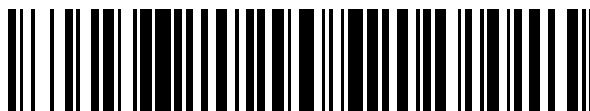


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 622 872**

51 Int. Cl.:

A01N 43/78	(2006.01)
A01N 47/24	(2006.01)
A01N 47/34	(2006.01)
A01N 47/40	(2006.01)
A01N 51/00	(2006.01)
C07D 237/12	(2006.01)
C07D 239/26	(2006.01)
C07D 239/30	(2006.01)
A01P 1/00	(2006.01)
A01P 15/00	(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **25.08.2009 PCT/US2009/054876**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **11.03.2010 WO10027779**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.08.2009 E 09764941 (2)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **15.03.2017 EP 2328413**

54 Título: **Composiciones plaguicidas que comprenden sulfoximinas N-sustituidas**

30 Prioridad:

27.08.2008 US 92077 P

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

07.07.2017

73 Titular/es:

**DOW AGROSCIENCES LLC (100.0%)
9330 Zionsville Road
Indianapolis, IN 46268-1054, US**

72 Inventor/es:

**NUGENT, BENJAMIN;
BENKO, ZOLTAN;
RENGA, JAMES;
LOSO, MICHAEL y
MARTIN, TIMOTHY**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 622 872 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

Composiciones plaguicidas que comprenden sulfoximinas N-sustituidas

Campo de la invención

5 Esta solicitud reivindica el beneficio de la Solicitud Provisional de E.E.U.U. número de serie 61/092.077 presentada el 27 de agosto de 2008. La invención descrita en este documento está relacionada con el campo de los plaguicidas y su uso en el control de plagas.

Antecedentes de la invención

10 Las plagas causan millones de muertes humanas en todo el mundo cada año. Además, hay más de diez mil especies de plagas que causan pérdidas en la agricultura. Estas pérdidas agrícolas ascienden a miles de millones de dólares cada año. Las termitas causan daños a varias estructuras como los hogares. Estas pérdidas por daños de termitas ascienden a miles de millones de dólares cada año. Como observación final, muchas plagas de alimentos almacenados comen y adulteran alimentos almacenados. Estas pérdidas de alimentos almacenados ascienden a miles de millones de dólares cada año, pero lo que es más importante, privan a la gente de la comida necesaria.

15 Existe una imperiosa necesidad de nuevos plaguicidas. Los insectos están desarrollando resistencia a los plaguicidas de uso corriente. Cientos de especies de insectos son resistentes a uno o más plaguicidas. El desarrollo de resistencia a algunos de los plaguicidas más antiguos, como el DTT, los carbamatos y los organofosfatos, es bien conocido, pero incluso se ha desarrollado resistencia a alguno de los nuevos plaguicidas.

20 La solicitud de patente internacional WO 2007/149134 describe sulfoximinas N-sustituidas eficaces en el control de insectos. Los compuestos descritos incluyen un anillo de pirimidina, unido a un átomo de azufre del grupo de sulfoximina. Sin embargo, aún existe la necesidad de nuevos plaguicidas y particularmente de plaguicidas que tengan nuevos modos de acción.

Sustituyentes (Lista no exhaustiva)

25 Los ejemplos dados para los sustituyentes son (excepto para halo) no exhaustivos y no deben ser interpretados como limitantes de la invención descrita en este documento.

“Alquenilo” significa un sustituyente acíclico, insaturado (al menos un doble enlace carbono-carbono), ramificado o no ramificado, sustituyente que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, vinilo, alilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo y decenilo.

30 “Alqueniloxi” significa un alquenilo que consiste además en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, aliloxi, buteniloxi, penteniloxi, hexeniloxi, hepteniloxi, octeniloxi, noneniloxi, y deceniloxi.

“Alcoxi” significa un alquilo que consiste además en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, 1-butoxi, 2-butoxi, isobutoxi, *tert*-butoxi, pentoxi, 2-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, hexoxi, heptoxi, octoxi, nonoxi, y decoxi.

35 “Alquilo” significa un sustituyente acíclico saturado, ramificado o no ramificado que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, isobutilo, *tert*-butilo, pentilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, y decilo.

“Alquinilo” significa un sustituyente acíclico, no saturado (al menos un enlace triple carbono-carbono, y cualquier doble enlace), ramificado o no ramificado, que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, etinilo, propargilo, butinilo, pentinilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo, y decinilo.

40 “Alquiniloxi” significa un alquinilo que consiste además en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, pentiniloxi, hexiniloxi, heptiniloxi, octiniloxi, noniniloxi, y deciniloxi.

“Ariilo” significa un sustituyente cíclico aromático que consiste en hidrógeno y carbono, por ejemplo, fenilo, naftilo, y bifenilo.

45 “Cicloalquenilo” significa un sustituyente monocíclico o policíclico, insaturado (al menos un doble enlace carbono-carbono) que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclobutenilo, ciclo-pentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, ciclodecenilo, norbornenilo, biciclo[2.2.2]octenilo, tetrahidronaftilo, hexahidronaftilo, y octahidronaftilo.

50 “Cicloalqueniloxi” significa un cicloalquenilo que consiste además en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclobuteniloxi, ciclo-penteniloxi, ciclohexeniloxi, ciclohepteniloxi, cicloocteniloxi, ciclodeceniloxi, norborneniloxi, y biciclo[2.2.2]octeniloxi.

“Cicloalquilo” significa un sustituyente monocíclico o policíclico, saturado que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclodecilo, norbornilo, biciclo [2.2.2]octilo, y decahidronaftilo.

5 “Cicloalcoxi” significa un cicloalquilo que consiste además en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, cicloheptiloxi, ciclooctiloxi, ciclodeciloxi, norborniloxi, y biciclo[2.2.2]octiloxi.

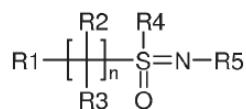
“Halo” significa flúor, cloro, bromo, y yodo.

10 “Haloalquilo” significa un alquilo que consiste además en, de uno al máximo número posible de halos idénticos o diferentes, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluorometilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, clorometilo, triclorometilo, y 1,1,2,2-tetrafluoroetilo.

15 “Heterocíclico” significa un sustituyente cíclico que puede estar totalmente saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado, donde la estructura cíclica contiene al menos un carbono y al menos un heteroátomo, donde dicho heteroátomo es nitrógeno, azufre u oxígeno, por ejemplo, benzofuranilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo, benzoxazolilo, benzotienilo, benzotiazolilcinolinilo, furanilo, indazolilo, indolilo, imidazolilo, isoindolilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, oxazolinilo, oxazolilo, ftalazinilo, pirazinilo, pirazolinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinoxalinilo, 1,2,3,4-terazolilo, tiazolinilo, tiazolilo, tienilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4- triazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,3-triazolilo, y 1,2,4-triazolilo.

Descripción detallada de la invención

Las composiciones plaguicidas de esta invención comprenden una molécula que tiene la siguiente fórmula general:



(1)

20

en donde

R1 es

(a) un pirimidinilo, piridazinilo o pirazinilo no sustituido, o

25 (b) un pirimidinilo, piridazinilo o pirazinilo sustituido, en donde cada pirimidinilo, piridazinilo o pirazinilo sustituido tiene uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxilo, halo, o halo(C₁-C₆) alquilo;

30 R2 es H, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxilo, halo, o halo(C₁-C₆) alquilo;

R3 es H, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxilo, halo, o halo(C₁-C₆) alquilo;

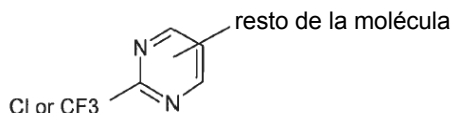
35 R4 es H, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxilo, halo, o halo(C₁-C₆) alquilo;

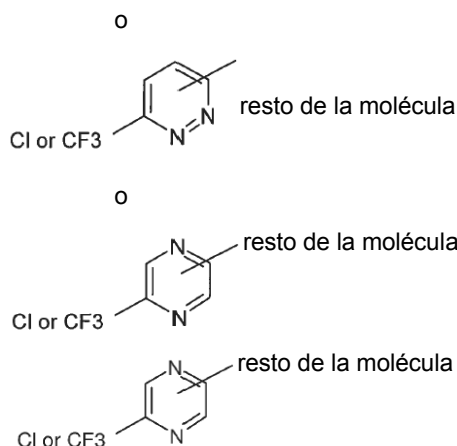
R5 es NO₂, CN, o CO₂R₆,

en donde R₆ = (C₁-C₃) alquilo; y

n es 0, 1, 2, o 3.

40 En otra realización de la invención, R1 es



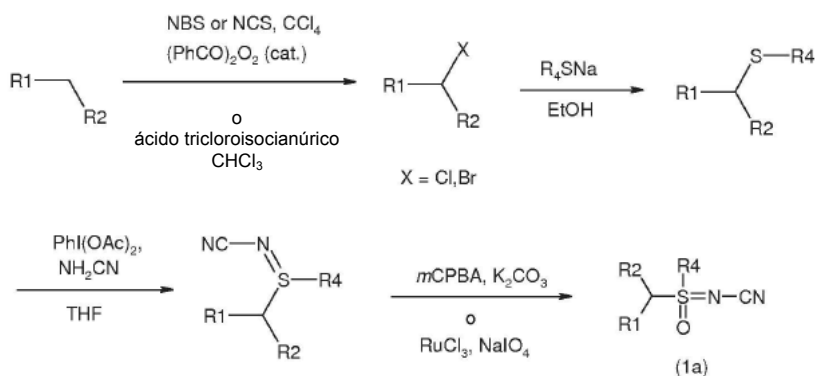


5

Pueden usarse procedimientos conocidos en la técnica para preparar las moléculas de esta memoria. En general, estas moléculas pueden prepararse como sigue.

Los compuestos de fórmula (1a), en donde R⁵ representa CN y R¹, R², R³, R⁴ son como se ha definido anteriormente, se pueden preparar mediante el método ilustrado en el Esquema A. El carbono del metileno adyacente al anillo heterocíclico R¹ se halogenó primero usando *N*-bromosuccinimida, *N*-clorosuccinimida, o ácido tricloroisocianúrico. El sulfuro se prepara mediante sustitución nucleofílica del haluro con la sal sódica de un tiolalquilo. El sulfuro se oxida con diacetato de yodobenceno en presencia de cianamida a 0°C para dar la sulfilimina. La reacción puede llevarse a cabo en un disolvente aprótico polar como diclorometano (CH₂Cl₂). La sulfilimina se oxida entonces con ácido *meta*-cloroperoxibenzóico (*m*CPBA). Se emplea una base como carbonato potásico para neutralizar la acidez de *m*CPBA. Se usan disolventes próticos polares como etanol y agua para aumentar la solubilidad del material de partida de sulfilimina y de la base empleada. La sulfilimina también se puede oxidar con solución acuosa de peryodato sódico o potásico en presencia de un catalizador como tricloruro de rutenio hidrato o similar. El disolvente orgánico para esta catálisis puede ser un disolvente aprótico polar como CH₂Cl₂, cloroformo, o acetonitrilo.

