitarias animales.

50 Algunos ejemplos de especies de insectos frente a las que una composición para el control de plagas que contiene un derivado de iminopiridina o al menos una sal de adición de ácido del mismo, y al menos uno de otros agentes para el control de plagas muestra efectos de control de plagas incluyen plagas de lepidópteros (por ejemplo, *Spodoptera litura*, noctuido de la col, *Mythimna separata*, oruga de la col, polilla de la col, *Spodoptera exigua*, barrenador del arroz, gusano barrenador de la hierba, tortricidos, polilla del manzano, polilla minadora, polilla de penacho, *Agrotis* spp), *Helicoverpa* spp, *Heliothis* spp y similares), plagas de hemípteros (por ejemplo, áfidos (Aphididae, Adelgidae, Phylloxeridae) tales como *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*, *Aphis fabae*, áfido de la hoja de maíz, áfido del guisante, *Aulacorthum solani*, *Aphis craccivora*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum avenae*, *Methopolophium dirhodum*, *Rhopalosiphum padi*, insectos verdes, *Brevicoryne brassicae*, *Lipaphis erysimi*, *Aphis citricola*, pulgón rojo del manzano, podredumbre del manzano, *Toxoptera aurantii* y *Toxoptera citricidus*, saltahojas tales como *Nephotettix cincticeps* y *Empoasca vitis*, saltaplantas tales como *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens* y *Sogatella furcifera*, Pentatomorpha tales como *Eysarcoris ventralis*, *Nezara viridula* y *Trigonotylus coelestialium*, moscas blancas (Aleyrodidae) tales como mosca blanca del plomo del ciruelo, *Bemisia tabaci* y mosca blanca de los invernaderos, y cochinillas de la viña (Diaspididae, Margarodidae, Ortheziidae, Aclerdiidae, Dactylopiidae, Kerridae, Pseudococcidae, Coccidae, Eriococcidae, Asterolecaniidae, Beesonidae,

Lecanodiaspididae, Cerococcidae y similares) tales como *Pseudococcus comstocki*, *Planococcus citri*, *Pseudaulacaspis pentagona* y *Aonidiella aurantii*), plagas de coleópteros (por ejemplo, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Callosobruchus chinensis*, *Tenebrio molitor*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Anomala cuprea*, *Anomala rufocuprea*, *Phyllotreta striolata*, *Aulacophora femoralis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Oulema oryzae*, *Bostrichidae*, *Cerambycidae* y similares), ácaros (por ejemplo, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus citri* y similares), plagas de himenópteros (por ejemplo, Tenthredinidae), plagas de ortópteros (por ejemplo, Acridioidea), plagas de dípteros (por ejemplo, Agromyzidae), plagas de tisanópteros (por ejemplo, *Thrips palmi*, *Frankliniella occidentalis* y similares), nematodos fitoparásitos (por ejemplo, Meloidogyne, *Pratylenchus*, *Aphelenchoides besseyi*, *Bursaphelenchus xylophilus* y similares), y similares, algunos ejemplos de zooparásitos incluyen Ixodidae (por ejemplo, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor occidentalis*, *Dermacentor variabilis*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis megapinosa* Saito, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes pacificus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes scapularis*, *Ornithodoros moubata pacificus* y *Rhipicephalus sanguineus*), Cheyletidae (por ejemplo, *Cheyletiella blakei* y *Cheyletiella yasguri*), Demodex (por ejemplo, *Demodex canis* y *Demodex cati*), Psoroptidae (por ejemplo, *Psoroptes communis*), Sarcoptidae (por ejemplo, *Chorioptes bovis* y *Otodectes cynotis*), Dermanyssidae (por ejemplo, *Ornithonyssus sylviarum*), *Dermanyssus gallinae*, Pterolichus (por ejemplo, *Megninia cubitalis* y *Pterolichus obtusus*), Trombiculidae (por ejemplo, *Helenicula miyagawai* y *Leptotrombidium akamushi*), Siphonaptera (por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Xenopsylla cheopis* y *Xenopsylla*), Mallophaga (por ejemplo, *Trichodectes canis* y *Menopon gallinae*), Anoplura (por ejemplo, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus*, *Pediculus humanus humanus*, *Pediculus humanus*, *Pthirus pubis* y *Cimex lectularius*), Díptera (por ejemplo, *Musca domestica*, *Hypoderma bovis*, *Stomoxys calcitrans* y *Gasterophilus*), Psychodidae (por ejemplo, *Phlebotomus*), *Glossina morsitans*, Tabanidae, *Ormosia tokionis* (por ejemplo, *Aedes albopictus* y *Aedes aegypti*), Culicidae (por ejemplo, *Culex pipiens pallens*), Anophelini, Ceratopogonidae y similares), Simuliidae, Ceratopogonidae, Reduviidae, *Monomorium pharaonis*, Nematoda (por ejemplo, Strongyloides, Ancylostomatoidea, Strongyloidea (por ejemplo, *Haemonchus contortus* y *Nippostrongylus braziliensis*), Trichostrongyloidea, Metastrongyloidea (por ejemplo, *Metastrongylus elongatus*, *Angiostrongylus cantonensis* y *Aelurostrongylus abstrusus*), Oxyuroidea, Haterakoidea (por ejemplo, *Ascaridia galli*), Ascaridoidea (por ejemplo, *Anisakis simplex*, *Ascaris suum*, *Parascaris equorum*, *Toxocara canis* y *Toxocara cati*), Spiruroidea (por ejemplo, Subuluroidea, *Gnathostoma spinigerum*, *Physaloptea praeputialis*, *Ascarops strongylina*, *Draschia megastoma* y *Ascaris hamulosa*, *Dracunculus medinensis*), Filarioidea (por ejemplo, *Dirofilaria immitis*, filariasis linfática, *Onchocerca volvulus* y *Loa loa*), Diactophymatoidea, Trichinella (por ejemplo, *Trichuris vulpis* y *Trichinella spiralis*), Trematoda (por ejemplo, *Schistosoma japonicum* y *Fasciola hepatica*), Acanthocephala, Taenia (por ejemplo, Pseudophyllidea (por ejemplo, *Spirometra erinaceieuropaei*) y Cyclophyllidea (por ejemplo, *Dipylidium caninum*)), Protozoa, y similares, y algunos ejemplos de plagas de higiene incluyen Periplaneta (por ejemplo, *Blattella germanica*), Acaridae (por ejemplo, *Tyrophagus putrescentiae*), e Isoptera (por ejemplo, *Coptotermes formosanus*). Entre ellas, los ejemplos preferentes de una especie de insecto, a la que se aplica el agente para el control de plagas de la presente invención, incluyen plagas de lepidópteros, plagas de hemípteros, plagas de tisanópteros, plagas de dípteros, plagas de coleópteros, Siphonaptera o Acari zooparásitos, *Dirofilaria immitis*, Periplaneta e Isoptera (por ejemplo, al menos una especie de insecto seleccionado entre el grupo que consiste en polilla de la col, *Spodoptera litura*, *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera*, *Nephotettix cincticeps*, *Frankliniella occidentalis*, *Aulacophora femoralis*, *Oulema oryzae*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Trigonotylus coelestialium*, *Musca domestica*, *Haemaphysalis longicornis*, *Dirofilaria immitis*, *Blattella germanica* y *Coptotermes formosanus*), y los ejemplos particularmente preferentes de los mismos incluyen polilla de la col, *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera*, *Nephotettix cincticeps*, *Aulacophora femoralis*, *Oulema oryzae*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Trigonotylus coelestialium*, *Musca domestica* y *Haemaphysalis longicornis*.

En la presente memoria descriptiva, algunos ejemplos de otros agentes para el control de plagas que se pueden mezclar con el derivado de iminopiridina incluyen un insecticida, un fungicida, un acaricida, un herbicida, un regulador del crecimiento de la planta y un agente de control para parásitos animales, y algunos ejemplos de un compuesto químico específico incluyen los que se describen en The Pesticide Manual (13ª edición y publicado por British Crop Protection Council) y SHIBUYA INDEX (15ª edición, 2010 y publicado por SHIBUYA INDEX RESEARCH GROUP).

Algunos ejemplos de otros agentes para el control de plagas que se puede mezclar con el derivado de iminopiridina incluyen preferentemente un insecticida, un fungicida, un herbicida y un agente de control para plagas parasitarias animales, y también los que se preparan por mezcla de un fungicida con un insecticida.

El otro agente para el control de plagas incluye imidacloprid, clotianidina, dinotefurán, tiametoxam, pimetozina, espinosad, fipronil, clorantraniliprol, ciantraniliprol, etofenprox, silafluofén, sulfoxaflor, flupiradifurona, flometoquina, benzoato de emamectina, cicloxaprid, cicloxaprid, 1-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato y afidopiropeno, o una sal de adición de ácido agrícola y zootécnicamente aceptable de los mismos, como insecticida; azoxistrobina, orisastrobina, tifulzamida, furametpir, tiadinil, isotianil, diclocimet, triciclazol, tebufloquina, simeconazol, validamicina, kasugamicina y pencicurón, como fungicida; y fipronil, imidacloprid, dinotefurán, amitraz, piriproxifén, espinosad, o una sal de adición de ácido agrícola y zootécnicamente aceptable de los mismos, como agente de control para plagas parasitarias animales.

La composición para el control de plagas de la presente invención se puede preparar usando el derivado de iminopiridina, otros insecticidas, fungicidas, herbicidas, o agentes de control para parásitos animales, y un vehículo agrícola y zootécnicamente aceptable (vehículo sólido, vehículo líquido, vehículo gaseoso, tensioactivo, dispersante, y otros ayudantes de preparación).

(Ejemplos específicos de preparaciones de pesticida)

Cuando la composición para el control de plagas de la presente invención es un agente para el control de plagas para plagas agrícolas y hortícolas, la composición se mezcla habitualmente con un vehículo agrícola y hortícolamente aceptable (vehículo sólido, vehículo líquido, vehículo gaseoso, tensioactivo, dispersante y otros ayudantes de preparación que se proporcionan en cualquier forma de formulación de concentrados emulsionables, formulaciones líquidas, suspensiones, polvos humedecibles, sustancias fluidas, polvos, gránulos, comprimidos, aceites, aerosoles, fumigaciones y similares).

Algunos ejemplos del vehículo sólido incluyen talco, bentonita, arcilla, caolín, tierra de diatomeas, vermiculita, carbón blanco, carbonato de calcio y similares.

Algunos ejemplos del vehículo líquido incluyen alcoholes tales como metanol, n-hexanol y etilenglicol, cetonas tales como acetona, metil etil cetona y ciclohexanona, hidrocarburos alifáticos tales como n-hexano, queroseno y aceite para lámpara, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y metil naftaleno, éteres tales como dietil éter, dioxano y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo, nitrilos tales como acetonitrilo e isobutilnitrilo, amidas de ácido tales como dimetilformamida y dimetilacetamida, aceites vegetales tales como aceite de haba de soja y aceite de semilla de algodón, dimetilsulfóxido, agua y similares.

Además, algunos ejemplos de los vehículos gaseosos incluyen GLP, aire, nitrógeno, ácido carbónico gaseoso, dimetil éter y similares.

Como el tensioactivo o dispersante para emulsión, dispersión, extensión y similar, es posible usar, por ejemplo, ésteres de alquilsulfonato, alquil (aril)sulfonatos, polioxialquileno alquil (aril) éteres, ésteres de alcoholes polihídricos, sulfonatos de lignina o similares.

Además, como el adyuvante para mejorar las propiedades de la preparación, es posible usar, por ejemplo, carboximetilcelulosa, goma arábiga, polietilenglicol, estearato de calcio o similares.

Los vehículos sólidos, vehículos líquidos, vehículos gaseosos, tensioactivos, dispersantes y adyuvantes mencionados anteriormente se pueden usar solos o en combinación, si fuera necesario.