20 Esquema A

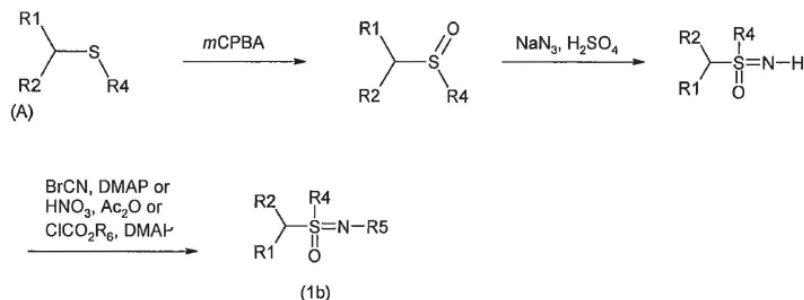


Los compuestos de fórmula (1b), en donde R¹, R², R³, R⁴ son como se han definido anteriormente y R⁵ es CN, NO₂, o CO₂R₆, se pueden preparar a partir del sulfuro mediante los métodos ilustrados en el Esquema B. El sulfuro se oxida con *m*CPBA en un disolvente polar por debajo de 0°C para proporcionar el sulfóxido. En la mayoría de los casos, el CH₂Cl₂ es un disolvente preferido para la oxidación. Después se imina el sulfóxido con azida sódica en presencia de ácido sulfúrico concentrado en un disolvente aprótico bajo calentamiento para proporcionar la sulfoximina. En la mayoría de los casos, el cloroformo es un disolvente preferido para esta reacción. El nitrógeno de la sulfoximina puede ser cianado con bromuro de cianógeno en presencia de una base, nitrado con ácido nítrico en presencia de anhídrido acético a temperatura ligeramente elevada, o carboxilado con un cloroformiato de alquilo (R⁶) en presencia de una base como 4-dimetilaminopiridina (DMAP) para proporcionar la sulfoximina *N*-sustituida. Se requiere una base para una cianación y carboxilación eficaces y la base preferida es DMAP, mientras que el ácido sulfúrico se usa como un catalizador para una reacción de nitración eficaz.

25

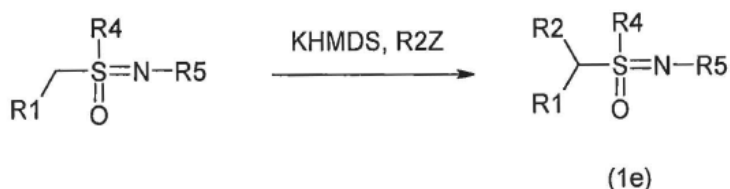
30

Esquema B



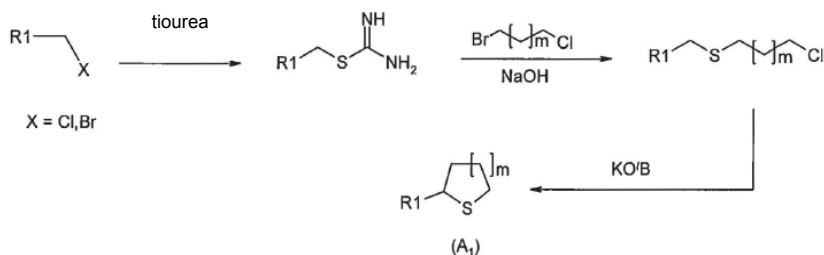
5 El carbono α de la sulfoximina *N*-sustituida, donde, R^2 y $R^3 = H$ y R^1 , R^4 y R^5 son como se han definido previamente, se pueden alquilar o halogenar adicionalmente (R^2) en presencia de una base como hexametildisilazida de potasio (KHMDS) para dar sulfoximinas *N*-sustituidas de fórmula (1e), en donde R^1 , R^4 , R^5 son como se definieron previamente y Z es un grupo saliente apropiado, como se ilustra en el Esquema E. Los grupos salientes preferidos son yoduro ($R^2 =$ alquilo), bencenosilfonimida ($R^2 = F$), tetracloroetano ($R^2 = Cl$), y tetrafluoroetano ($R^2 = Br$).

Esquema E



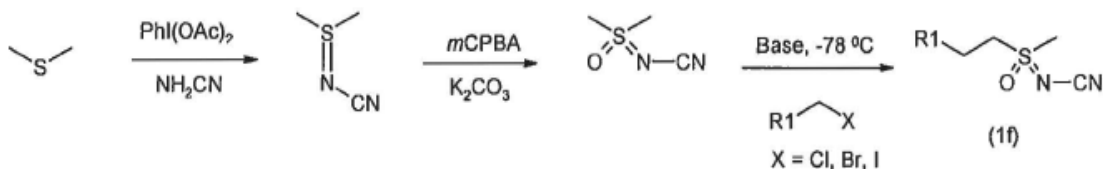
10 En el Esquema F, el sulfuro de fórmula (A₁) se puede preparar a partir del correspondiente clorometil heterociclo sustituido por tratamiento con tiourea, hidrólisis y posterior alquilación con bromo cloroalcano apropiado ($m = 0, 1,$ o 2) en condiciones de base acuosa, y ciclación en presencia de una base como potasio-*t*-butóxido en un disolvente aprótico polar como tetrahidrofurano (THF).

15 Esquema F



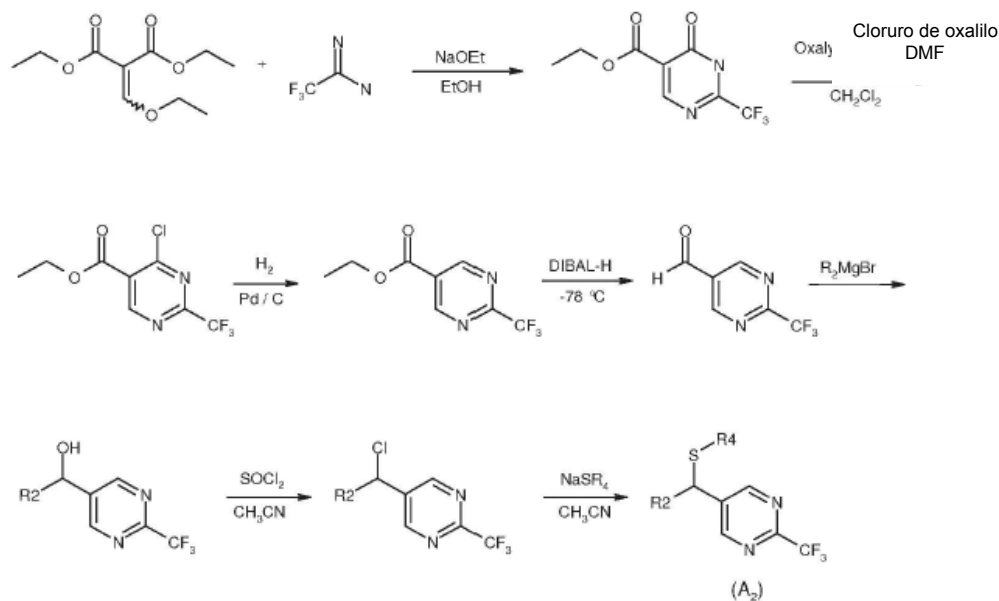
20 Los compuestos de sulfoximina de la fórmula (1f) en donde $n = 2$, R^2 y R^3 son hidrógeno y R^1 , R^4 y R^5 son como se definieron previamente, se pueden preparar mediante el método ilustrado en el Esquema G. El dimetilsulfuro se oxida con diacetato de yodobenceno en presencia de cianamida a $0^\circ C$ para dar la correspondiente sulfilimina. La reacción puede llevarse a cabo en un disolvente aprótico polar como CH_2Cl_2 o THF. La sulfilimina se oxida después con *m*CPBA. Se emplea una base como carbonato potásico para neutralizar la acidez de *m*CPBA. Se usan disolventes polares próticos como etanol y agua para aumentar la solubilidad del material de partida de sulfilimina y de la base empleada. El carbono α de la sulfoximina *N*-sustituida se puede alquilar con un haluro de metilo heteroaromático en presencia de una base como KHMDS o butil-litio (*n*BuLi) para dar la sulfoximina *N*-sustituida deseada. El haluro preferido puede ser bromuro, cloruro o yoduro.

Esquema G



5 Los compuestos sulfurosos de la fórmula (A₂) se pueden preparar por el método ilustrado en el Esquema H. El éster dietílico del ácido 2-etoximetilén-malónico se hace reaccionar con trifluoroacetamida para formar una pirimidona, que puede entonces clorarse con cloruro de oxalilo. La cloropirimidina se puede reducir usando hidrógeno y un catalizador de paladio sobre carbono para dar la pirimidina correspondiente. El éster puede entonces reducirse al aldehído usando hidruro de diisobutilaluminio (DIBAL-H) que puede alquilarse después con un reactivo de Grignard (R₂MgBr). El alcohol resultante puede ser clorado usando cloruro de tionilo, y después la sustitución nucleofílica del haluro con la sal sódica de un alquiltiol proporcionará el sulfuro deseado.

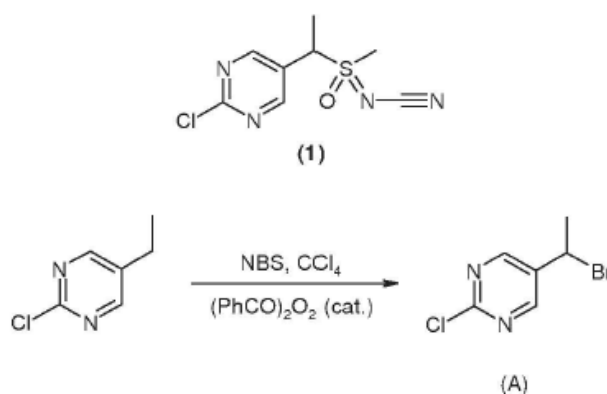
Esquema H



10 Ejemplos

Los ejemplos son para fines ilustrativos y no se deben interpretar como limitantes de la invención descrita en este documento a solamente las realizaciones descritas en estos ejemplos.

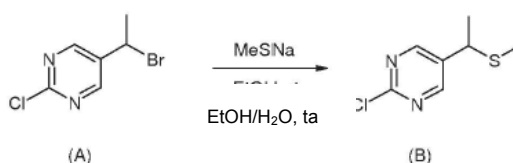
Ejemplo I: Preparación de [1-(2-cloropirimidin-5-il)etil](metil)oxido-λ⁴-sulfanildencianamida (1)



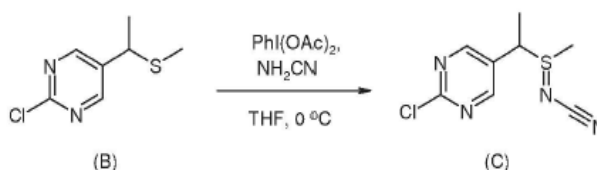
15

Se trató una solución de 2-cloro-5-etilpirimidina (1,15 g, 8,1 mmol) en 20 ml de tetracloruro de carbono con *N*-bromosuccinimida (1,50 g, 8,4 mmol) y una cantidad catalítica (aproximadamente 1% molar basada en reactivos) de peróxido de benzoilo y se calentó después a 75°C. Después de varias horas y catalizador adicional, el material de partida se consumió completamente. Se retiraron los sólidos y se concentró el filtrado. Se purificó adicionalmente el residuo resultante mediante cromatografía en columna ultrarrápida sobre gel de sílice usando una mezcla de acetato de etilo (EtOAc) y éter de petróleo como el eluyente. Se eliminaron los disolventes a presión reducida para dar 0,64 g (36%) de 5-(1-bromoetil)-2-cloropirimidina (A) en forma de un líquido transparente: ¹H NMR (CDCl₃) δ 8,70 (s, 2H), 5,15 (q, *J* = 8,0 Hz, 1H), 2,10 (d, *J* = 8,0 Hz, 3H); GCMS (FID) *m/z* 222 (M+). Se aisló también parte del compuesto de dibromo correspondiente 0,44 g (18%), como un sólido blanco: pf 84-85 °C; ¹H NMR (CDCl₃) δ 9,00 (s, 2H), 3,00 (s, 3H); LC-MS (ESIMS) *m/z* 298 (M+H).

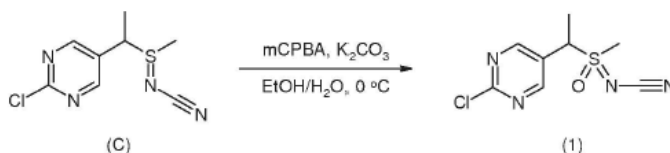
25



- 5 Se trató una suspensión de metiltiolato de sodio (245 mg, 3,50 mmol) en etanol con una solución de 5-(1-bromoetil)-2-cloropirimidina en etanol a temperatura ambiente. Después de 5 horas (h), se repartió la reacción entre CH_2Cl_2 y ácido clorhídrico diluido, se lavó con una solución de sal saturada y se secó sobre sulfato sódico (Na_2SO_4). Se eliminó el disolvente a presión reducida para dar 0,45 g (89%) de 2-cloro-5-[1-(metiltio)etil] pirimidina (B) en forma de un jarabe amarillo pálido: $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 8,60 (s, 2H), 3,85 (q, $J = 8,0$ Hz, 1H), 1,98 (s, 3H), 1,65 (d, $J = 8,0$ Hz, 3H); GC-MS (FID) m/z 188 (M+).

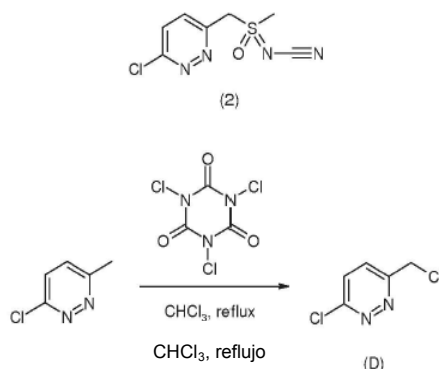


- 10 Se enfrió a 0°C una solución de 2-cloro-5-[1-(metiltio)etil] pirimidina (0,49 g, 2,61 mmol) y cianamida (120 mg, 2,86 mmol) en 20 ml de CH_2Cl_2 y se trató con diacetato de yodobenceno (860 mg, 2,59 mmol). Se dejó atemperar la mezcla a temperatura ambiente durante una hora, se eliminó el disolvente a presión reducida y se repartió el residuo entre hexanos y acetonitrilo. El acetonitrilo se eliminó a presión reducida y el residuo se purificó adicionalmente mediante cromatografía en columna ultrarrápida sobre gel de sílice usando como eluyente una mezcla al 50% de acetona y éter de petróleo. Los disolventes se eliminaron a presión reducida para dar 0,44 g (74%) de (1E)-[1-(2-cloropirimidin-5-il)etil](metil)- λ^4 -sulfanilidencianamida (C) en forma de un jarabe naranja pálido. Este material era una mezcla 2:1 de diastereoisómeros. Las propiedades físicas del diastereoisómero principal eran: $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 8,68 (s, 2H), 4,38 (q, $J = 8,3$ Hz, 1H), 2,68 (s, 3H), 1,92 (d, $J = 8,3$ Hz, 3H); LC-MS (ESI) m/z 229 (M+H).

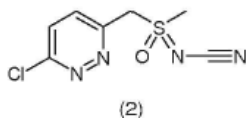


- 20 Se trató primero una mezcla en agitación rápida de peryodato sódico (458 mg, 2,14 mmol) en 10 ml de una mezcla 1:1 de agua (H_2O) y CH_2Cl_2 con cloruro de rutenio (III) hidrato (13 mg, 0,06 mmol) y a continuación se añadió gota a gota durante 15 minutos una solución de (1E)-[1-(2-cloropirimidin-5-il)etil](metil)- λ^4 -sulfanilidencianamida (242 mg, 1,06 mmol) en 7 ml de CH_2Cl_2 . La mezcla se agitó durante 18 h a temperatura ambiente. La mezcla oscura se repartió a continuación entre CH_2Cl_2 y ácido clorhídrico diluido, y la capa orgánica se secó sobre Na_2SO_4 . Se eliminó el disolvente a presión reducida, y el residuo se recogió en acetona y se pasó a través de un tapón de alúmina. Se eliminó la acetona a presión reducida para dar 122 mg (50%) de [1-(2-cloropirimidin-5-il)etil](metil)óxido- λ^4 -sulfanilidencianamida (1) como un jarabe transparente. El material era una mezcla 2:1 de diastereoisómeros. Las propiedades físicas del diastereoisómero principal eran: $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 8,68 (s, 2H), 4,52 (q, $J = 9$ Hz, 1H), 3,10 (s, 3H), 1,95 (d, $J = 9$ Hz, 3H); LC-MS (ESI) m/z 245 (M+H).

- 30 Ejemplo II: Preparación de [(3-cloropiridazin-6-il) metil](metil)óxido- λ^4 -sulfanilidencianamida (2)

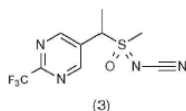


5 A una solución a reflujo de 3-cloro-6-metilpiridazina (5,0 g, 39 mmol) en cloroformo (75 ml) se añadió ácido tricloroisocianúrico (3,6 g, 16 mmol) en porciones. La solución se dejó a reflujo toda la noche, después de lo cual la mezcla cruda de reacción se filtró, se lavó con hidróxido sódico (NaOH) 1 M, y se secó la fase orgánica sobre sulfato de magnesio. El producto bruto se concentró a presión reducida y se purificó por cromatografía en gel de sílice para proporcionar 3-cloro-6-clorometil-piridazina (D) en forma de un aceite amarillo que al reposar se convirtió en un sólido marrón = 2,9 g (46%).



10 Se sintetizó [(3-cloropiridazin-6-il)metil](metil)óxido- λ^4 -sulfanilidencianamida (2) a partir de 3-cloro-6-clorometil-piridazina (D) usando el procedimiento sintético proporcionado en el Ejemplo I. Se aisló el producto deseado como un sólido amarillo: $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 7,3 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 4,8 (m, 2H), 2,8 (s, 3H); LC-MS (ESI) m/z 230 (M^+).

Ejemplo III: Preparación de metil(óxido){1-[2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]etil}- λ^4 -sulfanilidencianamida (3)



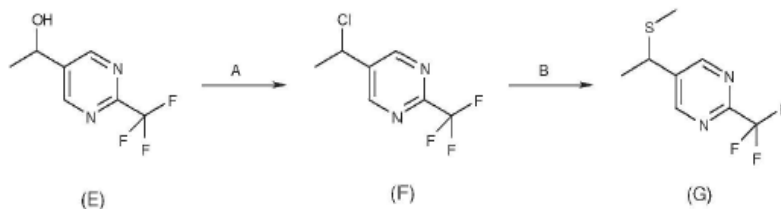
15 A una solución agitada magnéticamente de metil Grignard (19,9 ml de una solución 3M en éter (Et_2O), 59,7 mmol) en Et_2O (167 ml) se añadió una solución de 2-trifluorometilpirimidina-5-carbaldehído* (9,56 g, 54,3 mmol) en Et_2O (50 ml) a 0°C , y la solución amarilla pálida resultante se atemperó a temperatura ambiente (TA) y se agitó durante 2,5 h. La reacción se inactivó mediante la adición de cloruro de amonio (NH_4Cl) acuoso saturado (50 ml) a 0°C , y se atemperó la mezcla a TA. Las fases se separaron y la fase orgánica se secó sobre Na_2SO_4 , se filtró y se concentró para dar un aceite amarillo claro (9,32 g bruto). El aceite se purificó por cromatografía ultrarrápida (330 g de SiO_2 , gradiente de 0 \rightarrow 100% de EtOAc /hexanos) para dar 1-(2-trifluorometilpirimidin-5-il)etanol (E) (8,87 g, 85%)

20 en forma de un sólido amarillo claro: pf 43-45 $^\circ\text{C}$; $^1\text{H NMR}$ (300 MHz, CDCl_3) δ 8,92 (s, 2H), 5,15-5,07 (m, 1H), 2,26 (d, $J = 4,0$ Hz, 1H), 1,62 (d, $J = 6,5$ Hz, 3H); MS (EI) m/z 192 (M^+).

*El 2-trifluorometilpirimidina-5-carbaldehído se puede preparar en cuatro etapas a través de métodos conocidos en la bibliografía.

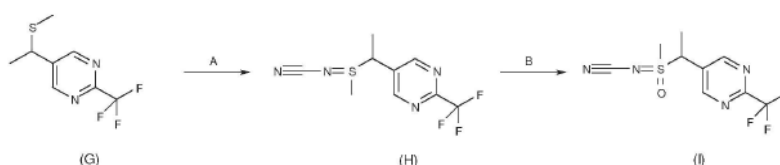
25 1) Fenwick, A. E.; Hickey, D. M. B.; Ife, R. J.; Leach, C. A.; Pinto, I. L.; Smith, S. A. (SmithKline Beecham PLC, Reino Unido). WO 200066567, 9 de Noviembre, 2000.

2) Hickey, D. M. B.; Ife, R. J.; Leach, C. A.; Smith, S. A. (SmithKline Beecham PLC, Reino Unido). WO 200066566, 9 de Noviembre, 2000.



30 A) A una solución agitada magnéticamente de 1-(2-trifluorometilpirimidin-5-il)etanol (E; 5,00 g, 26,0 mmol) en acetonitrilo anhidro (17 ml) se añadió cloruro de tionilo (3,87 g, 32,5 mmol) a 0°C . Se retiró el baño de hielo y la solución amarilla claro resultante se agitó durante 1h. La reacción se analizó mediante GC-MS, que confirmó la conversión completa del material de partida (SM) al intermedio deseado 5-(1-cloroetil)-2-trifluorometilpirimidina ((EI) m/z 210 (M^+)). El disolvente y el exceso de cloruro de tionilo se eliminaron en el evaporador rotatorio, y el aceite ámbar residual se disolvió en acetonitrilo anhidro (20 ml) y se usó sin purificación adicional.

5 B) La solución de 5-(1-cloroetil)-2-trifluorometilpirimidina (F) se enfrió a 0°C, y se añadió tiometóxido de sodio (2,96 g, 42,3 mmol) en porciones (3 x 0,99 g) durante 5 minutos (min). Se retiró el baño de hielo y la mezcla naranja resultante se atemperó a TA y se agitó durante 1 h. La reacción se diluyó con salmuera (100 ml) y se extrajo con Et₂O (3 x 150 ml). Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron, y se concentraron para dar un aceite de color ámbar (5,21 g crudo). El aceite se purificó por cromatografía ultrarrápida (330 g de SiO₂, gradiente de 0→100% de EtOAc/hexanos) para dar 5-(1-metilsulfonietil)-2-trifluorometilpirimidina (G; 4,16 g, 72%) en forma de un aceite amarillo: ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8,86 (s, 2H), 3,92 (q, *J* = 7,3 Hz, 1H), 1,98 (s, 3H), 1,68 (d, *J* = 7,2 Hz, 3H); MS (EI) *m/z* 222 (M)⁺.



10 A) A una solución agitada magnéticamente de 5-(1-metilsulfonietil)-2-trifluorometilpirimidina (G; 0,50 g, 2,60 mmol) y cianamida (0,114 g, 2,73 mmol) en acetonitrilo anhidro (5,2 ml) se le añadió diacetato de yodobenceno (0,924 g, 2,87 mmol) a 0°C en nitrógeno (N₂). Se retiró el baño de hielo, se atemperó la mezcla de color amarillo pálido a TA y se agitó la solución naranja resultante durante 16 h. Se analizó la reacción por LC-MS, lo que confirmó la formación de metil{1-[2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]etil}-λ⁴-sulfanilidencianamida (H) ((ESI) *m/z* 263 [M+H]⁺, 261 [M-H]⁻). La solución se lavó con hexanos (5 x 10 ml), y se retiró el acetonitrilo en el evaporador rotatorio para dar un aceite naranja que se disolvió en CH₂Cl₂ (26 ml) y se usó sin purificación adicional.