El contenido de ingredientes activos en la preparación no se limita de forma particular, pero está habitualmente en el intervalo de un 1 a un 75 % en peso para el concentrado emulsionable, de un 0,3 a un 25 % en peso para el polvo, de un 1 a un 90 % en peso para el polvo humedecible, y de un 0,5 a un 10 % en peso para la formulación granular.

Los derivados de iminopiridina de una preparación que incluye los mismos y de una formulación mixta de otros agentes de control de plagas con los mismos se pueden aplicar a insectos de plaga, plantas, materiales de propagación de plantas (por ejemplo, semillas, hojas y tallos de plantas, raíces, suelo, superficie de agua y materiales para cultivo), salas que sufren la molestia de la invasión de plagas y similares. La aplicación de los mismos se puede llevar a cabo antes y después de la invasión de las plagas.

También se puede aplicar un agente para el control de plagas que incluye al menos uno de los derivados de iminopiridina a cultivos modificados genéticamente.

En un aspecto preferente de la misma, algunos ejemplos de una composición para el control de plagas que incluye además un vehículo agrícola y hortícolamente aceptable incluyen:

(1) una composición de polvo humedecible que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, de un 0,6 a un 30 % en peso de un agente humectante y un dispersante, y de un 20 a un 95 % en peso de un diluyente,

(2) una composición de gránulos dispersables en agua que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, de un 0,6 a un 30 % en peso de un agente humectante, un dispersante y un diluyente, y de un 20 a un 95 % en peso de un diluyente,

(3) una composición fluida que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, de un 5 a un 40 % en peso de un dispersante, un espesante, un anticongelante, un antiséptico y un agente antiespumante, y de un 20 a un 94 % en peso de agua,

(4) una composición de concentrado emulsionable que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, de un 1 a un 30 % en peso de un emulgente y un estabilizador de emulsión, y de un 20 a un 97 % en peso de un disolvente orgánico,

5 (5) una composición de polvo que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, y de un 70 a un 99,8 % en peso de un diluyente,

10 (6) una composición de polvo de bajo movimiento que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, y de un 70 a un 99,8 % en peso de un diluyente,

(7) una composición fina de microgránulos que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, de un 0,2 a un 10 % en peso de un disolvente o aglutinante, y de un 70 a un 99,6 % en peso de un diluyente,

15 (8) una composición de gránulos que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, de un 0,5 a un 30 % en peso de un a auxiliar de granulación (tensioactivo) y un diluyente, y de un 20 a un 98 % en peso de un diluyente,

20 (9) una composición de microcápsulas que contiene de un 0,1 a un 80 % en peso del derivado de iminopiridina, de un 0,1 a un 80 % en peso de un insecticida como el otro agente para el control de plagas, de un 1 a un 50 % en peso de un agente de cobertura, un emulgente, un dispersante y un antiséptico, y de un 20 a un 98 % en peso de agua. Preferentemente, algunos ejemplos de la misma incluyen composiciones de (2), (3), (6) y (8).

(Ejemplos específicos de formulaciones para animales)

25 Cuando el agente para el control de plagas de la presente invención es un agente de control para plagas parasitarias animales, el agente se proporciona en forma de formulaciones líquidas, concentrados emulsionables, gotas líquidas, pulverizaciones, preparaciones de espuma, gránulos, gránulos finos, polvo, cápsulas, píldoras, comprimidos, formulaciones masticables, inyecciones, supositorios, cremas, champús, aclarados, agentes de resina, fumigantes, cebos de veneno, y similares, y se proporciona de forma particularmente preferente en forma de formulaciones líquidas y gotas líquidas. Estas formas se pueden preparar usando los siguientes vehículos farmacéuticamente aceptables.

35 La formulación líquida también se puede mezclar con un adyuvante habitual para preparación, tal como un emulgente, un dispersante, un agente de extensión, un agente humectante, un agente de suspensión, un conservante y un propelente, y también se puede mezclar con un formador de película habitual. Como el tensioactivo para la emulsión, dispersión, extensión y similar, es posible usar, por ejemplo, jabones, polioxietileno alquil éteres, polioxietileno alquil aril éteres, éster de ácido graso de polioxietileno, alcoholes superiores, alquil aril sulfonatos y similares. Algunos ejemplos de dispersantes incluyen caseína, gelatina, polisacáridos, derivados de lignina, sacáridos, polímeros sintét

40 icos solubles en agua y similares. Algunos ejemplos de agentes humectantes y de extensión incluyen glicerina, polietilenglicol y similares. Algunos ejemplos de agentes de suspensión incluyen caseína, gelatina, hidroxipropilcelulosa, goma arábiga y similares, y algunos ejemplos de estabilizantes incluyen antioxidantes fenólicos (BHT, BHA y similares), antioxidantes de amina (difenilamina y similares), antioxidantes de azufre orgánico y similares. Algunos ejemplos de conservantes incluyen p-oxibenzoato de metilo, p-oxibenzoato de etilo, p-oxibenzoato de propilo, p-oxibenzoato de butilo, y similares. Los vehículos, tensioactivos, dispersantes y adyuvantes mencionados anteriormente se pueden usar solos o en combinación, si fuera necesario. Además, también se pueden incorporar perfumes, sinergistas y similares. El contenido adecuado del ingrediente activo en el agente para el control de plagas de la presente invención es habitualmente de un 1 a un 75 % en peso para la formulación líquida.

50 Algunos ejemplos de vehículos usados para la preparación de cremas incluyen hidrocarburos no volátiles (parafina líquida y similares), grasas y aceites hidrogenados de lanolina, ácidos grasos superiores, ésteres de ácidos grasos, aceites animales y vegetales, aceites de silicona, agua, y similares. Además, también se pueden usar emulgentes, humectantes, antioxidantes, perfumes, bórax y absorbentes de ultravioleta ya sea solos o en combinación, si fuera necesario. Algunos ejemplos de emulgentes incluyen ácidos grasos de sorbitán, polioxietileno alquil éteres, y ácidos grasos de polioxietileno y similares. El contenido adecuado de los ingredientes activos en el agente para el control de plagas de la presente invención es habitualmente de un 0,5 a un 75 % en peso para la crema.

60 Las cápsulas, píldoras o comprimidos se pueden usar de un modo tal que los ingredientes activos en la composición de la presente invención se mezclen con un vehículo tal como almidón, lactosa o talco, a esto se añade un disgregante y/o un diluyente, tal como estearato de magnesio y, si fuera necesario, la mezcla se conforma en comprimidos.

65 Los vehículos para la preparación de inyecciones necesitan prepararse en forma de una solución aséptica, pero la solución puede contener otras sustancias, por ejemplo, una sal o glucosa suficiente para hacer isotónica la solución con la sangre. Como vehículos disponibles, las inyecciones necesitan prepararse en forma de una solución aséptica.

Para inyecciones, la solución puede contener, por ejemplo, una sal o glucosa suficiente para hacer isotónica la solución con la sangre. Algunos ejemplos de vehículos disponibles para la preparación de inyecciones incluyen ésteres tales como derivados de ácidos grasos de glicerina, benzoato de bencilo, miristato de isopropilo y propilenglicol, y disolventes orgánicos tales como N-metilpirrolidona y glicerol formal. El contenido de los ingredientes activos en el agente para el control de plagas de la presente invención es habitualmente de un 0,01 a un 10 % en peso para la inyección.

Algunos ejemplos de vehículos para la preparación de agentes de resina incluyen polímeros de cloruro de vinilo, poliuretano y similares. Se pueden añadir plastificantes tales como ésteres de ácido ftálico, ésteres de ácido adípico y ácido esteárico a estas bases, si fuera necesario. Después de que los ingredientes activos se amasen en la base, el producto amasado se puede moldear mediante moldeo por inyección, moldeo por extrusión, moldeo por presión, y similar. Además, el producto moldeado también se puede someter de forma apropiada a procesos tales como moldeo o corte para formar una marca auricular para animales o collares insecticidas para animales.

Algunos ejemplos de vehículos para cebos tóxicos incluyen sustancias de cebo y sustancias de atracción (harinas tales como harina de trigo y harina de maíz, almidón tal como almidón de maíz y almidón de patata, sacáridos tales como azúcar granulada, azúcar de malta y miel, aromas alimentarios tales como glicerina, aroma de cebolla y aroma de leche, polvos animales tales como polvo de pupa y polvo de pescado, diversas feromonas y similares). El contenido adecuado de los ingredientes activos en el agente para el control de plagas de la presente invención es habitualmente de un 0,0001 a un 90 % en peso del cebo tóxico.

La composición para el control de plagas de acuerdo con la presente invención se puede usar de un modo tal que se formule una forma de preparación preparada mediante la inclusión independiente de al menos uno del derivado de iminopiridina como ingrediente activo en la composición, o sales de adición de ácido del mismo y al menos uno de los otros agentes para el control de plagas que se han especificado anteriormente solos, y estos ingredientes se mezclen en el momento cuando se usen.

Por lo tanto, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención, se proporciona un producto combinado preparado por inclusión de al menos uno del derivado de iminopiridina como ingrediente activo o sales de adición de ácido del mismo y al menos uno de otros agentes para el control de plagas como se especifica en la reivindicación 1.

De acuerdo con otro aspecto preferente de la presente invención, en el producto combinado, el derivado de iminopiridina o las sales de adición de ácido del mismo, se proporciona como una primera composición preparada por inclusión del mismo como ingrediente activo, y se proporcionan otros agentes para el control de plagas como una segunda composición preparada por inclusión de los mismos como ingredientes activos. En este caso, la primera composición y la segunda composición pueden ser cualquier forma de formulación que use vehículos o adyuvantes apropiados en una combinación de los mismos de la misma manera que en el caso de la composición para el control de plagas mencionada anteriormente. El producto combinado se puede proporcionar en forma de un conjunto farmacéutico.

De acuerdo con otro aspecto más de la presente invención, se proporciona un método para proteger plantas o animales útiles contra plagas, incluyendo: aplicar simultánea o independientemente (preferentemente, cada ingrediente simultáneamente) al menos uno del derivado de iminopiridina, enantiómeros del mismo, mezclas del mismo o sales de adición de ácido del mismo como ingrediente activo y al menos uno de otros agentes para el control de plagas a la región que se va a tratar.

En el método, aplicar "simultáneamente" también incluye mezclar al menos uno del derivado de iminopiridina o sales de adición de ácido del mismo y al menos uno de otros agentes para el control de plagas antes de aplicarse a la región que se va a tratar, y aplicar la mezcla a esto. Aplicar "independientemente" incluye, sin mezclar estos ingredientes con anterioridad, aplicar el derivado de iminopiridina o las sales de adición de ácido del mismo antes que los demás ingredientes, o aplicar el derivado de iminopiridina o las sales de adición de ácido del mismo después que los demás ingredientes.

De acuerdo con otro aspecto preferente más de la presente invención, se proporciona un método para proteger plantas o animales útiles contra plagas, incluyendo: aplicar

- (1) una primera composición preparada por inclusión de al menos uno del derivado de iminopiridina representado por la Fórmula (I) o sales de adición de ácido del mismo como ingrediente activo, y
- (2) una segunda composición preparada por inclusión de al menos uno de otros agentes para el control de plagas como ingrediente activo a la región que se va a tratar.

De acuerdo con aún otro aspecto de la presente invención, se proporciona un método para proteger plantas útiles contra plagas, incluyendo: aplicar la composición o el producto combinado de la presente invención como tal o diluido a plagas, plantas útiles, semillas de plantas útiles, suelo, vehículos de cultivo o animales como diana, y preferentemente a plantas útiles, suelo o animales.

De acuerdo con aún otro aspecto más de la presente invención, se proporciona el uso de la composición o el producto combinado de la presente invención con el fin de proteger plantas o animales útiles contra plagas.