15 B) A una solución agitada magnéticamente de metil{1-[2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]etil}-λ⁴-sulfanilidencianamida (H; 0,68 g, 2,60 mmol) en CH₂Cl₂ (26 ml) se añadió lentamente permanganato sódico acuoso (NaMnO₄) (0,92 g de 40%, 2,60 mmol) a 0°C. Se retiró el baño de hielo y se atemperó la mezcla oscura resultante a TA y se agitó durante 1,5 h. Se lavó la reacción con bisulfito sódico acuoso y se filtró la mezcla completa. Se separaron las fases y se extrajo la fase acuosa con CH₂Cl₂ (2 x 25 ml). Se combinaron las fases orgánicas, se lavaron con salmuera (25 ml), se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron para dar un residuo pastoso blanco (0,517 g crudo). El material en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida (80 g de SiO₂, gradiente de 0→100% de acetona/hexanos) para dar una mezcla 1:1 de diastereómeros de metil(óxido){1-[2-(trifluorometil)pirimidin-5-il]etil}-λ⁴-sulfanilidencianamida (I; 0,33 g, 46%) en forma de un sólido ceroso incoloro: ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 9,20 (d, *J* = 1,3 Hz, 2H), 5,40 (q, *J* = 7,1 Hz, 0,5H), 5,38 (q, *J* = 7,1 Hz, 0,5H), 3,54 (s, 1,5H), 3,53 (s, 1,5H), 1,92 (d, *J* = 7,1 Hz, 1,5H), 1,91 (d, *J* = 7,0 Hz, 1,5H); MS (ESIMS) *m/z* 279 [M+H]⁺, *m/z* 277 [M-H]⁻.

Ejemplo 4. Pruebas insecticidas

30 Los compuestos identificados en los ejemplos anteriores se ensayaron contra áfidos del algodón usando procedimientos descritos a continuación en esta memoria.

Prueba insecticida para áfido del algodón (*Aphis gossypii*) en ensayo de pulverización foliar

35 Se recortaron plántulas de calabaza con hojas de cotiledón plenamente expandidas a un cotiledón por planta y se infestaron con áfido del algodón (adultos sin alas y ninfas) 1 día antes de la aplicación del producto químico. Se examinó cada planta antes de la aplicación del producto químico para asegurar una infestación uniforme (alrededor de 30-70 áfidos por planta). Los compuestos (2 mg) se disolvieron en 2 ml de disolvente acetona/metanol (1:1), formando soluciones madre de 1000 ppm. Las soluciones madres se diluyeron 5 veces con Tween 20 al 0,025% en H₂O para obtener una solución de 200 ppm. Se usó un pulverizador manual tipo Devilbiss para aplicar las soluciones de pulverización hasta que rebose por ambos lados de las hojas de cotiledón de calabaza. Se usaron cuatro plantas (4 réplicas) para cada compuesto. Se pulverizaron plantas de referencia (verificación de disolvente) solamente con el diluyente. Las plantas tratadas se mantuvieron en una sala de mantenimiento durante 3 días a aproximadamente 23°C y humedad relativa del 40% (RH) antes de que se registrase el número de áfidos vivos en cada planta. Se midió la actividad insecticida mediante el % corregido con el control usando la fórmula de corrección de Abbott y presentada en la Tabla 1-Actividad:

$$\% \text{ corregido control} = 100 * (X - Y) / X$$

45 donde X = N° de áfidos vivos en plantas de verificación de disolvente

Y = N° de áfidos vivos en plantas tratadas

Los resultados se muestran en la Tabla 1.

Tabla 1- Actividad

	% Control a ppm, contra áfido del algodón en calabaza (pulverización foliar)
Comp. #	200 ppm
1	A
2	A
3	A

En cada caso de la Tabla 1 la escala de valoración es la siguiente:

% Control (o Mortalidad)	Valoración
80-100	A
menor de 80	B
no probado	C

5 Derivados de ácido & sal, y solvatos

Los compuestos descritos en esta invención pueden estar en forma de sales de adición de ácido aceptables desde el punto de vista plaguicida.

10 A modo de ejemplo no limitante, una función amina puede formar sales con ácidos clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, fosfórico, acético, benzoico, cítrico, malónico, salicílico, málico, fumárico, oxálico, succínico, tartárico, láctico, glucónico, ascórbico, maleico, aspártico, bencenosulfónico, metanosulfónico, etanosulfónico, hidroximetanosulfónico, e hidroxietanosulfónico.

Adicionalmente, a modo de ejemplo no limitante, una función ácido puede formar sales incluyendo aquellas derivadas de metales alcalinos o alcalinotérreos y aquellas derivadas de amoníaco y aminas. Ejemplos de cationes preferidos incluyen cationes sodio, potasio, magnesio, y amonio.

15 Las sales se preparan poniendo en contacto la forma de base libre con una cantidad suficiente del ácido deseado para producir una sal. Las formas de base libre se pueden regenerar tratando la sal con una solución base acuosa diluida adecuada como NaOH, carbonato potásico, amoníaco, y bicarbonato sódico acuosos diluidos. Como un ejemplo, en muchos casos, un plaguicida se modifica en una forma más soluble en agua p. ej. la sal de dimetil amina del ácido 2,4-diclorofenoxiacético es una forma más soluble en agua del ácido 2,4-diclorofenoxiacético, un herbicida bien conocido.

20 Los compuestos descritos en esta invención también pueden formar complejos estables con moléculas de disolvente que permanecen intactas después de que las moléculas de disolvente no-acomplejadas se eliminan de los compuestos. Estos complejos se denominan a menudo "solvatos".

Estereoisómeros

25 Ciertos compuestos descritos en esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen isómeros geométricos, diastereómeros, y enantiómeros. Por lo tanto, los compuestos descritos en esta invención incluyen mezclas racémicas, estereoisómeros individuales y mezclas ópticamente activas. Los expertos en la técnica apreciarán que un estereoisómero puede ser más activo que los otros. Los estereoisómeros individuales y mezclas ópticamente activas se pueden obtener mediante procedimientos sintéticos selectivos, mediante procedimientos sintéticos convencionales que usan materiales de partida resueltos, o mediante procedimientos de resolución convencionales.

30 Plagas

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas.

35 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Phylum Nematoda.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Phylum Arthropoda.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Subphylum Chelicerata.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Class Arachnida.

- 5 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Subphylum Myriapoda.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Class Symphyla.

- 10 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Subphylum Hexapoda.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar plagas de Class Insecta.

- En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar coleópteros (escarabajos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acanthoscelides* spp. (gorgojos), *Acanthoscelides obtectus* (gorgojo de la judía común), *Agrilus planipennis* (barrenador de ceniza esmeralda), *Agriotes* spp. (gusanos de alambre), *Anoplophora glabripennis* (escarabajo asiático de cuernos largos), *Anthonomus* spp. (gorgojos), *Anthonomus grandis* (gorgojo de la cápsula), *Aphidius* spp., *Apion* spp. (gorgojos), *Apogonia* spp. (larvas), *Ataenius spretulus* (*Ataenius* de césped negro), *Atomaria linearis* (escarabajo mangold pigmeo), *Aulacophore* spp., *Bothynoderes punctiventris* (gorgojo de la raíz de la remolacha), *Bruchus* spp. (gorgojos), *Bruchus pisorum* (gorgojo del guisante), *Cacoesia* spp., *Callosobruchus maculatus* (gorgojo del caupí del sur), *Carpophilus hemipteras* (escarabajo de la fruta seca), *Cassida vittata*, *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp. (crisomélidos), *Cerotoma trifurcata* (escarabajo de la hoja de la judía), *Ceutorhynchus* spp. (gorgojos), *Ceutorhynchus assimilis* (gorgojo de la vaina de la col), *Ceutorhynchus napi* (curculio de la col), *Chaetocnema* spp. (crisomélidos), *Colaspis* spp. (escarabajos del suelo), *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmatus*, *Conotrachelus nenuphar* (curculio de la ciruela), *Cotinus nitidis* (escarabajo de junio verde), *Crioceris asparagi* (escarabajo del espárrago), *Cryptolestes ferrugineus* (escarabajo de grano oxidado), *Cryptolestes pusillus* (escarabajo de grano plano), *Cryptolestes turcicus* (escarabajo de grano turco), *Ctenicera* spp. (gusanos de alambre), *Curculio* spp. (gorgojos), *Cyclocephala* spp. (larvas), *Cylindrocpturus adpersus* (gorgojo del tallo del girasol), *Deporaus marginatus* (gorgojo de la hoja de mango), *Dermestes lardarius* (escarabajo de despensa), *Dermestes maculatus* (escarabajo de la piel), *Diabrotica* spp. (crisomélidos), *Epilachna varivestis* (escarabajo de la judía mejicana), *Faustinus cubae*, *Hylobius pales* (gorgojo pálido), *Hypera* spp. (gorgojos), *Hypera postica* (gorgojo de la alfalfa), *Hyperdoes* spp. (gorgojo de Hyperodes), *Hypothenemus hampei* (escarabajo de la baya de café), *Ips* spp. (grabadores), *Lasioderma serricorne* (escarabajo del cigarrillo), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Liogenys fuscus*, *Lyogenis suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus* (gorgojo del agua del arroz), *Lyctus* spp. (escarabajos de la madera/escarabajos de powderpost), *Maecolaspis joliveti*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Melighetes* spp., *Melighetes aeneus* (escarabajo de la flor), *Melolontha melolontha* (abejorro europeo común), *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros* (escarabajo de la palmera de dátiles), *Oryzaephilus mercator* (escarabajo del grano mercantil), *Oryzaephilus surinamensis* (escarabajo del grano de sierra), *Otiorhynchus* spp. (gorgojos), *Oulema melanopus* (escarabajo de la hoja del cereal), *Oulema oryzae*, *Pantomorus* spp. (gorgojos), *Phyllophaga* spp. (escarabajo de mayo/junio), *Phyllophaga cuyabana*, *Phyllotreta* spp. (crisomélidos), *Phynchites* spp., *Popillia japónica* (escarabajo japonés), *Prostephanus truncatus* (barrenador mayor del grano), *Rhizopertha dominica* (barrenador menor del grano), *Rhizotrogus* spp. (escarabajo chafer europeo), *Rhynchophorus* spp. (gorgojos), *Scolytus* spp. (escarabajos de la madera), *Shenophorus* spp. (billbug), *Sitona lineatus* (gorgojo de la hoja del guisante), *Sitophilus* spp. (gorgojos del grano), *Sitophilus granaries* (gorgojo del granero), *Sitophilus oryzae* (gorgojo del arroz), *Stegobium paniceum* (escarabajo de farmacia), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Tribolium castaneum* (escarabajo rojo de la harina), *Tribolium confusum* (escarabajo confuso de la harina), *Trogoderma variabile* (escarabajo de almacén), y *Zabrus tenebrioides*.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Dermaptera (tijeretas).

- En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Dictyoptera (cucarachas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Blattella germánica* (cucaracha alemana), *Blatta orientalis* (cucaracha oriental), *Parcoblatta pennylvanica*, *Periplaneta americana* (cucaracha americana), *Periplaneta australoasiae* (cucaracha australiana), *Periplaneta brunnea* (cucaracha marrón), *Periplaneta fuliginosa* (cucaracha de color ahumado), *Pyncoselus suninamensis* (cucaracha del Surinam), y *Supella longipalpa* (cucaracha de banda marrón).

- En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Diptera (moscas verdaderas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Aedes* spp. (mosquitos), *Agromyza frontella* (minadora de hojas de alfalfa), *Agromyza* spp. (moscas minadoras de la hoja), *Anastrepha* spp. (mosca de la fruta), *Anastrepha suspensa* (mosca de la fruta del Caribe), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Batrocera* spp. (moscas de la fruta), *Batrocera cucurbitae* (mosca del melón), *Batrocera dorsalis* (mosca oriental de la fruta),

5 Ceratitis spp. (moscas de la fruta), *Ceratitis capitata* (mosca mediterránea de la fruta), *Chrysops* spp. (moscas del venado), *Cochliomyia* spp. (moscas del gusano), *Contarinia* spp. (moscas de las agallas), *Culex* spp. (mosquitos), *Dasineura* spp. (moscas de las agallas), *Dasineura brassicae* (mosca de la col), *Delia* spp., *Delia platyura* (gusano de la mosca de la semilla de maíz), *Drosophila* spp. (moscas del vinagre), *Fannia* spp. (moscas de la suciedad),
 10 *Fannia canicularis* (mosca pequeña de la casa), *Fannia scalaris* (mosca de letrinas), *Gasterophilus intestinalis* (mosca bot del caballo), *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans* (mosca del cuerno), *Hylemyia* spp. (gusanos de la raíz), *Hypoderma lineatum* (larvas del ganado común), *Liriomyza* spp. (moscas mineras de las hojas), *Liriomyza brassica* (minero de hoja serpentina), *Melophagus ovinus* (oveja ked), *Musca* spp. (moscas múscidas), *Musca autumnalis* (mosca de la cara), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Oestrus ovis* (mosca bot de la oveja),
 15 *Oscinella frit* (mosca frit), *Pegomya betae* (minero de hoja de remolacha), *Phorbia* spp., *Psila rosae* (mosca del moho de la zanahoria), *Rhagoletis cerasi* (mosca de la fruta de la cereza), *Rhagoletis pomonella* (gusano de la manzana), *Sitodiplosis mosellana* (mosca de flor de trigo de color naranja), *Stomoxys calcitrans* (mosca del establo), *Tabanus* spp. (moscas del caballo, tábanos), y *Tipula* spp. (moscas grulla).

15 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Hemiptera (insectos verdaderos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acrosternum hilare* (chinche verde), *Blissus leucopterus* (chinche de los cereales), *Calocoris norvegicus* (insecto de la patata), *Cimex hemipterus* (chinche de cama tropical), *Cimex lectularius* (chinche de cama), *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus suturellus* (marcador de algodón), *Edessa meditabunda*, *Eurygaster maura* (insecto del cereal), *Euschistus heros*, *Euschistus servus* (insecto de la peste marrón), *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora*
 20 (mosquito del té), *Lagynotomus* spp. (insectos de la peste), *Leptocoris oratorius*, *Leptocoris varicornis*, *Lygus* spp. (insectos de las plantas), *Lygus hesperus* (insecto de la planta manchada occidental), *Maconellicoccus hirsutus*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula* (insecto de la peste verde del sur), *Phytocoris* spp. (insectos de las plantas), *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildingi*, *Poecilopsus lineatus* (insecto de plantas de cuatro líneas), *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Scaptocoris castanea*, y *Triatoma* spp.
 25 (insectos de nariz de cono chupadores de sangre /insectos besadores).

30 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Homoptera (áfidos, insectos de la escala, moscas blancas, chicharras). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acrythosiphon pisum* (áfido del guisante), *Adelges* spp. (adélgidos), *Aleurodes proletella* (mosca blanca de la col), *Aleurodicus disperses*, *Aleurothrix floccosus* (mosca blanca de la lana), *Alaucaispis* spp., *Amrasca bigutella bigutella*, *Aphrophora* spp. (chicharra), *Anidiella aurantii* (escala roja de California), *Aphis* spp. (áfidos), *Aphis gossypii* (áfido del algodón), *Aphis pomi* (áfido de la manzana), *Aulacorthum solani* (áfido foxglove), *Bemisia* spp. (moscas blancas), *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci* (mosca blanca de la batata), *Brachycolus noxius* (áfido ruso), *Brachycorynella asparagi* (áfido del espárrago), *Brevinnia rehi*, *Brevicoryne brassicae* (áfido de la col),
 35 *Ceroplastes* spp. (escalas), *Ceroplastes Rubens* (escala de cera roja), *Chionopsis* spp. (escalas), *Chrysomphalus* spp. (escalas), *Coccus* spp. (escalas), *Dysaphis plantaginea* (áfido de la manzana rosado), *Empoasca* spp. (chicharra), *Eriosoma lanigerum* (áfido de la manzana lanoso), *Icerya purchasi* (cochinilla algodonosa), *Idioscopus nitidulus* (chicharra del mango), *Laodelphax striatellus* (saltahojas marrón pequeño), *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphum* spp., *Macrosiphum euphorbiae* (áfido de la patata), *Macrosiphum granarium* (áfido inglés del grano), *Macrosiphum rosae* (áfido de la rosa), *Macrosteles quadrilineatus* (chicharra de áster), *Mahanarva frimbiolata*,
 40 *Metopolophium dirhodum* (áfido del grano de rosa), *Mictis longicornis*, *Myzus persicae* (áfido verde del melocotón), *Nephotettix* spp. (chicharra), *Nephotettix cinctipes* (chicharra verde), *Nilaparvata lugens* (saltahojas marrón), *Parlatoria pergandii* (escala de la paja), *Parlatoria ziziphi* (escala del ébano), *Peregrinus maidis* (delfácidos del maíz), *Philaenus* spp. (insectos escupidores), *Phylloxera vitifoliae* (filoxera de la uva), *Physokermes piceae* (escala del brote del abeto), *Planococcus* spp. (cochinillas), *Pseudococcus* spp. (cochinillas), *Pseudococcus brevipes*
 45 (cochinilla de la piña), *Quadraspidiotus perniciosus* (escala de San José), *Rhaphalosiphum* spp. (áfidos), *Rhaphalosiphum maidis* (áfido de la hoja de maíz), *Rhaphalosiphum padi* (áfido de la cereza-avena del pájaro), *Saissetia* spp. (escalas), *Saissetia oleae* (escala negra), *Schizaphis graminum* (áfido verde), *Sitobion avenae* (áfido del grano inglés), *Sogatella furcifera* (chicharra blanca), *Therioaphis* spp. (áfidos), *Toumeyella* spp. (escalas), *Toxoptera* spp. (áfidos), *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Trialeurodes vaporariorum* (mosca blanca de invernadero), *Trialeurodes abutiloneus* (mosca blanca de alas con bandas), *Unaspis* spp. (escalas), *Unaspis yanonensis* (escala de punta de flecha), y *Zulia entreriana*.

55 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Hymenoptera (hormigas, avispas, y abejas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acromyrmex* spp., *Athalia rosae*, *Atta* spp. (hormigas cortadoras de hojas), *Camponotus* spp. (hormigas carpinteras), *Diprion* spp. (moscas de sierra), *Formica* spp. (hormigas), *Iridomyrmex humilis* (hormiga argentina), *Monomorium* spp., *Monomorium minimum* (hormiga negra pequeña), *Monomorium pharaonis* (hormiga faraón), *Neodiprion* spp. (moscas de sierra), *Pogonomyrmex* spp. (hormigas cosechadoras), *Polistes* spp. (avispa de papel), *Solenopsis* spp. (hormigas de fuego), *Tapinoma sessile* (hormiga doméstica olorosa), *Tetranomium* spp. (hormigas del pavimento), *Vespula* spp. (chaquetas amarillas), y *Xylocopa* spp. (abejas carpinteras).

60 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Isoptera (termitas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Coptotermes* spp., *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchii*, *Coptotermes formosanus* (termita subterránea de Formosa), *Cornitermes* spp. (termitas de Nasute), *Cryptotermes* spp. (termitas de madera seca), *Heterotermes* spp. (termitas subterráneas del desierto),

Heterotermes aureus, Kalotermes spp. (termitas de madera seca), Incistitermes spp. (termitas de madera seca), Macrotermes spp. (termitas que crecen en los hongos), Marginitermes spp. (termitas de madera seca), Microcerotermes spp. (termitas cosechadoras), Microtermes obesi, Procornitermes spp., Reticulitermes spp. (termitas subterráneas), Reticulitermes banyulensis, Reticulitermes grassei, Reticulitermes flavipes (termita subterránea oriental), Reticulitermes hageni, Reticulitermes hesperus (termita subterránea occidental), Reticulitermes santonensis, Reticulitermes speratus, Reticulitermes tibialis, Reticulitermes virginicus, Schedorhinotermes spp., y Zootermopsis spp. (termitas de madera podrida).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Lepidoptera (polillas y mariposas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, Achoea janata, Adoxophyes spp., Adoxophyes orana, Agrotis spp. (lombrices), Agrotis ipsilon (lombriz negra), Alabama argillacea (gusano de la hoja de algodón), Amorbia cuneana, Amyelosis transitella (gusano naranja del ombligo), Anacamptodes defectaria, Anarsia lineatella (barrenador de la ramita de melocotón), Anomis sabulifera (looper del yute), Anticarsia gemmatalis (oruga del terciopelo), Archips argyrospila (plegadoras de hojas de árboles frutales), Archips Rosana (enrolladores de hojas de rosa), Argyrotaenia spp. (polillas tortricidas), Argyrotaenia citrana (tortrix naranja), Autographa gamma, Bonagota cranaodes, Borbo cinnara (doblador de la hoja del maíz), Bucculatrix thurberiella (perforador de la hoja del algodón), Caloptilia spp. (minadores de hojas), Capua reticulana, Carposina niponensis (polilla de fruta de melocotón), Chilo spp., Chlumetia transversa (barrenador del brote de mango), Choristoneura rosaceana (plegadora de hojas oblicuas), Chrysodeixis spp., Cnaphalocerus medinalis (plegadora de hierba), Colias spp., Conomorpha cramerella, Cossus cossus (polilla del carpintero), Crambus spp. (gusano de la seda), Cydia funebrana (polilla de la fruta ciruela), Cydia molesta (polilla de la fruta oriental), Cydia nignicana (polilla del guisante), Cydia pomonella (polilla de la manzana), Darna diducta, Diaphania spp. (barrenadores del tallo), Diatraea spp. (barrenadores del tallo), Diatraea saccharalis (barrenador de la caña de azúcar), Diatraea graniosella (barrenador del maíz del sur), Earias spp. (gusanos de la cápsula), Earias insulata (gusano egipcio de la cápsula), Earias vitella (gusano rugoso de la cápsula del norte), Ecdytopopha aurantianum, Elasmopalpus lignosellus (barrenador menor del tallo del maíz), Epiphysias postruttana (polilla marrón claro de la manzana), Ephestia spp. (polillas de la harina), Ephestia cautella (polilla de la almendra), Ephestia elutella (polilla del tabaco), Ephestia kuehniella (polilla mediterránea de la harina), Epimeces spp., Epinotia aporema, Erionota thrax (patrón de plátano), Eupoecilia ambiguella (polilla la baya de uva), Euxoa auxiliaris (gusano del ejército), Feltia spp. (lombrices), Gortyna spp. (barrenadores del tallo), Grapholita molesta (polilla de la fruta oriental), Hedylepta indicata (hoja de judía webber), Helicoverpa spp. (polillas noctuidas), Helicoverpa armigera (gusano de la cápsula del algodón), Helicoverpa zea (gusano de la cápsula/gusano del maíz), Heliothis spp. (polillas noctuidas), Heliothis virescens (gusanos del tabaco), Hellula undalis (gusano de la col), Indarbela spp. (barrenadores de la raíz), Keiferia lycopersicella (lombriz del tomate), Leucinodes orbonalis (barrenador de la fruta de la berenjena), Leucoptera malifoliella, Lithocolletis spp., Lobesia botrana (polilla de la fruta de la uva), Loxagrotis spp. (polillas noctuidas), Loxagrotis albicosta (gusano de la judía occidental), Lymantria dispar (polilla gitana), Lyonetia clerkella (minadora de la hoja de la manzana), Mahasena corbetti (gusanos de bolsa del aceite de palma), Malacosoma spp. (orugas de tienda), Mamestra brassicae (gusano de ejército de la col), Maruca testulalis (barrenador de vaina de judía), Metisa plana (gusano de bolsa), Mythimna unipuncta (gusano de ejército verdadero), Neoleucinodes elegantalis (pequeño barrenador del tomate), Nymphula depunctalis (gusano del arroz), Operophtera brumata (polilla de la pasa de Corinto común), Pandemis heparana (tortrix de la manzana marrón), Papilio demodocus, Pectinophora gossypiella (gusano rosa de la cápsula), Peridroma spp. (lombrices), Peridroma saucia (lombriz variegada), Perileucoptera coffeella (minador de hoja del café blanco), Phthorimaea operculella (polilla del tubérculo de la patata), Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp. (minadores de hojas), Pieris rapae (gusano de la col importado), Plathypena scabra, Plodia interpunctella (polilla india de la comida), Plutella xylostella (polilla de diamante), Polychrosis viteana (polilla de la baya de uva), Prays endocarpa, Prays oleae (polilla del aceite), Pseudaletia spp. (polillas noctuidas), Pseudaletia unipunctata (gusano de ejército), Pseudoplusia includens (looper de la soja), Rachiplusia nu, Scirpophaga incertulas, Sesamia spp. (barrenadores de tallo), Sesamia inferens (barrenador del tallo de arroz rosa), Sesamia nonagrioides, Setora nitens, Sitotroga cerealella (polilla de grano Angoumois), Sparganothis pilleriana, Spodoptera spp. (gusanos de ejército), Spodoptera exigua (gusano de ejército de la remolacha), Spodoptera fugiperda (gusano del ejército de otoño), Spodoptera oridania (gusano del ejército del sur), Synanthedon spp. (barrenadores de raíz), Thecla basilides, Thermisia gemmatalis, Tineola bisselliella (polilla de la ropa), Trichoplusia ni (looper de la col), Tuta absoluta, Yponomeuta spp., Zeuzera coffeae (barrenador de rama rojo), y Zeuzera Pyrina (polilla leopardo).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Mallophaga (piojos masticadores). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, Bovicola ovis (piojo mordedor de la oveja), Menacanthus stramineus (piojo del cuerpo del pollo), y Menopon gallinea (piojo de la gallina común).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Orthoptera (chicharra, langostas, y grillos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, Anabrus simplex (grillo mormón), Gryllotalpidae (grillos del topo), Locusta migratoria, Melanoplus spp. (chicharras), Microcentrum retinerve (cigarra alada angular), Pterophylla spp. (cigarras), chistocerca gregaria, Scuddería furcata (cigarra de campo de cola bifurcada), y Valanga nigricorni.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Phthiraptera (piojos chupadores). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Haematopinus* spp. (piojos del ganado bovino y del cerdo), *Linognathus ovillus* (piojo de la oveja), *Pediculus humanus capitis* (piojo del cuerpo humano), *Pediculus humanus humanus* (piojos del cuerpo humano), y *Pthirus pubis* (piojo de cangrejo).