5 Además, los ejemplos preferentes del método para aplicar la composición o el producto combinado de la presente invención a plagas, plantas útiles, semillas de plantas útiles, suelo o vehículos de cultivo como diana incluyen tratamiento mediante pulverización, tratamiento de la superficie del agua, tratamiento del suelo (mezcla, irrigación y similares), tratamiento en criadero, tratamiento superficial (aplicación, revestimiento de polvo y cobertura) o tratamiento mediante fumigación (tratamiento en un espacio cerrado, tal como cobertura del suelo con una película de Polyfilm después de inyección en el suelo) y similares, y los ejemplos más preferentes incluyen tratamiento de la superficie del agua, tratamiento del suelo, tratamiento en criadero o tratamiento superficial.

15 La cantidad total en el caso de aplicación a plantas mediante tratamiento por pulverización es de 0,1 g a 10 kg por 10 áreas de tierra cultivada y preferentemente de 1 g a 1 kg, como cantidad de ingredientes activos de la composición de la presente invención.

20 Además, algunos ejemplos de un método para tratar semillas, raíces, tubérculos, bulbos o rizomas de plantas incluyen un método de inmersión, un método de revestimiento de polvo, un método de untado, un método de pulverización, un método de sedimentación, un método de revestimiento y un método de fumigación para la semilla. El método de inmersión es un método en el que la semilla se sumerge en una solución química líquida, y el método de revestimiento de polvo se clasifica en un método de revestimiento de polvo seco en el que un compuesto químico granular se adhiere a las semillas secas, y un método de revestimiento de polvo húmedo en el que un compuesto químico en polvo se adhiere a semillas que se han remojado ligeramente en agua. Además, el método de untado es un método en el que se aplica un compuesto químico suspendido a la superficie de las semillas con una mezcladora y el método de pulverización es un método en el que un compuesto químico suspendido se pulveriza sobre la superficie de la semillas. Además, el método de sedimentación es un método en el que un compuesto químico se mezcla con una carga y se trata cuando las semillas sedimentan conjuntamente con la carga para formar microgránulos que tienen cierto tamaño y forma, el método de revestimiento es un método en el que una película que contiene un compuesto químico se reviste sobre las semillas, y el método de fumigación es un método en el que las semillas se esterilizan con un compuesto químico que se ha gasificado en un recipiente cerrado herméticamente.

30 Algunos ejemplos del método de tratamiento preferente de la composición de la presente invención incluye un método de inmersión, un método de revestimiento de polvo, un método de untado, un método de pulverización, un método de sedimentación y un método de revestimiento.

35 Además, la composición de la presente invención también se puede usar, además de semillas, en plantas germinadas que se trasplantan después de la germinación o después de brotar del suelo, y plantas embrionarias. Estas plantas se pueden proteger mediante el tratamiento de la totalidad o una parte de las mismas por inmersión antes del trasplante.

40 La cantidad total en el caso de aplicación a semillas de plantas no se limita de forma particular, pero es preferentemente de 1 g a 10 kg y más preferentemente de 100 g a 1 kg por 100 kg de semillas, como cantidad de ingredientes activos de la composición de la presente invención.

45 Además, el método para aplicar la composición de la presente invención al suelo no se limita de forma particular, pero los métodos de aplicación preferentes son los que siguen a continuación.

50 Algunos ejemplos del método incluyen un método en el que se aplican gránulos que incluyen la composición de la presente invención al interior del suelo o sobre el suelo. De forma particularmente preferente, los métodos de aplicación al suelo incluyen pulverización, aplicación en franjas, aplicación en surcos, y aplicación en el hoyo de plantación.

Además, la aplicación por irrigación del suelo con una solución preparada por emulsión o disolución de la composición de la presente invención en agua también es un método preferente de aplicación al suelo.

55 Además de estos métodos, algunos ejemplos de métodos de aplicación al suelo preferentes incluyen la aplicación a una solución nutriente en sistemas de cultivo de solución nutriente tales como medio de cultivo sólido, por ejemplo, cultivo hidropónico, cultivo en arena, NFT (técnica de película nutriente), cultivo en lana de roca y similares para la producción de hortalizas y plantas con flor, o la aplicación a un criadero para plántulas de arroz con cáscara (mezcla con lecho de siembra y similar). El compuesto de la presente invención se puede aplicar directamente a tierra de cultivo artificial incluyendo vermiculita y un medio sólido que incluye una esterilla artificial para el crecimiento de plántulas.

65 La cantidad total de la composición de la presente invención en la superficie del agua, un criadero o el suelo no se limita de forma particular, pero es de 0,1 g a 10 kg de ingredientes preferentemente activos por 10 áreas de terreno cultivado y preferentemente de 1 g a 1 kg. Además, como método para aplicar la composición o el producto combinado de la presente invención a un organismo aplicado, es posible controlar las plagas por administración de

la composición para el control de plagas de la presente invención al organismo por aplicación ya sea por vía oral o mediante inyección, administración completa o parcial de la composición a la superficie corporal de un animal aplicado, o cobertura del agente para el control de plagas formulado en una preparación de resina o preparación de lámina sobre el organismo aplicado. Además, también es posible controlar las plagas por cobertura de los lugares en los que se esperan la invasión, parasitación y movimiento de las plagas con la composición para el control de plagas de la presente invención.

La composición para el control de plagas de la presente invención se puede usar como tal, pero se puede diluir con agua, vehículos líquidos, champús disponibles en el mercado, aclarados, cebos, fondos de jaulas de cría y similares y aplicar en algunos casos. Cuando la composición para el control de plagas de la presente invención se diluye con un líquido de dilución (agua) tal como un concentrado emulsionable, una sustancia fluida y un polvo humectable y se usa, la cantidad no se limita de forma particular pero, preferentemente, la composición se aplica por dilución del compuesto en agua y pulverización de la mezcla de un modo tal que la concentración de los ingredientes activos sea de 10 a 10.000 ppm. Además, cuando la composición para el control de plagas de la presente invención se administra a un organismo diana, la cantidad de administración del mismo no se limita de forma particular, pero cuando la composición se aplica por vía percutánea, la cantidad de la composición está preferentemente en el intervalo de 0,01 a 500 mg por 1 kg de peso corporal del organismo diana. Cuando la composición se administra por vía oral, la cantidad de la composición está en el intervalo de 0,01 a 100 mg por 1 kg de peso corporal del organismo diana. Cuando se cubre el organismo diana con una preparación de resina, la cantidad de la composición contenida en la preparación de resina está preferentemente en el intervalo de un 0,01 a un 50 % en peso por peso de la preparación de resina.

### Ejemplos

En lo sucesivo en el presente documento, la presente invención se describirá de forma específica por referencia a los Ejemplos.

Ejemplo de síntesis de P1: N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto P212)

(1) Se disolvieron 25 g (270 mmol) de 2-aminopiridina en 200 ml de diclorometano anhidro, se añadieron a esto 41 ml (30 g, 300 mmol) de trietilamina, y la mezcla se enfrió a 0 °C. A esto, se añadieron gota a gota 38 ml (57 g, 270 mmol) de ácido trifluoroacético anhidro durante 15 minutos, y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se inyectó en aproximadamente 100 ml de agua enfriada en hielo, y la mezcla se agitó durante 10 minutos. La mezcla se transfirió a un embudo de separación para llevar a cabo una separación líquida, y la fase orgánica se lavó dos veces con 150 ml de agua y dos veces con 150 ml de una solución acuosa al 1 % de HCl, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 36 g (71 % de rendimiento) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida.

RMN <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 7,20 (1H, ddd), 7,83 (1H, td), 8,20 (1H, d), 8,35 (1H, d), 10,07 (1H, s a)  
 RMN <sup>13</sup>C (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 115,3, 115,5 (c), 121,6, 139,1, 147,9, 149,5, 155,3 (c)  
 MS: m/z = 191 (M+H).

(2) Se disolvieron 20 g (126 mmol) de 2-cloro-5-clorometil piridina en 200 ml de acetonitrilo anhidro, se añadieron a esto 24 g (126 mmol) de la 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida obtenida mediante el método descrito anteriormente y 21 g (151 mmol) de carbonato potásico, y la mezcla resultante se calentó a reflujo durante 6 horas, y a continuación se agitó a temperatura ambiente durante 10 horas. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se filtró y el líquido se concentró a presión reducida. Se añadió a esto dietil éter para cristalización, y los cristales obtenidos de ese modo se recogieron y se lavaron bien con dietil éter y agua.

Los cristales obtenidos de ese modo se secaron a presión reducida a 60 °C durante 1 hora para obtener el material objetivo. La cantidad obtenida fue 26 g (66 % de rendimiento).

RMN <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 5,57 (2H, s), 6,92 (1H, td), 7,31 (1H, d), 7,80 (1H, td), 7,87 (1H, dd), 7,99 (1H, dd), 8,48 (2H, m)  
 RMN <sup>13</sup>C (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 53,8, 115,5, 117,2 (c), 122,1, 124,7, 130,0, 139,2, 140,0, 142,5, 149,7, 151,8, 158,9, 163,5 (c)  
 MS: m/z = 316 (M+H).

(3) Análisis cristalino mediante rayos X de polvo

En la difracción de rayos X de polvo, la medición se llevó a cabo en las siguientes condiciones.

Nombre del dispositivo: RINT-2200 (Rigaku Corporation)  
 Rayos X: Cu-Kα (40 kV, 20 mA)  
 Intervalo de barrido: 4 a 40°, anchura de muestreo: 0,02° y tasa de barrido: 1°/min.

Los resultados son los que siguen a continuación.

Ángulo de difracción (2 $\theta$ ) 8,7°, 14,2°, 17,5°, 18,3°, 19,8°, 22,4°, 30,9° y 35,3°.

5

(4) Calorimetría diferencial de barrido (DSC)

En la calorimetría diferencial de barrido, la medición se llevó a cabo en las siguientes condiciones.

10

Nombre del dispositivo: DSC-60

Celda de muestra: aluminio

Intervalo de temperatura: 50 °C a 250 °C (velocidad de recalentamiento: 10 °C/min).

Como resultado, se observó el punto de fusión de 155 °C a 158 °C.

15

Otro método del Ejemplo de síntesis P1

Se disolvieron 3,00 g (18,6 mmol) de 2-cloro-5-clorometilpiridina en 20 ml de DMF anhidra, se añadieron a esto 1,75 g (18,6 mmol) de 2-aminopiridina, y la mezcla resultante se agitó a 80 °C durante 8 horas y a temperatura ambiente durante 5 horas. Después de que se completara la reacción, se retiró por destilación la DMF a presión reducida, se añadió acetonitrilo a esto para precipitar un sólido, y el sólido se recogió, se lavó bien con acetonitrilo y se secó para obtener 2,07 g (44 % de rendimiento) de clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina.

20

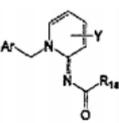
25

RMN <sup>1</sup>H (DMSO-d<sub>6</sub>,  $\delta$ , ppm): 5,65 (2H, s), 6,96 (1 H, t), 7,23 (1H, m), 7,57 (1 H, d), 7,80 (1H, m), 7,91 (1H, m), 8,28 (1H, m), 8,49 (1H, d), 9,13 (2H, s a)

Se disolvieron 50 mg (0,20 mmol) del clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina obtenido en el método descrito anteriormente en 5 ml de diclorometano anhidro, se añadieron a esto secuencialmente 122 mg (1,00 mmol) de DMAP y 50 mg (0,24 mmol) de ácido trifluoroacético anhidro en condiciones de refrigeración en hielo, y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico al 1 %, y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El diclorometano se retiró por destilación a presión reducida para obtener el material objetivo. La cantidad obtenida fue 42 mg (67 % de rendimiento). Los datos de RMN fueron los mismos que los del método descrito anteriormente.

35

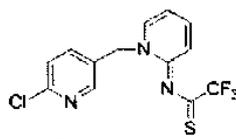
[Tabla 40-1]

					
Compuesto n.º	Ar	R <sub>1a</sub>	Y	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , $\delta$ , ppm)	IR (KBr, $\nu$ , cm <sup>-1</sup> ) o MS
P212	6-cloro-3-piridilo	CF <sub>3</sub>	H	5,57 (2H, s), 6,92 (1H, td), 7,31 (1H, d), 7,80 (1H, td), 7,87 (1H, dd), 7,99 (1H, dd), 8,48 (2H, m)	m/z = 316 (M+H)

Ejemplo de síntesis de 4: N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroetanoamida (Compuesto 1-20)

40

[Fórmula Química 49]



(1) Se disolvieron 25 g (270 mmol) de 2-aminopiridina en 200 ml de diclorometano anhidro, se añadieron a esto 41 ml (30 g, 300 mmol) de trietilamina, la mezcla se enfrió a 0 °C. A esto, se añadieron gota a gota 38 ml (57 g, 270 mmol) de ácido trifluoroacético anhidro durante 15 minutos, y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se inyectó en aproximadamente 100 ml de agua enfriada en hielo, y la mezcla se agitó durante 10 minutos.

45

La mezcla se transfirió a un embudo de separación para llevar a cabo una separación líquida, la fase orgánica se lavó dos veces con 150 ml de agua y dos veces con 150 ml de una solución acuosa al 1 % de HCl, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida para obtener 36 g (71 % de rendimiento) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida.

5 RMN <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 7,20 (1H, m), 7,83 (1H, m), 8,20 (1H, d), 8,35 (1H, d), 10,07 (1H, s a)

RMN <sup>13</sup>C (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 115,3, 115,5 (c), 121,6, 139,1, 147,9, 149,5, 155,3 (c).

(2) Se disolvieron 20 g (126 mmol) de 2-cloro-5-clorometil piridina en 200 ml de acetonitrilo anhidro, se añadieron a esto 24 g (126 mmol) de la 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida obtenida mediante el método descrito anteriormente y 21 g (151 mmol) de carbonato de potasio, y la mezcla resultante se calentó a reflujo durante 6 horas, y a continuación se agitó a temperatura ambiente durante 10 horas. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió dietil éter a esto para cristalización, y los cristales obtenidos de ese modo se recogieron y se lavaron bien con dietil éter y agua.

15 Los cristales obtenidos de ese modo se secaron a presión reducida a 60 °C durante 1 hora para obtener N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (P212). La cantidad obtenida fue 26 g (66 % de rendimiento).

RMN <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 5,57 (2H, s), 6,92 (1H, td), 7,31 (1H, d), 7,80 (1H, td), 7,87 (1H, dd), 7,99 (1H, dd), 8,48 (2H, m)

20 RMN <sup>13</sup>C (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 53,8, 115,5, 117,2 (c), 122,1, 124,7, 130,0, 139,2, 140,0, 142,5, 149,7, 151,8, 158,9, 163,5 (c)

MS: m/z = 316(M+H).

(3) Se añadieron 180 ml de tolueno a 16,3 g (36,7 mmol) de pentasulfuro de fósforo, se añadieron a esto 6,72 g (63,4 mmol) de carbonato sódico y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 5 minutos. A esto, se añadieron 20,0 g (63,4 mmol) de la N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida obtenida mediante el método descrito anteriormente, y la mezcla resultante se agitó a 50 °C durante 19 horas. Se añadieron 150 ml de acetato de etilo a la solución de reacción, la mezcla resultante se agitó a 50 °C durante 10 minutos, a continuación los materiales insolubles se retiraron por filtración, y se usaron 250 ml de acetato de etilo para lavar la mezcla. La mezcla se transfirió a un embudo de separación, se lavó en el mismo con 300 ml de bicarbonato sódico acuoso saturado y 200 ml de solución salina saturada, y a continuación se concentró a presión reducida. A esto se añadieron 200 ml de agua para precipitar cristales. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, y a continuación se recogieron los cristales, la suspensión se sometió a lavado dos veces con 150 ml de agua y dos veces con 150 ml de hexano, y se secó a 60 °C a presión reducida durante 2 horas para obtener el material objetivo. La cantidad obtenida fue 19,5 g (94 % de rendimiento).

35 RMN <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>, δ, ppm): 5,48 (2H, s), 7,12 (1H, td), 7,34 (1H, d), 7,77 (1H, dd), 7,96 (1H, m), 8,05 (1H, dd), 8,45 (1H, d), 8,56 (1H, d)

MS: m/z = 332(M+H).

40 Los compuestos mostrados en la siguiente Tabla se prepararon mediante el método de acuerdo con los Ejemplos de síntesis 1 a 4.

[Tabla 42-3]

1-20	20,0 g (63,4 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida	16,3 g (36,7 mmol) de pentasulfuro de fósforo	6,72 mg (63,4 mmol) de carbonato sódico	Tolueno	50 °C, 19 h	D	94
------	---	---	---	---------	-------------	---	----

[Tabla 43-2]

3-3	116 mg (0.72 mmol) de 2-fluoro-5-(bromometil)piridina	116 mg (0.68 mmol) de 2,2-difluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden))acetamida	110 mg (0.80 mmol) de carbonato potasio	Acetonitrilo	Reflujo, 6 h	A	27
-----	---	---	---	--------------	--------------	---	----

[Tabla 49-1]

Compuesto n.º	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ, ppm)	MS o IR (KBr, ν, cm <sup>-1</sup> )
1-20	5,48 (2H, s), 7,12 (1H, td), 7,34 (1H, d), 7,77 (1H, dd), 7,96 (1H, m), 8,05 (1H, dd), 8,45 (1H, d), 8,56 (1H, d)	m/z = 332 (M+H)

Ejemplo de Preparación

5 [Ejemplo de Preparación]

Ejemplo de Preparación 1 [Polvo humedecible]

Compuesto P212	10 % en peso
Imidacloprid	20 % en peso
Arcilla	50 % en peso
Carbón blanco	2 % en peso
Tierra de diatomeas	13 % en peso
Ligninasulfonato de calcio	4 % en peso
Lauril sulfato sódico	1 % en peso

Los ingredientes se mezclaron homogéneamente y se molieron para obtener un polvo humedecible.

Ejemplo de Preparación 2 [Granulo dispersable en agua]

Compuesto P212	10 % en peso
Imidacloprid	20 % en peso
Arcilla	60 % en peso
Dextrina	5 % en peso
Copolímero de maleato de alquilo	4 % en peso
Lauril sulfato sódico	1 % en peso

10

Los ingredientes se molieron y se mezclaron homogéneamente, se añadió agua a esto para mezclar bien los ingredientes y a continuación la mezcla se granuló y se secó para obtener gránulos dispersables en agua.

Ejemplo de Preparación 3 [Sustancias fluidas]

Compuesto 1-20	5 % en peso
Imidacloprid	20 % en peso
Sulfato de POE poliestirilfenil éter	5 % en peso
Propilenglicol	6 % en peso
Bentonita	1 % en peso
Solución acuosa al 1 % de goma de xantano	3 % en peso
PRONALEX-300 (TOHO Chemical Industry Co., Ltd.)	0,05 % en peso
ADDAC827 (KI Chemical Industry Co., Ltd.)	0,02 % en peso
Agua	Añadir hasta un 100 % en peso

15 Todos los ingredientes excepto la solución acuosa al 1 % de goma de xantano y una cantidad adecuada de agua se mezclaron previamente juntos de la mezcla, y la mezcla se molió a continuación mediante un aparato de molienda en húmedo. A continuación, se añadieron a esto la solución acuosa al 1 % de goma de xantano y el agua restante para obtener un 100 % en peso de sustancias fluidas.

Ejemplo de Preparación 4 [Concentrado emulsionable]

Compuesto P212	2 % en peso
Imidacloprid	13 % en peso
N,N-dimetilformamida	20 % en peso
Solvesso 150 (Exxon Mobil Corporation)	55 % en peso
Polioxietileno alquil aril éter	10 % en peso

20

Los ingredientes se mezclaron y se disolvieron homogéneamente para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de Preparación 5 [Polvo]

Compuesto P212	0,5 % en peso
Imidacloprid	1,5 % en peso
Arcilla	60 % en peso
Talco	37 % en peso
Estearato de calcio	1 % en peso

Los ingredientes se mezclaron homogéneamente para obtener polvo.

Ejemplo de Preparación 6 [Polvo DL]

Compuesto P212	1 % en peso
Tebufloquina	1 % en peso
Etofenprox	1 % en peso
Arcilla DL	94,5 % en peso
Carbón blanco	2 % en peso
Parafina líquida ligera	0,5 % en peso

Los ingredientes se mezclaron homogéneamente para obtener polvo.

Ejemplo de Preparación 7 [Microgránulo fino]

Compuesto P212	1 % en peso
Imidacloprid	1 % en peso
Vehículo	94 % en peso
Carbón blanco	2 % en peso
Hisol SAS-296	2 % en peso

5 Los ingredientes se mezclaron homogéneamente para obtener polvo.

Ejemplo de Preparación 8 [Gránulos]

Compuesto 1-20	2 % en peso
Clorantraniliprol	1 % en peso
Bentonita	39 % en peso
Talco	10 % en peso
Arcilla	46 % en peso
Ligninasulfonato de calcio	2 % en peso

Los ingredientes se molieron y se mezclaron homogéneamente, se añadió agua a esto para amasar bien los ingredientes, y a continuación la mezcla se granuló y se secó para obtener gránulos.

10

Ejemplo de Preparación 9 [Microcápsulas]

Compuesto 1-20	2 % en peso
Imidacloprid	3 % en peso
Resina de uretano	25 % en peso
Emulgente/dispersante	5 % en peso
Antiséptico	0,2 % en peso
Agua	64,8 % en peso

Las microcápsulas se obtuvieron por formación de un revestimiento de resina de uretano sobre la superficie de las partículas del compuesto representado por la Fórmula (I) y partículas de imidacloprid usando los ingredientes mediante polimerización interfacial.

15

Ejemplo de Preparación 10 [Gránulos]

Compuesto P212	2 % en peso
Probenazol	24 % en peso
Lauril sulfato sódico	1 % en peso
Bentonita	2 % en peso
Estearato de calcio	1 % en peso
PVA	2 % en peso
Arcilla	68 % en peso

Los ingredientes se molieron y se mezclaron homogéneamente, se añadió agua a esto para amasar bien los ingredientes, y a continuación la mezcla se granuló y se secó para obtener gránulos.

Ejemplo de Preparación 11 [Gránulos]

Compuesto P212	2 % en peso
Clorantraniliprol	1 % en peso
Probenazol	24 % en peso
Bentonita	40 % en peso
Talco	10 % en peso
Arcilla	21 % en peso
Ligninasulfonato de calcio	2 % en peso

20

Los ingredientes se molieron y se mezclaron homogéneamente, se añadió agua a esto para amasar bien los ingredientes, y a continuación la mezcla se granuló y se secó para obtener gránulos.

Ejemplo de Preparación 12 [Gotas líquidas]

Compuesto 1-20	10 % en peso
Fipronil	1 % en peso
Alcohol bencílico	73,9 % en peso
Carbonato de propileno	15 % en peso
BHT	0,1 % en peso

Los ingredientes se agitaron y se disolvieron homogéneamente para obtener gotas líquidas.

Ejemplo de Preparación 13 [Gotas líquidas]

Compuesto P212	48 % en peso
Fipronil	2 % en peso
Etanol	50 % en peso

5 Los ingredientes se mezclaron homogéneamente para obtener gotas líquidas.

Ejemplo de Preparación 14 [Concentrado emulsionable]

Compuesto 1-20	5 % en peso
Etoxazol	5 % en peso
Xileno	35 % en peso
Dimetilsulfóxido	35 % en peso

Los ingredientes se disolvieron, y a esto se añadieron un 14 % en peso de polioxietileno estiril fenil éter y un 6 % de dodecibencenosulfonato sódico, y la mezcla se agitó y se mezcló bien para obtener un concentrado emulsionable al 10 %.