- 5 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Siphonaptera (pulgas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Ctenocephalides canis* (pulga del perro), *Ctenocephalides felis* (pulga del gato), y *Pulex irritans* (pulga humana).

- 10 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Thysanoptera (trips). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Frankliniella fusca* (trips del tabaco), *Frankliniella occidentalis* (trips de la flor occidental), *Frankliniella shultzei*, *Frankliniella williamsi* (trips del maíz), *Heliothrips haemorrhoidalis* (trips de invernadero), *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Scirtothrips citri* (trips de cítricos), *Scirtothrips dorsalis* (trips del té amarillos), *Taeniothrips rhopalantennalis*, y *Thrips* spp.

- 15 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Thysanura (zygentoma). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Lepisma* spp. (pez plateado) y *Thermobia* spp. (insecto de fuego).

- 20 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Acarina (ácaros y garrapatas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Acaropsis woodi* (ácaro traqueal de las abejas de miel), *Acarus* spp. (ácaros de la comida), *Acarus siro* (ácaro del grano), *Aceria mangiferae* (ácaro de la yema del mango), *Aculops* spp., *Aculops lycopersici* (ácaro Russet del tomate), *Aculops pelekasi*, *Akulops pelekasi*, *Akulops schlechtendali* (ácaro de la manzana oxidada), *Amblyomma americanum* (garrapata estrella solitaria), *Boophilus* spp. (garrapatas), *Brevipalpus obovatus* (ácaro del Privet), *Brevipalpus phoenicis* (ácaro plano rojo y negro), *Demodex* spp. (ácaros del mango), *Dermacentor* spp. (garrapatas duras), *Dermacentor variabilis* (garrapata de perro americano), *Dermatophagoides pteronyssinus* (ácaro del polvo doméstico), *Eotetranychus* spp., *Eotetranychus carpini* (ácaro amarillo de la araña), *Epitimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp. (garrapatas), *Metatetranychus* spp., *Notoedres cati*, *Oligonychus* spp., *Oligonychus coffee*, *Oligonychus ilicus* (ácaro rojo del sur), *Panonychus* spp., *Panonychus citri* (ácaro rojo de cítricos), *Panonychus ulmi* (ácaro rojo europeo), *Phyllocoptura oleivora* (ácaro del óxido de cítricos), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro amplio), *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata del perro marrón), *rhizoglyphus* spp. (ácaros del bulbo), *Sarcoptes scabiei* (ácaro de la comezón), *Tegolophus perseae*, *Tetranychus* spp., *Tetranychus urticae* (ácaro de la araña de dos puntos), y *Varroa destructor* (ácaro de la abeja de la miel).

- 35 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Nematoda (nematodos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Aphelenchoides* spp. (nematodos del brote y hoja & de la madera de pino), *Belonolaimus* spp. (nematodos de picadura), *Criconemella* spp. (nematodos de anillo), *Dirofilaria immitis* (gusanos del corazón de perros), *Ditylenchus* spp. (nematodos de tallo y bulbo), *Heterodera* spp. (nematodos del quiste), *Heterodera zaeae* (nematodos del quiste del maíz), *Hirschmanniella* spp. (nematodos de la raíz), *Hoplolaimus* spp. (nematodos de la lanza), *Meloidogyne* spp. (nematodo del nudo de la raíz), *Meloidogyne incognita* (nematodo del nudo de la raíz), *Onchocerca volvulus* (gusano enrollado), *Pratylenchus* spp. (nematodos de lesión), *Radopholus* spp. (nematodos excavadores), y *Rotylenchus reniformis* (nematodo con forma de riñón).

- 40 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede usar para controlar Symphyla (sinfilanos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero no se limita a, *Scutigereilla immaculata*.

Para obtener información más detallada, consulte el "Handbook of Pest Control – The Behavior, Life History, and Control of Household Pests" por Arnold Mallis, 9ª edición, copyright 2004 de GIE Media Inc.

Mezclas

- 45 Algunos de los plaguicidas que se pueden emplear de forma beneficiosa en combinación con la invención descrita en este documento incluyen, pero no se limitan a los siguientes,

1,2-dicloropropano, 1,3-dicloropropeno,

- 50 Abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprida, acetiona, acetoprole, acrinatrina, acrilonitrilo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aldrina, aletrina, alosamidina, alixicarb, alfa-cipermetrina, alfa-ecdisona, amiditió, amidoflumet, aminocarb, amiton, amitraz, anabasina, óxido de arsénico, atidatió, azadiractina, azametifos, azinfos-etil, azinfos-metil, azobenceno, azociclotin, azothoate,

- 55 hexafluorosilicato de bario, bartrina, benclotiaz, bendiocarb, benfuracarb, benomil, benoxafos, bentsultap, bezoximato, benzoato de bencilo, beta-ciflutrina, beta-cipermetrina, bifenazate, bifentrina, binapacril, bioaletrina, bioetanometrina, biopermetrina, bistriflurón, bórax, ácido bórico, bromfenvinfos, bromo-DTT, bromocicleno, bromofos, bromofos-etilo, bromopropilato, bufencarb, buprofezin, butacarb, butatofos, butocarboxima, butonato, butoxicarboxima,

- cadusafos, arsenato de calcio, polisulfuro de calcio, camfeclor, carbanolato, carbarilo, carbofurano, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, carbofenotión, carbosulfano, cartap, quinometionato, clorantraniliprol, clorbenside, clorbicleno, clordano, clordecona, clordimeformo, cloretoxifos, clorfenapir, clorfenetol, clorfensón, clorfensulfuro, clorfenvinfos, clorfluazurón, clormefos, clorobencilato, cloroformo, cloromebuformo, clorometiurón, 5 cloropicrina, cloropropiolato, clorfoxima, clorprazofos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorotiofos, cromafenoizida, cinerina I, cinerina II, cismetrina, cloetocarb, clofentezina, closantel, clotianidina, acetoarsenito de cobre, arsenato de cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre, cumafos, cumitoato, crotamitón, crotaxifos, cruentareno A & B, crufomato, criolita, cianofenos, cianofos, ciantoato, cicletrina, cicloprotrina, cienopirafeno, ciflumetofeno, ciflutrina, cialotrina, cihexatina, cipermetrina, cifenotrina, ciromazina, citioato,
- 10 *d*-limoneno, dazomet, DBCP, DCIP, DDT, decarbofurano, deltametrina, demefión, demefión-O, demefión-S, demetón, demetón-metilo, demetón-O, demetón-O-metilo, demetón-S, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfón, diafentiurón, dialifos, diamidafos, diazinon, dicaptón, diclofentión, diclofluanida, diclorvos, dicofol, dicresilo, dicrotofos, dicitlanilo, dieldrina, dienoclor, diflovidazina, diflubenzurón, dilor, dimeflutrina, dimefox, dimetan, dimetoato, dimetrina, dimetilvinfos, dimetilán, dinex, dinobutón, dinocap, dinocap-4, dinocap-6, dinocetón, 15 dinopentón, dinoprop, dinosam, dinosulfón, dinotefuran, dinoterbón, diofenolano, dioxabenzofos, dioxacarb, dioxatión, difenilsulfona, disulfiram, disulfotón, diticofos, DNOC, dofenapina, doramectina,
- ecdisterona, emamectina, EMPC, empenetrina, endosulfán, endotión, endrina, EPN, epofenonano, eprinomectina, esfenvalerato, etafofos, etiofencarb, etion, etiprole, etoato-metilo, etoprofos, etil-DDD, etil formato, dibromuro de etileno, dicloruro de etileno, óxido de etileno, etofenprox, etoxazol, etrimfos, EXD,
- 20 famfur, fenamifos, fenazaflor, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenclorfos, fenetacarb, fenflutrina, fenitrotión, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxacrima, fenoxicarb, fenpiritrina, fenpropatrina, fenpiroximato, fenson, fensulfotión, fentiión, fentiión-etilo, fentripanilo, fenvalerato, fipronil, flonicamida, fluacripirima, fluazurón, flubendiamida, flubenzimina, flucofurón, fluciclozurón, flucitrinato, fluenetil, flufenerim, flufenoxurón, flufenprox, flumetrina, fluorbenside, fluvalinato, fonofos, formetanato, formotión, formparanato, fosmetilán, fospirato, fostiazato, fostietán, 25 furatiocarb, furetrina, furfural,
- gamma-cialotrina, gamma-HCH,
- halfenprox, halofenoizida, HCH, HEOD, heptacloro, heptenofos, heterofos, hexaflumurón, hexitiazox, HHDN, hidrametilnón, cianuro de hidrógeno, hidropreno, hiquincarb,
- 30 imiciafos, imidacloprid, imiprotrina, indoxacarb, iodometano, IPSP, isamidofos, isazofos, isobenzan, isocarbofos, isodrín, isofenfos, isoprocarb, isoprotilano, isotioato, isoxation, ivermectina,
- jasmolina I, jasmolina II, jodfenfos, hormona juvenil I, hormona juvenil II, hormona juvenil III,
- keleván, quinopreno,
- lambda-cialotrina, arseniato de hidrógeno de plomo, lepimectina, leptofos, lindano, lirimfos, lufenurón, litidatión,
- 35 malatión, malonoben, mazidox, mecarbam, mecarfón, menazón, mefosfolán, cloruro mercurioso, mesulfen, mesulfenfos, metaflumizona, metam, metacrifos, metamidofos, metidatión, metiocarb, metocrotofos, metomilo, metopreno, metoxicloro, metoxifenocida, bromuro de metilo, metilcloroformo, cloruro de metileno, isotiocianato de metilo, metoflutrina, metolcarb, metoxadiazona, mevinfos, mexacarbato, milbemectina, milbemicina oxima, mipafox, mirex, MNAF, monocrotofos, morfotión, moxidectina,
- 40 naftalofos, naled, naftaleno, nicotina, nifluridida, nicomicinas, nitenpyram, nitiacina, nitrilacarb, novalurón, noviflumurón,
- ometoxato, oxamil, oxidemetón-metilo, oxideprofos, oxidisulfotón,
- para-diclorobenceno, paratión, paratión-metilo, penflurón, pentaclorofenol, permetrina, fencaptón, fenotrina, fentoato, forato, fosalona, fosfolano, fosmet, fosniclor, fosfamidón, fosfina, fosfocarb, foxima, foxima-metilo, pirimetafos, pirimicarb, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, arsenito potásico, tiocianato potásico, pp'-DDT, praletrina, precoceno I, precoceno II, precoceno III, primidofos, proclonol, profenofos, proflutrina, promacilo, promecarb, propafos, propargito, propetamfos, propoxur, protidatión, protiofos, protoato, protrifenbuta, piraclorofos, pirafluprole, pirazofos, piresmetrina, piretrina I, piretrina II, piridaben, piridalil, piridafentiión, pirifluquinazón, pirimidifen, pirimitato, piriprol, piroxifen,
- 45 quassia, quinalfos, quinalfos-metilo, quinotión, quantiofos,
- 50 rafoxanida, resmetrina, rotenona, ryania,
- sabadilla, schradan, selamectina, silafluofeno, arsenito sódico, fluoruro sódico, hexafluorosilicato sódico, tiocianato sódico, sofamida, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulcofurón, sulfiram, sulfluramida, sulfotep, azufre, fluoruro de sulfurilo, sulprofos,

tau fluvalinato, tazimcarb, TDE, tebufenozide, tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzurón, teflutrina, temefos, TEPP, teraletrina, terbufos, tetracloroetano, tetraclorvinfos, tetradifón, tetrametrina, tetranactina, tetrasul, zeta cipermetrina, tiacloprid, tiametoxam, ticofos, tiocarboxima, thiocyclam, tiodicarb, tiofanox, tiometón, tionazina, tioquinox, tiosultap, turigiensin, tolfenpirad, tralometrina, transflutrina, transpermetrina, triarateno, triazamato, triazofos, triclorfón, triclormetafos-3, tricloronat, trifenofos, triflumurón, trimetacarb, tripreno,

vamidotión, vaniliprol,

XMC, xililcarb,

zeta-cipermetrina y zolaprofos.

Además, se puede usar cualquier combinación de los plaguicidas anteriores.

10 La invención descrita en este documento también se puede usar con herbicidas y fungicidas, o ambos por razones de economía y sinergia.

La invención descrita en este documento se puede usar con antimicrobianos, bactericidas, defoliantes, protectores, sinergistas, algicidas, atrayentes, desecantes, feromonas, repelentes, inmersión para animales, avicidas, desinfectantes, semioquímicos, y molusquicidas (estas categorías no necesariamente mutuamente excluyentes), por razones de economía, y sinergia.

15

Para más información consulte el "Compendium of Pesticide Common Names" ubicado en <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html> en la fecha de presentación de este documento. Consulte también "The Pesticide Manual" 14ª Edición, editado por C D S Tomlin, copyright 2006 por British Crop Production Council.

Mezclas sinérgicas

20 La invención descrita en este documento se puede usar con otros compuestos como los mencionados bajo el título "Mezclas" para formar mezclas sinérgicas donde el modo de acción de los compuestos en las mezclas son iguales, similares, o diferentes.

Ejemplos de modo de acción incluyen, pero no se limitan a: inhibidor de la acetilcolinesterasa; modulador del canal de sodio; inhibidor de la biosíntesis de quitina; antagonista del canal de cloruro abierto por GABA; agonista del canal de cloruro abierto por GABA y glutamato; agonista del receptor de acetilcolina; inhibidor MET I; inhibidor de la ATPasa estimulada por Mg; receptor nicotínico de acetilcolina; disruptor de membrana del intestino medio; y disruptor de la fosforilación oxidativa.

25

Adicionalmente, los compuestos siguientes son conocidos como sinergistas y se pueden usar con la invención descrita en este documento; butóxido de piperonilo, piprotal, propilisoma, sesamex, sesamolina, y sulfóxido.

30 Formulaciones

Rara vez un plaguicida es adecuado para su aplicación en su forma pura. Normalmente es necesario añadir otras sustancias para que el plaguicida se pueda usar a la concentración requerida y en una forma apropiada, que permite la facilidad de aplicación, manipulación, transporte, almacenamiento, y máxima actividad plaguicida. Por lo tanto, los plaguicidas se formulan, por ejemplo, en cebos, emulsiones concentradas, polvos, concentrados emulsionables, fumigantes, geles, gránulos, microencapsulaciones, tratamientos de semillas, concentrados en suspensión, suspoemulsiones, comprimidos, líquidos solubles en agua, gránulos dispersables o polvos dispersables secos en agua, polvos humectables, y soluciones de volumen ultra bajo.

35

Para más información sobre los tipos de formulación véase el "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system" Monografía Técnica nº 2, 5ª Edición de CropLife International (2002).

40 Los plaguicidas se aplican con mayor frecuencia como suspensiones o emulsiones acuosas preparadas a partir de formulaciones concentradas de dichos plaguicidas. Dichas formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua, o emulsionables, son sólidos, normalmente conocidos como polvos humectables, o gránulos dispersables en agua, o líquidos normalmente conocidos como concentrados emulsionables, o suspensiones acuosas. Los polvos humectables, que se pueden compactar para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima del plaguicida, un soporte, y tensioactivos. La concentración del plaguicida es normalmente de aproximadamente 10% a aproximadamente 90% en peso. El soporte se elige generalmente entre las arcillas de atapulgita, las arcillas de montmorilonita, las tierras de diatomeas o los silicatos purificados. Tensioactivos efectivos, que comprenden de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10% del polvo humectable, se encuentran entre las ligninas sulfonadas, naftalenosulfonatos condensados, naftalenosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, alquil sulfatos, y tensioactivos no iónicos como aductos de óxido de etileno de alquil fenoles.

45

Los concentrados emulsionables de plaguicidas comprenden una concentración apropiada de plaguicida, como de aproximadamente 50 a aproximadamente 500 gramos por litro disuelto en un soporte que es un disolvente miscible

50

5 en agua o una mezcla de disolvente orgánico inmiscible en agua y emulsionantes. Disolventes orgánicos útiles incluyen compuestos aromáticos, especialmente xilenos y fracciones de petróleo, especialmente las porciones naftalénicas y olefínicas de alto punto de ebullición de petróleo como nafta aromática pesada. También se pueden usar otros disolventes orgánicos, como los disolventes terpénicos que incluyen derivados de resina, cetonas alifáticas como ciclohexanona, y alcoholes complejos como 2-etoxietanol. Los emulsionante adecuados para concentrados emulsionables se eligen de tensioactivos aniónicos y no iónicos convencionales.

10 Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de plaguicidas insolubles en agua dispersas en un soporte acuoso a una concentración en el intervalo de aproximadamente 5% a aproximadamente 50% en peso. Las suspensiones se preparan moliendo finamente el plaguicida y mezclándolo vigorosamente en un soporte compuesto de agua y tensioactivos. También se pueden añadir ingredientes, como sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales, para aumentar la densidad y viscosidad del soporte acuoso. Frecuentemente es más eficaz triturar y mezclar el plaguicida al mismo tiempo que se prepara la mezcla acuosa y homogeneizándola en un instrumento como un molino de arena, un molino de bolas, o un homogeneizador de pistón.

15 También se pueden aplicar los plaguicidas como composiciones granulares que son particularmente útiles para aplicaciones en el suelo. Las composiciones granulares normalmente contienen de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10% en peso del plaguicida, dispersadas en un soporte que comprende arcilla o una sustancia similar. Tales composiciones se preparan habitualmente disolviendo el plaguicida en un disolvente adecuado y aplicándolo a un soporte granular que se ha pre-formado hasta el tamaño de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3 mm. Tales composiciones también se pueden formular haciendo una masa o pasta del soporte y el compuesto y triturándolos y secándolos hasta obtener el tamaño de partícula granular deseado.

20 Los polvos que contienen un plaguicida se preparan mezclando íntimamente el plaguicida en forma de polvo con un soporte agrícola en polvo adecuado, como la arcilla de caolín, roca volcánica molida, y similares. Los polvos pueden contener de forma adecuada de aproximadamente 1% a aproximadamente 10% del plaguicida. Se pueden aplicar como aderezo de semillas o como aplicación de follaje con una máquina sopladora de polvo.

25 Es igualmente práctico aplicar un plaguicida en forma de una solución en un disolvente orgánico apropiado, normalmente aceite de petróleo, como los aceites de pulverización, que se usan ampliamente en química agrícola.

30 Los plaguicidas también pueden aplicarse en forma de una composición en aerosol. En tales composiciones, el plaguicida se disuelve o se dispersa en un soporte, que es una mezcla propulsora generadora de presión. La composición en aerosol se envasa en un recipiente a partir del que se dispensa la mezcla a través de una válvula atomizadora.

Se forman cebos de plaguicida cuando el plaguicida se mezcla con alimento o un atrayente o ambos. Cuando las plagas comen el cebo también consumen el plaguicida. Los cebos pueden tener forma de gránulos, geles, polvos fluidos, líquidos, o sólidos. Se usan en refugios de plagas.

35 Los fumigantes son plaguicidas que tienen una presión de vapor relativamente alta y por lo tanto pueden existir como un gas en concentraciones suficientes para matar plagas en el suelo o en espacios cerrados. La toxicidad del fumigante es proporcional a su concentración y al tiempo de exposición. Se caracterizan por una buena capacidad de difusión y actúan penetrando en el sistema respiratorio de la plaga o siendo absorbidos a través de la cutícula de la plaga. Los fumigantes se aplican para controlar plagas de productos almacenados bajo placas a prueba de gas, en habitaciones o edificios sellados con gas o en cámaras especiales.

40 Los plaguicidas pueden ser microencapsulados suspendiendo las partículas o gotitas de plaguicida en polímeros plásticos de diversos tipos. Alterando la química del polímero o cambiando factores en el procesamiento, pueden formarse microcápsulas de varios tamaños, solubilidad, espesores de pared, y grados de penetrabilidad. Estos factores regulan la velocidad con la que se libera el ingrediente activo interior, lo que a su vez afecta al rendimiento residual, velocidad de acción, y olor del producto.

45 Los concentrados de soluciones de aceite se preparan disolviendo el plaguicida en un disolvente que contenga el plaguicida en solución. Las soluciones de aceite de un plaguicida proporcionan normalmente una destrucción y muerte más rápidas de las plagas que otras formulaciones debido a que los propios disolventes tienen acción plaguicida y la disolución del recubrimiento ceroso del integumento aumentando la velocidad de captación del plaguicida. Otras ventajas de las soluciones de aceite incluyen mejor estabilidad al almacenamiento, mejor penetración de grietas, y mejor adhesión a superficies grasas.