10

Ejemplo de Preparación 15 [Gotas líquidas]

Compuesto P212	10 % en peso
Etoxazol	5 % en peso
Glicol (glicol mono alquil éter)	85 % en peso
BHT o BHA	Cantidad apropiada

Se añadió una cantidad apropiada de monooleato de sorbitán o monolaurato de sorbitán, monoglicérido de ácido caprílico o monoglicérido de ácido iso-esteárico, o monocaprilato de polietilenglicol a los ingredientes, y a esto se añadieron alcohol o carbonato de propileno, N-metil-2-pirrolidona o agua para obtener gotas líquidas en un 100 % en peso.

15

Ejemplo de Ensayo de Referencia

20 <Ensayo de tratamiento foliar de agente individual>

Ejemplo de Ensayo de Referencia 1 Ensayo de control de plagas de *Plutella xylostella*

Un disco de hoja que tiene un diámetro de 5,0 cm se cortó de una col en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en el disco de hoja. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

25

30

$$\text{Mortalidad (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

35

Ejemplo de Ensayo de Referencia 2 Ensayo de control de plagas de *Spodoptera litura*

Un disco de hoja que tiene un diámetro de 5,0 cm se cortó de una col en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en el disco de hoja. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de tercer estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

40

45

Mortalidad (%) = {número de larvas muertas/(número de larvas que sobreviven + número de larvas muertas)} x 100

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 500 ppm.

5

Ejemplo de Ensayo de Referencia 3 Ensayo de control de plagas de *Aphis gossypii*

Un disco de hoja que tiene un diámetro de 2,0 cm se cortó de un pepino en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en el disco de hoja. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de primer estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

10

15

Mortalidad (%) = {número de larvas muertas/(número de larvas que sobreviven + número de larvas muertas)} x 100

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

20

Ejemplo de Ensayo de Referencia 4 Ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

Una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en las hojas en una plántula de arroz en un cultivo en maceta. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

25

30

Mortalidad (%) = {número de larvas muertas/(número de larvas que sobreviven + número de larvas muertas)} x 100

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

35

Ejemplo de Ensayo de Referencia 5 Ensayo de control de plagas de *Nilaparvata lugens*

Una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en las hojas en una plántula de arroz en un cultivo en maceta. Después de un proceso de secado con aire, estadio se liberaron en esto larvas de segundo. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

40

45

Mortalidad (%) = {número de larvas muertas/(número de larvas que sobreviven + número de larvas muertas)} x 100

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

50

Ejemplo de Ensayo de Referencia 6 Ensayo de control de plagas de *Sogatella furcifera*

Una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en las hojas en una plántula de arroz en un cultivo en maceta. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Cuatro días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

55

60

Mortalidad (%) = {número de larvas muertas/(número de larvas que sobreviven + número de larvas muertas)} x 100

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

65

Ejemplo de Ensayo de Referencia 7 Ensayo de control de plagas de *Nephotettix cincticeps*

Una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en las hojas en una plántula de arroz en un cultivo en maceta. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Cuatro días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, el compuesto P212 exhibió una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 8 Ensayo de control de plagas de *trialeurodes vaporariorum*

Se liberaron moscas blancas de invernadero adultas en un pepino en un cultivo en maceta y se permitió que pusieran huevos durante una noche. Un día después del comienzo de la puesta de huevos, se retiraron los adultos y se dejó que los huevos reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la finalización de la puesta de huevos, un disco de hoja que tiene un diámetro de 2,0 cm se cortó del pepino, se confirmó que se habían puesto huevos, y a continuación una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en el disco de hoja. Después de la pulverización, se dejó que el disco de hoja reposara en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Catorce días después de la pulverización, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de huevos puestos} - \text{número de larvas que sobreviven}}{\text{número de huevos puestos}} \right\} \times 100$$

Como resultado, el compuesto P212 exhibió una alta actividad insecticida que tenía la mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 9 Ensayo de control de plagas de *Frankliniella occidentalis*

Un disco de hoja que tiene un diámetro de 2,8 cm se cortó de una judía en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en el disco de hoja. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en larvas de primer estadio en el disco de hoja. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una alta actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 500 ppm.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 10 Ensayo de control de plagas de *Trigonotylus caelestialium*

Se sumergieron las hojas y los tallos de plántulas de trigo cuatro días después de la diseminación de las plántulas durante 30 segundos en una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible). Después de un proceso de secado con aire, las hojas y los tallos de las plántulas de trigo se colocaron en un tubo de vidrio, y se liberaron dos larvas de segundo estadio de *Trigonotylus caelestialium* en el mismo tubo de vidrio. Después de que se liberaran las larvas, el tubo se tapó para dejar que las larvas reposaran en una cámara termostática a 25 °C. Con el fin de suministrar agua al trigo durante el ensayo, se proporcionó agua al trigo desde el fondo del tubo de vidrio. Tres días después del tratamiento, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la tasa de mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por triplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor mediante un tratamiento de inmersión de la solución de fármaco a 50 ppm.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 11 Ensayo de control de plagas de *Plautia crossota stali*

Una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en una fruta joven de manzana recogida en el exterior. Después de un proceso de secado con aire, la fruta joven se colocó en una taza de plástico, y se liberaron en esto dos adultos de *Plautia crossota stali*. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de los adultos, la mortalidad de los adultos se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de adultos (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de adultos muertos}}{\text{número de adultos que sobreviven} + \text{número de adultos muertos}} \right\} \times 100$$

Como resultado, el compuesto P212 exhibió una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 60 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 50 ppm.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 12 Ensayo de control de plagas de *Oulema oryzae*

Se aplicó por vía tópica 1 µl (/cabeza) de una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) preparado a una concentración predeterminada con acetona y se trató en la parte posterior de adultos recogidos en el exterior mediante una micro jeringa. Después del tratamiento de fármaco, los adultos se transfirieron a plántulas de arroz y se dejó que reposaran en una cámara termostática a 25 °C de modo que se obtuvieran 5 cabezas por talla. Cuarenta y ocho horas después del tratamiento, se observó la supervivencia por la muerte de los adultos, y la mortalidad de los adultos se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de adultos (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de adultos muertos}}{\text{número de adultos que sobreviven} + \text{número de adultos muertos}} \right\} \times 100$$

Como resultado, el compuesto P212 exhibió una alta actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor con una cantidad total de 0,5 µg/cabeza.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 13 Ensayo de control de plagas de *Musca domestica*

Se trató la parte posterior de adultos hembra crecidos en interior con 1 µl (/cabeza) de una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) preparado a una concentración predeterminada con acetona. Después del tratamiento de fármaco, los adultos se transfirieron a una taza de plástico y se dejó que reposaran en una cámara termostática a 25 °C de modo que se obtuvieran 5 cabezas por taza. Veinticuatro horas después del tratamiento, se observó la situación de agonía de los adultos, y se calculó la tasa de adultos agonizantes mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de adultos (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de adultos muertos}}{\text{número de adultos que sobreviven} + \text{adultos muertos}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una alta actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor con una cantidad total de 2 µg/cabeza.

<Ensayo de empapado de suelo de agente individual>

Ejemplo de Ensayo de Referencia 14 Ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

Una plántula de arroz en un cultivo en maceta se sometió a tratamiento de empapado de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Tres días después del tratamiento, diez larvas de segundo estadio de *Laodelphax striatella* se liberaron cada una en esta. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una alta actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor con una cantidad total de 0,05 mg/plántula.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 15 Ensayo de control de plagas de *Sogatella furcifera*

Una plántula de arroz en un cultivo en maceta se sometió a tratamiento de empapado de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Tres días después del tratamiento, diez larvas de segundo estadio de *Sogatella furcifera* se liberaron cada una en esta. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una alta actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor con una cantidad total de 0,05 mg/plántula.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 16 Ensayo de control de plagas de *Nilaparvata lugens*

Una plántula de arroz en un cultivo en maceta se sometió a tratamiento de empapado de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I), que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Tres días después del tratamiento, diez larvas de segundo estadio de *Nilaparvata lugens* se liberaron cada una en esta. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una alta actividad insecticida que tenía una tasa de mortalidad de un 80 % o mayor con una cantidad total de 0,05 mg/plántula.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 17 Ensayo de control de plagas de *Lissorhoptrus oryzophilus*

Una plántula de arroz en un cultivo en maceta se sometió a tratamiento de empapado de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I), que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Dos días después del tratamiento, cinco adultos de *Lissorhoptrus oryzophilus* se liberaron cada uno en esta. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, el compuesto P212 exhibió una alta actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor con una cantidad total de 0,1 mg/plántula.

Ejemplo de Ensayo de Referencia 18 Ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

Se trataron las raíces una plántula de trigo cuarenta y ocho horas después de la diseminación de las semillas con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. El fármaco se absorbió desde las raíces durante 72 horas, y a continuación diez larvas de segundo estadio de *Laodelphax striatella* se liberaron cada una en esta. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Cuatro días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos P212 y 1-20 exhibieron una actividad insecticida que tenía una mortalidad de un 80 % o mayor con una cantidad total de 20 µg/plántula.

Los resultados de los Ejemplos de Ensayo de Referencia 1, 3 y 18 se muestran en la siguiente Tabla.

[Tabla 55-1]

Compuesto de ejemplo de referencia n.º	Ar	Y	R	<i>Plutella xylostella</i> (Ejemplo de Ensayo de Referencia 1)	<i>Aphis gossypii</i> (Ejemplo de Ensayo de Referencia 3)	<i>Laodelphax striatella</i> (Ejemplo de Ensayo de Referencia 18)
P-212	6-cloro-3-piridilo	H	COCF <sub>3</sub>	100	100	100

[Tabla 55-2]

1-20	6-cloro-3-piridilo	H	CSCF <sub>3</sub>	100	100	100
------	--------------------	---	-------------------	-----	-----	-----

5

[Tabla 55-3]

3-3	6-fluoro-3-piridilo	H	COCHF <sub>2</sub>	50	100	80
-----	---------------------	---	--------------------	----	-----	----

<Efectos frente a plagas resistentes a insecticidas>

Ejemplo de Ensayo de Referencia 19 Ensayo de control de plagas de *Nilaparvata lugens*

10

Una plántula de arroz en un cultivo en maceta se sometió a empapado de suelo con una solución del compuesto de Fórmula (I), que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Tres días después del tratamiento, diez larvas de segundo estadio de *Nilaparvata lugens*, que se habían recogido en el exterior y habían proliferado en el exterior, se liberaron cada una en la plántula de arroz. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

15

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

20

Además, con fines de comparación, se llevó a cabo el ensayo frente a una especie de *Nilaparvata lugens* que es altamente susceptible a imidacloprid mediante el mismo método que se ha descrito anteriormente, y los resultados del mismo se muestran en la Tabla 45. Como se describe en la Tabla 45, el Compuesto P212 y el Compuesto 1-20 exhibieron altos efectos insecticidas frente a especies susceptibles y especies resistentes a fármacos de *Nilaparvata lugens*, y las tasas de mortalidad de larvas a 0,005 mg/plántula fueron (especies susceptibles) de un 100 % y un 100 %, (población resistente I) de un 95 % y un 77 % y (población resistente II) de un 100 % y un 85 %, respectivamente. Mientras tanto, las tasas de mortalidad de imidacloprid a 0,05 mg/plántula fueron (especies susceptibles) de un 100 %, (población resistente I) de un 38 % y (población resistente II) de un 69 %, y el efecto insecticida del mismo también fue bajo incluso a una dosis elevada. A partir de los resultados anteriores, resulta obvio que el Compuesto P212 y el Compuesto 1-20 tienen altos efectos insecticidas incluso frente a *Nilaparvata lugens* resistente frente a imidacloprid.

25

30

Además, para el origen de las plagas de ensayo, se usaron chinches recogidos en el exterior de la prefectura de Kumamoto (I) en 2007 y de la prefectura de Fukuoka (II) en 2005 como población resistente de *Nilaparvata lugens*, y chinches recogidos de la prefectura de Kagoshima y a continuación criados en interior durante un largo período de tiempo como población susceptible al imidacloprid de *Nilaparvata lugens*.

35

[Tabla 56]

Efectos insecticidas frente a <i>Nilaparvata lugens</i> (tasa de mortalidad%)				
	Cantidad total (mg/plántula)	Efectos frente a <i>Nilaparvata lugens</i>		
		Población susceptible	Población resistente I	Población resistente II
		Seis días después del tratamiento	Seis días después del tratamiento	Seis días después del tratamiento
P212	0,05	100	100	100
	0,005	100	95	100
1-20	0,01	95	100	100
	0,005	100	77	85
Imidacloprid	0,05	100	38	69
	0,01	100		39

40

<Ejemplo de ensayo de agente mixto>

Ejemplo de Ensayo 1 Ensayo de tratamiento de irrigación de suelo de *Laodelphax striatella*

5 Una plántula de arroz en un cultivo en maceta se sometió a tratamiento de empapado de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Después de la plántula de arroz se dejara reposar durante 3 días, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

15 
$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, cuando no hubo ningún efecto sinérgico, se calculó un valor teórico mediante la ecuación de Colby mostrado como sigue continuación, y los resultados se muestran en la Tabla.

20 
$$\text{Ecuación de Colby: valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B)/100$$

(A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se trataron solo con el Compuesto P212 o el Compuesto 1-20)  
B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se trataron solo con cada uno de imidacloprid, fipronil, clorraniliprol, espinosad, clotianidina, dinotefurán, sulfoxaflor, pimetrozina, tiametoxam, flupiradifurona y cicloxaprid))

Método para juzgar los efectos sinérgicos

30 Cuando la mortalidad frente a *Laodelphax striatella* en el caso de la mezcla con otro agente excedió el valor teórico proporcionado por la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

35 Se demostró que los agentes mixtos de los insecticidas de imidacloprid, fipronil, clorraniliprol, espinosad, clotianidina, dinotefurán, sulfoxaflor, pimetrozina, tiametoxam, flupiradifurona y cicloxaprid, que se proporcionaron y se sometieron a ensayo como el Compuesto P212, muestran todos una mortalidad de larvas adultos, exceden el valor teórico y tienen efectos sinérgicos.

40 Además, se demostró que los agentes mixtos de los insecticidas de imidacloprid y fipronil, que se proporcionaron y sometieron a ensayo como el Compuesto 1-20, muestran todos una mortalidad de larvas adultos, exceden el valor teórico y tienen efectos sinérgicos.

45 Además, se demostró que los agentes mixtos de los fungicidas de probenazol, isotianil, tiadinil y orisastrobina, que se proporcionaron y se sometieron a ensayo como el Compuesto P212, exhiben todos un efecto insecticida igual o mayor que el efecto insecticida cuando se trataron con el Compuesto P212 solo y se pueden mezclar y tratar con fungicida. Asimismo, se demostró que los agentes mixtos del fungicida de probenazol, que se proporcionaron y se sometieron a ensayo como el Compuesto 1-20, exhiben un efecto insecticida igual o mayor que el efecto insecticida cuando se trataron con el Compuesto 1-20 solo y se pueden mezclar y tratar con un fungicida.

<Ejemplo de agente mixto con insecticida>

50 [Tabla 57]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	39
Imidacloprid	0,005	0	70
Fipronil	0,005	26	65
Clorraniliprol	0,05	9	60
Espinosad	0,5	0	62

[Tabla 58]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	39
Imidacloprid	0,005	0	39
Fipronil	0,005	26	55
Clorantraniliprol	0,05	9	44
Espinosad	0,5	0	39

[Tabla 59]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto	P212
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	18
Clotianidina	0,005	23	56
Dinotefurán	0,005	0	30
Sulfoxaflor	0,005	1	63
Pimetrozina	0,05	15	89

[Tabla 60]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	18
Clotianidina	0,005	23	37
Dinotefurán	0,005	0	18
Sulfoxaflor	0,005	1	19
Pimetrozina	0,05	15	30

[Tabla 61]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	14
Tiametoxam	0,01	23	45

[Tabla 62]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	14

Tiametoxam	0,01	23	34
------------	------	----	----

[Tabla 63]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>			
Nombre del insecticida	Tasa mg/Plántula	Compuesto P212	
		0	0,005
-	-	0	45
Flupiradifurona	0,01	5	85

[Tabla 64]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del insecticida	Tasa mg/Plántula	Compuesto P212	
		0	0,005
-	-	0	45
Flupiradifurona	0,01	5	48

[Tabla 65]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>			
Nombre del insecticida	Tasa mg/Plántula	Compuesto 1-20	
		0	0,005
-	-	0	12
Imidacloprid	0,005	0	74
Fipronil	0,001	0	80

[Tabla 66]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del insecticida	Tasa mg/Plántula	Compuesto 1-20	
		0	0,005
-	-	0	12
Imidacloprid	0,005	0	12
Fipronil	0,001	0	12

[Tabla 67]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	0
Ciclozaprid	0,005	0	7

[Tabla 68]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	0,005

-	-	0	0
Ciclozaprid	0.005	0	0

[Tabla 69]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>					
Nombre del fungicida	Tasa	Compuesto P212		Compuesto 1-20	
	mg/Plántula	0	0,005	0	0,005
-	-	0	39	0	8
Probenazol	0,5	9	59	9	65

[Tabla 70]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby					
Nombre del fungicida	Tasa	Compuesto P212		Compuesto 1-20	
	mg/Plántula	0	0,005	0	0,005
-	-	0	39	0	8
Probenazol	0.5	9	44	9	16

[Tabla 71]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>			
Nombre del fungicida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	19
Isotianil	0,5	5	30
Tiadinil	0,5	8	30
Orisastrobina	0,5	4	70

[Tabla 72]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del fungicida	Tasa	Compuesto P212	
	mg/Plántula	0	0,005
-	-	0	19
Isotianil	0,5	5	23
Tiadinil	0,5	8	25
Orisastrobina	0,5	4	22

10 Ejemplo de Ensayo 2 Ensayo de tratamiento foliar frente a *Laodelphax striatella*

Una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en las hojas en una plántula de arroz en un cultivo en maceta. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

20

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \{ \text{número de larvas muertas} / (\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}) \} \times 100$$

Además, cuando no hubo ningún efecto sinérgico, se calculó un valor teórico mediante la ecuación de Colby  
5 mostrado como sigue a continuación, y los resultados se muestran en la Tabla.

$$\text{Ecuación de Colby: Valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B) / 100$$

(A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el Compuesto P212 o el Compuesto 1-20)  
10 B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con etofenprox o silafluofén))

Método para juzgar los efectos sinérgicos

15 Cuando la mortalidad frente a *Laodelphax striatella* en el caso de la mezcla con otro agente excedió el valor teórico proporcionado por la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

Se demostró que los agentes mixtos de los insecticidas de etofenprox y silafluofén, que se proporcionaron y se sometieron a ensayo como el Compuesto P212 o el Compuesto 1-20, muestran todos una mortalidad de larvas o  
20 adultos aproximadamente igual al valor teórico, y se pueden mezclar con el insecticida incluso en un uso de tipo tratamiento foliar.

[Tabla 73]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Laodelphax striatella</i>				
Nombre del insecticida	Tasa (ppm)	-	Compuesto P212	Compuesto 1-20
		0	0,625	0,625
-	-	0	95	90
Etofenprox	10	30	90	95
Silafluofén	5	55	100	100

[Tabla 74]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby				
Nombre del insecticida	Tasa (ppm)	-	Compuesto P212	Compuesto 1-20
		0	0,625	0,625
-	-	0	95	90
Etofenprox	10	30	97	93
Silafluofén	5	55	98	95

25 Ejemplo de Ensayo 3 Ensayo de control de plagas de *Aphis gossypii*

Un disco de hoja que tiene un diámetro de 2,0 cm se cortó de un pepino en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una  
30 mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en esto. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de primer estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-  
35 período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \{ \text{número de larvas muertas} / (\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}) \} \times 100$$

40 Además, cuando no hubo ningún efecto sinérgico, se calculó un valor teórico mediante la ecuación de Colby mostrado como sigue a continuación, y los resultados se muestran en la Tabla.

$$\text{Ecuación de Colby: Valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B) / 100$$

45 (A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el Compuesto P212 o el Compuesto 1-20)

B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con afidopiropeno)

Método para juzgar los efectos sinérgicos

- 5 Cuando la mortalidad frente a *Aphis gossypii* en el caso de la mezcla con otro agente excedió el valor teórico proporcionado por la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

Se demostró que los agentes mixtos de los compuestos de Fórmula (II), que se proporcionaron y se sometieron a ensayo como el Compuesto P212 o el Compuesto 1-20, muestran todos mortalidad de larvas o adultos, exceden el valor teórico y tienen efectos enérgicos.

[Tabla 75]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Aphis gossypii</i>					
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212		Compuesto 1-20	
	ppm	0	0,313	0	0,625
-	-	0	45	0	19
Afidopiropeno	0,002	25	70	25	40

[Tabla 76]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby					
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212		Compuesto 1-20	
	ppm	0	0,313	0	0,625
-	-	0	45	0	19
Afidopiropeno	0,002	25	59	25	39

15

Ejemplo de Ensayo 4 Ensayo de control de plagas de *Plutella xylostella*

Un disco de hoja que tiene un diámetro de 5,0 cm se cortó de una col en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en esto. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

30

Además, cuando no hubo ningún efecto sinérgico, se calculó un valor teórico mediante la ecuación de Colby mostrado como sigue a continuación, y los resultados se muestran en la Tabla.

$$\text{Ecuación de Colby: Valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B)/100$$

35

(A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el Compuesto P212)

B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con flometoquina, espinosad, fipronil, clorantropilol, 1-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato, o afidopiropeno))

40

Método para juzgar los efectos sinérgicos

Cuando la mortalidad frente a *Plutella xylostella* en el caso de la mezcla con otro agente excedió el valor teórico proporcionado por la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

45

Se demostró que un agente mixto del insecticida de flometoquina, que se proporcionó y se sometió a ensayo, con el Compuesto P212, muestra una tasa de mortalidad de larvas o adultos, excede el valor teórico y tiene efectos enérgicos.

[Tabla 77]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a <i>Plutella xylostella</i>			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	ppm	0	1,25
-	-	0	0
Flometoquina	0,313	0	30

[Tabla 78]

Valor teórico (%) mediante la ecuación de Colby			
Nombre del insecticida	Tasa	Compuesto P212	
	ppm	0	1,25
-	-	0	0
Flometoquina	0,313	0	0

5

[Tabla 79]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Plutella xylostella*

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	1,0
—			0	40
Afidopiropeno	Tasa ppm	10	20	70
Espinosad		0,01	11	70

[Tabla 80]

Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	1,0
—			0	40
Afidopiropeno	Tasa ppm	10	20	52
Espinosad		0,01	11	45

10

[Tabla 81]

Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Plutella xylostella*

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	1,0
—			0	30
Afidopiropeno	Tasa ppm	5	0	80

[Tabla 82]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	1,0
—			0	30
Afidopiropeno	Tasa ppm	5	0	30

5

[Tabla 83]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Plutella xylostella*

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	2,0
—			0	60
Fipronil	Tasa ppm	0,04	50	100
Clorantraniliprol		0,002	60	100

[Tabla 84]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	2,0
—			0	60
Fipronil	Tasa ppm	0,04	50	80
Clorantraniliprol		0,002	60	84

10

[Tabla 85]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Plutella xylostella*

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	2,0
—			0	50
1-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato	Tasa ppm	1	30	70
Afidopiropeno		5	0	100

[Tabla 86]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	2,0
1-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato			1	30
Afidopiropeno			5	0
				65
				50

Ejemplo de Ensayo 5 Ensayo de control de plagas de *Spodoptera litura*

5 Un disco de hoja que tiene un diámetro de 5,0 cm se cortó de una col en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en esto. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de tercer estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

15 
$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

20 Además, se calculó un valor teórico para el caso de ningún efecto sinérgico usando la Ecuación de Colby que se da a continuación, y los resultados se muestran en las tablas.

Ecuación de Colby: 
$$\text{Valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B)/100$$

25 (A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el Compuesto P212)  
B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el insecticida clorantraniliprol, benzoato de emamectina, flometoquina, o afidopiropeno))

Método para juzgar los efectos sinérgicos

30 Cuando la mortalidad frente a *Spodoptera litura* en el caso de una mezcla con otro agente excedió el valor teórico dado mediante la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

35 Se demostró que un agente mixto del insecticida clorantraniliprol, benzoato de emamectina, flometoquina, o afidopiropeno sometido a ensayo con el Compuesto P212 muestra una mortalidad para larvas o adultos que excede del valor teórico y tiene efectos sinérgicos.

[Tabla 87]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Spodoptera litura* (1)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	20
Afidopiropeno			10	0
				40
				80

40

[Tabla 88]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	20
—			0	40
Afidopiropeno	Tasa ppm	10	0	40

5

[Tabla 89]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Spodoptera litura* (2)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	20
—			0	10
Clorantraniliprol	Tasa ppm	0,02	20	30
Benzoato de emamectina	Tasa ppm	0,02	0	20

[Tabla 90]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	20
—			0	10
Clorantraniliprol	Tasa ppm	0,02	20	28
Benzoato de emamectina	Tasa ppm	0,02	0	10

10

[Tabla 91]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Spodoptera litura* (3)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	50
—			0	10
Flometoquina	Tasa ppm	5	10	20
Afidopiropeno	Tasa ppm	5	0	50

[Tabla 92]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	50
—			0	10
Flometoquina	Tasa ppm	5	10	19
Afidopiropeno	Tasa ppm	5	0	10

Ejemplo de Ensayo 6 Ensayo de control de plagas de *Frankliniella occidentalis*

5 Un disco de hoja que tiene un diámetro de 2,8 cm se cortó de una judía común en un cultivo en maceta, y una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado de modo que fuera un 50 % de acetona en agua (Tween20 al 0,05 % disponible), se pulverizó en esto. Después de un proceso de secado con aire, se liberaron en esto larvas de primer estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

$$15 \text{ Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

20 Además, se calculó un valor teórico para el caso de ningún efecto sinérgico usando la Ecuación de Colby que se da a continuación, y los resultados se muestran en la tabla.

$$\text{Ecuación de Colby: Valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B)/100$$

(A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el Compuesto P212)

25 B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el insecticida imidacloprid, dinotefurán, o acetamiprid))

Método para juzgar los efectos sinérgicos

30 Cuando la mortalidad frente a *Frankliniella occidentalis* en el caso de una mezcla con otro agente excedió el valor teórico dado mediante la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

35 Se demostró que un agente mixto del insecticida imidacloprid o dinotefurán sometido a ensayo con el Compuesto P212 muestra una mortalidad para larvas o adultos que excede del valor teórico y tiene efectos sinérgicos.

[Tabla 93]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Frankliniella occidentalis* (1)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	10
—			0	69
Imidacloprid	Tasa ppm	20	69	94

[Tabla 94]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	10
—			0	69
Imidacloprid	Tasa ppm	20	69	90

5 [Tabla 95]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Frankliniella occidentalis*(2)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	20
—			0	70
Dinotefurán	Tasa ppm	5	35	85

[Tabla 96]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
—			0	20
—			0	70
Dinotefurán	Tasa ppm	5	35	81

10 Ejemplo de Ensayo 7 Ensayo de tratamiento de irrigación de suelo en *Chilo suppressalis*

Se sometió a plántulas de arroz en un cultivo en maceta a un tratamiento de irrigación de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Después de reposar durante 3 días, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. Esto fue seguido por reposo en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

20 
$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, se calculó un valor teórico para el caso de ningún efecto sinérgico usando la Ecuación de Colby que se da a continuación, y los resultados se muestran en la tabla.

25 
$$\text{Ecuación de Colby: Valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B)/100$$

30 (A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el Compuesto P212)  
B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el insecticida fipronil, ciantraniliprol o espinosad))

Método para juzgar los efectos sinérgicos

Cuando el efecto insecticida (tabla) frente a *Chilo suppressalis* en el caso de una mezcla con otro agente excedió el valor teórico dado mediante la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

5 Se demostró que un agente mixto del insecticida fipronil, ciantraniliprol o espinosad sometido a ensayo con el Compuesto P212 muestra una mortalidad para larvas o adultos que excede del valor teórico en ambos casos y tiene efectos si enérgicos.

10 [Tabla 97]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Chilo suppressalis* (1)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa mg/plántula	
—			0	0,01
—			0	33
Ciantraniliprol	Tasa mg/plántula	0,005	83	100

[Tabla 98]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa mg/plántula	
—			0	0,01
—			0	33
Ciantraniliprol	Tasa mg/plántula	0,005	83	89

15 [Tabla 99]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Chilo suppressalis* (2)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa mg/plántula	
—			0	0,002
—			0	40
Fipronil	Tasa mg/plántula	0,0005	40	80
Clorantraniliprol		0,0005	60	80
Espinosad		0,002	80	100

[Tabla 100]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa mg/plántula	
—			0	0,002
—			0	40
Fipronil	Tasa mg/plántula	0,0005	40	64
Clorantraniliprol		0,0005	60	76
Espinosad		0,002	80	88

Ejemplo de Ensayo 8 Ensayo de tratamiento de irrigación de suelo en *Naranga aenescens*

Se sometió a plántulas de arroz en un cultivo en maceta a un tratamiento de irrigación de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado para que fuera un 10 % de acetona en agua. Después de reposar durante 3 días, se liberaron en esto larvas de primera estadio. Esto fue seguido por reposo en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Cinco días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, se calculó un valor teórico para el caso de ningún efecto sinérgico usando la Ecuación de Colby que se da a continuación, y los resultados se muestran en la tabla.

$$\text{Ecuación de Colby: Valor teórico (\%)} = 100 - \frac{(A \times B)}{100}$$

(A: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el Compuesto P212)  
B: 100 - (mortalidad de larvas o adultos cuando se tratan solo con el insecticida espinosad o fipronil))

Método para juzgar los efectos sinérgicos

Cuando la mortalidad frente a *Naranga aenescens* en el caso de una mezcla con otro agente excedió el valor teórico dado mediante la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

Se demostró que un agente mixto del insecticida espinosad o fipronil sometido a ensayo con el Compuesto P212 muestra una mortalidad para larvas o adultos que excede del valor teórico en todos los casos y tiene efectos sinérgicos.

[Tabla 101]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Naranga aenescens*

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa mg/plántula	
—			0	0,01
			0	60
Espinosad	Tasa mg/plántula	0,005	40	100
Fipronil		0,01	20	80

[Tabla 102]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa mg/plántula	
—			0	0,01
			0	60
Espinosad	Tasa mg/plántula	0,005	40	76
Fipronil		0,01	20	68

Ejemplo de Ensayo 9 Ensayo en *Callosobruchus chinensis*

Un compuesto de Fórmula (I) y el insecticida indicado posteriormente, preparados en concentraciones predeterminadas usando acetona, se aplicaron separadamente por vía tópica a la parte trasera del mismo adulto de *Callosobruchus chinensis*. El *Callosobruchus chinensis* se introdujo a continuación en una taza de plástico y se mantuvo en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Un día

después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de los insectos, y se calculó la mortalidad de los insectos mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

5 
$$\text{Mortalidad de insectos (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de insectos muertos}}{\text{número de insectos que sobreviven} + \text{número de insectos muertos}} \right\} \times 100$$

Además, se calculó un valor teórico para el caso de ningún efecto sinérgico usando la Ecuación de Colby que se da a continuación, y los resultados se muestran en la tabla.

10 
$$\text{Ecuación de Colby: Valor teórico (\%)} = 100 - (A \times B)/100$$

(A: 100 - (mortalidad de insectos para el tratamiento solo con el Compuesto P212)  
B: 100 - (mortalidad de insectos para el tratamiento solo con el insecticida fipronil o imidacloprid))

15 **Método para juzgar los efectos sinérgicos**

Quando la mortalidad frente a *Callosobruchus chinensis* en el caso de una mezcla con otro agente excedió el valor teórico dado mediante la ecuación de Colby, se juzgó que estaba presente un efecto sinérgico.

20 Se demostró que el tratamiento conjunto con el insecticida fipronil o imidacloprid sometido a ensayo con el Compuesto P212 muestra una mortalidad de insectos que excede el valor teórico en ambos casos y tiene efectos sinérgicos.

25 [Tabla 103]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Callosobruchus chinensis*

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ng/cabeza	
—			0	0,2
—			0	20
Fipronil	Tasa ng/cabeza	0,2	0	36
Imidacloprid		0,2	40	60

[Tabla 104]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa ng/cabeza	
—			0	0,2
—			0	20
Fipronil	Tasa ng/cabeza	0,2	0	20
Imidacloprid		0,2	40	52

30 Ejemplo de Ensayo 10 Ensayo de control de plagas del añublo del arroz

Una plántula de arroz en un cultivo en maceta se sometió a tratamiento de irrigación de suelo con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I) a una concentración predeterminada, o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un insecticida como se indica posteriormente a una concentración predeterminada, que se había preparado con un 10 % de acetona en agua. Tres días después del tratamiento, una suspensión de esporas ( $2 \times 10^5$  ea/ml, Tween al 0,05 % disponible) de bacterias de añublo del arroz bacteria se pulverizó y se inoculó en esto, y la plántula de arroz se colocó en una cámara de humedad durante 24 horas para estimular la infección. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Siete días después de la inoculación, se midió el número de lesiones, y se calculó el valor preventivo mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por triplicado.

40 
$$\text{Valor preventivo} = \left\{ \frac{\text{número de lesiones en una zona sin tratamiento} - \text{número de lesiones en una zona con tratamiento}}{\text{número de lesiones sin tratamiento}} \right\} \times 100$$

Como resultado, se demostró que con una cantidad total de probenazol de 0,125 mg/plántula, cualquier agente mixto del Compuesto P212 y el Compuesto 1-20 exhibe un efecto insecticida igual al efecto insecticida cuando se trata con probenazol solo y se puede mezclar y tratar con un fungicida.

5

[Tabla 105]

Nombre del insecticida			Compuesto P212		Compuesto 1-20	
			Tasa mg/plántula			
			0	2,5	0	2,5
			0	3,3	0	52,5
Probenazol	Tasa mg/plántula	0,125	96,7	93,4	96,7	91,8

Ejemplo de Ensayo 11 Ensayo de control de añublo del arroz (tratamiento foliar)

10

Se trataron plántulas de arroz mediante aplicación foliar con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I), o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y el fungicida indicado posteriormente, preparada en una concentración predeterminada con un 10 % de acetona en agua. Después del tratamiento, una suspensión de esporas de añublo del arroz ( $1,5 \times 10^5$  ea/ml, Tween al 0,05 % disponible) se pulverizó y se inoculó en esto seguido de mantenimiento en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Catorce días después de la inoculación, se midió el número de lesiones, y se calculó el valor preventivo mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por triplicado.

15

$$\text{Valor preventivo} = \{(\text{número de lesiones en una zona sin tratamiento} - \text{número de lesiones en una zona con tratamiento}) / (\text{número de lesiones en una zona sin tratamiento})\} \times 100$$

20

Como resultado, se demostró que una concentración de tratamiento de 0,5 ppm usando tiadinil, isotianil, orisastrobina, triciclazol, diclocimet, tebufloquina, azoxistrobina o kasugamicina, el agente mixto con el Compuesto P212 también exhibe un efecto fungicida igual al del tratamiento con tiadinil, isotianil, orisastrobina, triciclazol, diclocimet, tebufloquina, azoxistrobina o kasugamicina solos y por lo tanto es posible un tratamiento mixto con un fungicida.

25

[Tabla 106]  
(Ensayo de añublo del arroz 1)

Nombre del fungicida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
			0	50
—			0	4
Tiadinil	Tasa ppm	0,5	0	18
Isotianil		0,5	66	72

30

[Tabla 107]  
(Ensayo de añublo del arroz 2)

Nombre del fungicida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
			0	50
—			0	16
Orisastrobina	Tasa ppm	0,5	20	91
Triciclazol		0,5	72	92
Diclocimet		0,5	8	52
Tebufloquina		0,5	48	72

[Tabla 108]  
(Ensayo de añublo del arroz 3)

Nombre del fungicida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
			0	50
—			0	0
Azoxistrobina	Tasa ppm	0,5	37	35
Kasugamicina		0,5	0	37

Ejemplo de Ensayo 12 Ensayo de control de podredumbre de la vaina de arroz (*Rhizoctonia solani*)

5 Seis semanas después de la plantación, se sometieron plántulas de arroz a tratamiento de pulverización foliar con una solución de fármaco del compuesto de Fórmula (I), o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un fungicida que se indica posteriormente, preparada en una concentración predeterminada con un 10 % de acetona en agua. Después de un proceso de secado con aire, un tapón de *Rhizoctonia solani* en crecimiento (cuadrado de agar de 1,0 cm<sup>2</sup> cada uno) se dejó reposar en la base del arroz. Esto fue seguido por  
10 mantenimiento en una cámara termostática (30 °C de día-25 °C de noche, período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad). Seis días después de la inoculación, se midió la altura de la lesión, y se calculó el valor preventivo mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

15 
$$\text{Valor preventivo} = \left\{ \frac{\text{altura de la lesión en una zona sin tratamiento} - \text{altura de la lesión en una zona con tratamiento}}{\text{altura de la lesión en una zona sin tratamiento}} \right\} \times 100$$

20 Como resultado, se demostró que, para una concentración de tratamiento de 5 ppm usando tifulzamida, furametpir, pencicurón, azoxistrobina, simeconazol, validamicina, o orisastrobina, el agente mixto con 50 ppm del Compuesto P212 presentó el mismo efecto fungicida que para el tratamiento con tifulzamida, furametpir, pencicurón, azoxistrobina, simeconazol, validamicina, u orisastrobina solos, y por lo tanto es posible el tratamiento mixto con un fungicida.

[Tabla 109]  
(Ensayo de podredumbre de la vaina 1)

Nombre del fungicida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
			0	50
—			0	14
Tifulzamida	Tasa ppm	5	92	97
Furametpir		5	77	94
Pencicurón		5	69	77

[Tabla 110]  
(Ensayo de podredumbre de la vaina 2)

Nombre del fungicida			Compuesto P212	
			Tasa ppm	
			0	50
—			0	9
Azoxistrobina	Tasa ppm	5	95	100
Simeconazol		5	5	24
Validamicina		5	32	74
Orisastrobina		5	72	59

Ejemplo de Ensayo 13 Ensayo con *Laodelphax striatellus* mediante tratamiento durante la fase vegetativa

Se plantó arroz en criaderos y se llevó a cabo la eclosión durante tres días a 30 °C seguido de transferencia de los criaderos a un invernadero de cristal a 25 °C. Durante la fase vegetativa cinco días antes de la plantación, los criaderos se trataron con una cantidad prescrita de un gránulo mixto de 0,24 mg/mg de probenazol (24 %) y 0,02 mg/mg del Compuesto P212 (2 %). Las plántulas de arroz se transportaron a macetas Wagner 1/5000a 22 días después de la plantación y se hicieron crecer en un invernadero a 25 °C. Se liberaron larvas de segundo estadio de *Laodelphax striatellus* en los días 13, 26, y 38 posteriores al trasplante de las macetas Wagner; esto fue seguido por mantenimiento en un invernadero de vidrio a 25 °C. Cinco días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

De acuerdo con los resultados, se mostró que el gránulo mixto de probenazol y el Compuesto P212 presentó un alto efecto insecticida de un 100 % de mortalidad y exhibió un control en un nivel práctico.

Ejemplo de Ensayo 14 Ensayo con *Laodelphax striatellus* mediante tratamiento de irrigación de suelo

Se sometieron plántulas de arroz en cultivo en macetas a un tratamiento de irrigación de suelo con una solución de fármaco de un compuesto de Fórmula (I) o una solución de fármaco de una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y un herbicida de arroz como se indica posteriormente, preparada en concentraciones predeterminadas de modo que fueran un 10 % de acetona en agua. Después de reposar durante tres días, se liberaron en esto larvas de segundo estadio. A continuación, se dejó que las larvas reposaran en una cámara termostática (período de 16 horas de luz-período de 8 horas de oscuridad) a 25 °C. Cinco días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de las larvas, y la mortalidad de las larvas se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se llevó a cabo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobreviven} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

El agente mixto de imazosulfurón, cafenstrol, cihalofop-butilo, daimurón y pirazolato se sometió a ensayo con el Compuesto P212 que mostró exhibir en todos los casos un efecto insecticida al menos igual que para el tratamiento con el Compuesto P212 por sí mismo, y de ese modo es posible un tratamiento mixto con un herbicida.

[Tabla 111]

Nombre del herbicida			Compuesto P212		
			Tasa mg/plántula		
			0	0,005	0,01
-			0	0	100
Imazosulfurón	Tasa mg/plántula	0,05	0	0	100
Cafenstrol		0,05	0	0	100
Cihalofop-butilo		0,05	0	0	100
Daimurón		0,05	0	0	100
Pirazolato		0,05	0	0	100

Ejemplo de Ensayo 15 Ensayo del control de *Haemaphysalis longicornis*

Una cápsula con un diámetro de 2 cm y una altura de 2 cm se unió a la superficie dorsal de un ratón. Un compuesto de Fórmula (I), ivermectina, moxidectina, permetrina, amitraz, fipronil, espinetram y la mezcla del compuesto de Fórmula (I) y cada insecticida se disolvieron en etanol para las concentraciones dadas en la Tabla O, y cada una de estas se hizo gotear en la superficie del cuerpo del ratón con una cápsula. Después de secar bien, se liberaron ocho ninfas de *Haemaphysalis longicornis* y la parte superior de la cápsula se selló con una tapa. El ratón se mantuvo en una jaula a 25 °C usando un período de luz de 12 horas y un período de oscuridad de 12 horas. Cinco días después de la liberación, se retiró la cápsula y se calculó el número de ninfas supervivientes y muertas y se contó el número de individuos hinchados y se calculó la mortalidad de insectos y la tasa agonal mediante la siguiente ecuación.

Mortalidad de insectos y tasa agonal (%) = {número de insectos muertos y agonales/(número de insectos que sobreviven + número de insectos muertos y agonales)} x 100

5 Los resultados mostraron que, con una tasa de 0,009 µg de ivermectina o moxidectina, el agente mixto de cualquiera de ellos con el Compuesto P212 también dio un efecto de control de garrapatas que fue el mismo que el tratamiento con ivermectina, moxidectina, permetrina, amitraz, fipronil, espinetram solos y de ese modo es posible el tratamiento mixto con ivermectina, moxidectina, permetrina, amitraz, fipronil, espinetram.

10 [Tabla 112]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Haemaphysalis longicornis* (1)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
			0	1,18
—			0	53
Ivermectina	Tasa µg	0,009	3	53
Moxidectina	µg	0,009	6	44

[Tabla 113]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Haemaphysalis longicornis* (2)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
			0	1,18
—			0	60
Amitraz	Tasa µg	0,38	41	90
Permetrina	µg	9,5	71	86

15 [Tabla 114]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
			0	1,18
—			0	60
Amitraz	Tasa µg	0,38	41	77
Permetrina	µg	9,5	71	88

[Tabla 115]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Haemaphysalis longicornis* (3)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
			0	1,18
—			0	38
fipronil	Tasa µg	0,38	78	93
espinetoram	µg	0,38	6	22

20

[Tabla 116]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
—			0	1,18
—			0	38
fipronil	Tasa	0,38	78	86
espinetoram	µg	0,38	6	41

5 [Tabla 117]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Haemaphysalis longicornis* (4)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
—			0	1,18
—			0	18
piriproxifén	Tasa	0,0475	2	44
espinosad	µg	1,9	2,5	43

[Tabla 118]  
Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
—			0	1,18
—			0	18
piriproxifén	Tasa	0,0475	2	20
espinosad	µg	1,9	2,5	20

10 [Tabla 119]  
Mortalidad (%) de agente individual y agente mixto frente a *Haemaphysalis longicornis* (5)

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
—			0	1,18
—			0	23
imidacloprid	Tasa	1,9	7,7	60
dinotefurán	µg	1,9	0	

[Tabla 120]  
 Valor teórico (%) mediante la Ecuación de Colby

Nombre del insecticida			Compuesto P212	
			Tasa µg	
—			0	1,18
—			0	23
imidacloprid	Tasa µg	1,9	7,7	32
dinotefurán		1,9	0	25

## REIVINDICACIONES

- 5 1. Una composición para el control de plagas que comprende al menos un derivado de iminopiridina seleccionado entre el grupo que consiste en N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida y N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroetano-tioamida y una sal de adición de ácido del mismo; y al menos un agente para el control de plagas distinto,
- 10 (i) en la que el agente para el control de plagas distinto es un insecticida y se selecciona entre el grupo que consiste en imidacloprid, clotianidina, dinotefurán, tiametoxam, pimetrozina, espinosad, fipronil, clorantraniliprol, ciantraniliprol, etofenprox, silafluofén, sulfoxaflor, flupiradifurona, flometoquina, benzoato de emamectina, cicloxaprid, 1-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato y afidopiropeno, o una sal de adición de ácido agrícola y zootécnicamente aceptable del mismo, o
- 15 en la que el agente para el control de plagas distinto es un fungicida seleccionado entre el grupo que consiste en azoxistrobina, orisastrobina, tifluzamida, furametpir, tiadinil, isotianil, diclocimet, triciclazol, tebufloquina, simeconazol, validamicina, kasugamicina y pencicurón, o
- 20 en la que el agente para el control de plagas distinto es un agente de control para plagas parasitarias animales y se selecciona entre el grupo que consiste en fipronil, imidacloprid, dinotefurán, amitraz, piriproxifén, espinosad o una sal de adición de ácido agrícola y zootécnicamente aceptable del mismo.
- 20 2. La composición para el control de plagas de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende un vehículo agrícola y zootécnicamente aceptable.
- 25 3. Un método para proteger plantas útiles de plagas que comprende aplicar la composición para el control de plagas de las reivindicaciones 1 o 2 a una región que se va a tratar.
- 30 4. Un método para proteger plantas útiles contra plagas mediante tratamiento de las plagas, plantas útiles, semillas de plantas útiles, suelo o vehículos de cultivo como diana con una cantidad eficaz de la composición para el control de plagas de las reivindicaciones 1 o 2.
5. Uso de la composición para el control de plagas de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 para proteger plantas útiles contra plagas.
6. La composición para el control de plagas de las reivindicaciones 1 o 2 para su uso en la protección de animales contra plagas.