50 Otra realización es una emulsión de aceite en agua, en donde la emulsión comprende glóbulos aceitosos que están provistos de un revestimiento de cristal líquido laminar y se dispersan en un fase acuosa, en donde cada glóbulo aceitoso comprende al menos un compuesto que es activo en agricultura, y está revestido individualmente con una capa monolaminar o oligolaminar que comprende: (1) al menos un agente activo de superficie lipofílico no iónico, (2) al menos un agente activo de superficie hidrófilo no aniónico, y (3) al menos un agente activo de superficie iónico, en donde los glóbulos tienen un diámetro medio de partícula de menos de 800 nanómetros. Se describe información adicional sobre la realización en la publicación de patente de E.E.U.U. 20070027034

publicada el 1 de febrero de 2007, que tiene número de serie de la solicitud de patente 11/495.228. Para facilitar su uso, esta realización se denominará "OIWE".

Para más información consulte "Insect Pest Management" 2ª Edición de D. Dent, copyright CAB international (2000). Además, para una información más detallada consulte "Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests" de Arnold Mallis, 9ª Edición, copyright 2004 por GIE Media Inc.

Otros componentes de formulación

Generalmente, la invención descrita en este documento cuando se usa en una formulación, dicha formulación también puede contener otros componentes. Estos componentes incluyen, pero no se limitan a, (esta es una lista no-exhaustiva y no-mutualmente exclusiva) humectantes, de extensión, adhesivos, penetrantes, tampones, agentes secuestrantes, agentes de reducción de dispersión, agentes de compatibilidad, agentes antiespumantes, agentes de limpieza, y emulsionantes. A continuación se describen algunos componentes.

Un agente humectante es una sustancia que cuando se añade a un líquido aumenta la potencia de esparcido o penetración del líquido reduciendo la tensión interfacial entre el líquido y la superficie sobre la que se extiende. Los agentes humectantes se usan para dos funciones principales en las formulaciones agroquímicas: durante el procesamiento y fabricación para aumentar la velocidad de humectación de polvos en agua para hacer concentrados para líquidos solubles o concentrados en suspensión; y durante la mezcla de un producto con agua en un tanque de pulverización para reducir el tiempo de humectación de polvos humectables y para mejorar la penetración del agua en los gránulos dispersables en agua. Ejemplos de agentes humectantes usados en formulaciones de polvo humectable, concentrado en suspensión, y gránulos dispersables en agua son: laurilsulfato sódico; dioctil sulfosuccinato sódico; etoxilados de alquil fenol; y etoxilados de alcohol alifático.

Un agente dispersante es una sustancia que se absorbe sobre la superficie de las partículas y ayuda a conservar el estado de dispersión de las partículas y previene su reagregación. Se añaden agentes dispersantes a formulaciones agroquímicas para facilitar la dispersión y suspensión durante la fabricación, y para asegurar que las partículas se vuelvan a dispersar en el agua en un tanque de pulverización. Se usan ampliamente en polvos humectables, concentrados en suspensión y gránulos dispersables en agua. Los tensioactivos que se usan como agentes dispersantes tienen la capacidad de absorberse fuertemente sobre una superficie de partícula y proporcionar una barrera cargada o estérica para la reagregación de partículas. Los tensioactivos más comúnmente usados son aniónicos, no-iónicos, o mezclas de los dos tipos. Para formulaciones de polvo humectable, los agentes dispersante más comunes son lignosulfonatos sódicos. Para concentrados en suspensión, se obtienen muy buenas absorciones y estabilizaciones usando polielectrolitos, como condensados de naftalenosulfonato sódico de formaldehído. También se usan ésteres de fosfato de etoxilato de triestirilfenol. Los compuestos no iónicos como condensados de óxidos de alquilariletano y copolímeros en bloque EO-PO se combinan a veces con agentes aniónicos como agentes dispersantes para concentrados en suspensión. En los últimos años, se han desarrollado nuevos tipos de tensioactivos poliméricos de muy alto peso molecular como agentes dispersantes. Éstos tienen "esqueletos" hidrófobos muy largos y un gran número de cadenas de óxido de etileno que forman los "dientes" de un tensioactivo "peine". Estos polímeros de alto peso molecular pueden proporcionar una muy buena estabilidad a largo plazo a concentrados en suspensión porque los esqueletos hidrófobos tienen muchos puntos de anclaje sobre las superficies de partícula. Ejemplos de agentes dispersantes usados en formulaciones agroquímicas son: lignosulfonatos sódicos; condensados de naftalenosulfonato sódico de formaldehído; ésteres de fosfato de etoxilato de triestirilfenol; etoxilatos de alcohol alifático; etoxilatos de alquilo; copolímeros en bloque EO-PO; y copolímeros de injerto.

Un agente emulsionante es una sustancia que estabiliza una suspensión de gotitas de una fase líquida en otra fase líquida. Sin el agente emulsionante, los dos líquidos se separarían en dos fases líquidas inmiscibles. Las mezclas emulsionantes más comúnmente usadas contienen alquilfenol o alcohol alifático con doce o más unidades de óxido de etileno y la sal de calcio soluble en aceite del ácido dodecibencenosulfónico. Un intervalo de valores de equilibrio hidrófilo-lipófilo ("HLB") de 8 a 18 proporcionará normalmente buenas emulsiones estables. La estabilidad de la emulsión se puede a veces mejorar mediante la adición de una pequeña cantidad de un tensioactivo de copolímero en bloque EO-PO.

Un agente solubilizante es un tensioactivo que formará micelas en agua a concentraciones por encima de la concentración micelar crítica. Las micelas son entonces capaces de disolver o solubilizar materiales insolubles en agua dentro de la parte hidrófoba de la micela. El tipo de tensioactivos habitualmente usados son agentes no-iónicos: monooleatos de sorbitán; etoxilatos de monooleato de sorbitán; y ésteres de oleato de metilo.

A veces se usan tensioactivos, ya sea solos o con otros aditivos como aceites minerales o vegetales como adyuvantes de mezcla del tanque de pulverización para mejorar el rendimiento biológico del plaguicida sobre el objetivo. Los tipos de tensioactivos usados para la bio-mejoría dependen en general de la naturaleza y modo de acción del plaguicida. Sin embargo, son frecuentemente no iónicos como: etoxilatos de alquilo; etoxilatos de alcohol alifático lineal; etoxilatos de amina alifática.

Un soporte o diluyente en una formulación agrícola es un material añadido al plaguicida para dar un producto de la fuerza requerida. Los soportes son generalmente materiales con alta capacidad de absorción, mientras que los diluyentes son generalmente materiales con baja capacidad de absorción. Los soportes y diluyentes se usan en la formulación de polvos, polvos humectables, gránulos y gránulos dispersables en agua.

5 Los disolventes orgánicos se usan principalmente en la formulación de concentrados emulsionables, formulaciones de volumen ultra bajo, y en menor grado, formulaciones granulares. Algunas veces se usan mezclas de disolventes. Los primeros grupos principales de disolventes son aceites parafínicos alifáticos como queroseno o parafinas refinadas. El segundo grupo principal y el más común comprende los disolventes aromáticos como xileno y fracciones de alto peso molecular de disolventes aromáticos C9 y C10. Los hidrocarburos clorados son útiles como co-disolventes para prevenir la cristalización de plaguicidas cuando la formulación se emulsiona en agua. Los alcoholes se usan a veces como co-disolventes para aumentar la potencia del disolvente.

15 Los espesantes o agentes gelificantes se usan principalmente en la formulación de concentrados en suspensión, emulsiones y suspoemulsiones para modificar la reología o propiedades de flujo del líquido y para prevenir la separación y sedimentación de las partículas o gotitas dispersadas. Los agentes espesantes, gelificantes y anti-sedimentación se dividen generalmente en dos categorías, concretamente, partículas insolubles en agua y polímeros solubles en agua. Es posible producir formulaciones concentradas en suspensión usando arcillas y sílices. Ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero no se limitan a, montmorillonita, p. ej. bentonita; silicato de magnesio y aluminio; y atapulgita. Los polisacáridos solubles en agua se han usado como agentes gelificantes espesantes durante muchos años. Los tipos de polisacáridos usados más comúnmente son extractos naturales de semillas y algas o son derivados sintéticos de celulosa. Ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero no se limitan a, goma guar; goma algarrobo; carragenano; alginatos; metil celulosa; carboximetil celulosa sódica (SCMC); hidroxietil celulosa (HEC). Otros tipos de agentes anti-sedimentación se basan en almidones modificados, poliácridatos, alcohol polivinílico y óxido de polietileno. Otro buen agente anti-sedimentación es la goma xantana.

25 Los microorganismos causan el deterioro de los productos formulados. Por lo tanto, se usan agentes de conservación para eliminar y reducir su efecto. Ejemplos de tales agentes incluyen, pero no se limitan a: ácido propiónico y su sal sódica; ácido sórbico y sus sales sódica o potásica; ácido benzoico y su sal sódica; sal del ácido *p*-hidroxibenzoico; *p*-hidroxibenzoato de metilo; y 1,2-bencisotiazalin-3-ona (BIT).

30 La presencia de tensioactivos, que disminuyen la tensión interfacial, a menudo hace que las formulaciones acuosas se espumen durante las operaciones de mezcla en la producción y en la aplicación a través de un tanque de pulverización. Con el fin de reducir la tendencia a formar espuma, los agentes antiespumantes se añaden a menudo durante la etapa de producción o antes del llenado en botellas. Generalmente, hay dos tipos de agentes antiespumantes, concretamente, siliconas y no siliconas. Las siliconas son normalmente emulsiones acuosas de dimetil polisiloxano mientras que los agentes antiespumantes no siliconas son aceites insolubles en agua, como octanol y nonanol, o sílice. En ambos casos, la función del agente antiespumante es desplazar el tensioactivo de la interfaz aire-agua.

35 Para más información, véase "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations" editado por D.A. Knowles, copyright 1998 por Kluwer Academic Publishers. Véase también "Insecticides in Agriculture and Environment-Retrospects and Prospects" por A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya, y R. Perry, copyright 1998 por Springer-Verlag.

Aplicaciones

45 La cantidad real de plaguicida a aplicar a los lugares de plagas no es generalmente crítica y se puede determinar fácilmente por los expertos en la técnica. En general, se espera que las concentraciones de aproximadamente 0,01 gramos de plaguicida por hectárea a aproximadamente 5.000 gramos de plaguicida por hectárea proporcionen un buen control.

50 El lugar en el que se aplica el plaguicida puede ser cualquier lugar habitado por una plaga, por ejemplo, cultivos de hortalizas, árboles frutales y de frutos secos, viñas, plantas ornamentales, animales domésticos, superficies interiores o exteriores de edificios, y el suelo alrededor de los edificios. El control de plagas generalmente significa que las poblaciones de plagas, actividad, o ambas, se ven disminuidas en un lugar. Esto puede ocurrir cuando: las poblaciones de plagas son repelidas de un lugar; cuando se incapacitan las plagas, parcial o totalmente, temporal o permanentemente, en o alrededor de un lugar; o se exterminan las plagas, en su totalidad o en parte, en o alrededor de un lugar. Por supuesto puede ocurrir cualquier combinación de estos resultados. Generalmente, las poblaciones de plaga, actividad, o ambas se reducen convenientemente más del cincuenta por ciento, preferiblemente más del 90 por ciento, aún más preferiblemente el 99 por ciento.

55 Generalmente, con cebos, se colocan los cebos en el suelo donde, por ejemplo, pueden entrar en contacto las termitas con el cebo. También se pueden aplicar los cebos a una superficie de un edificio, (superficie horizontal, vertical, o inclinada) donde, por ejemplo, pueden entrar en contacto con el cebo hormigas, termitas, cucarachas, y moscas.

Debido a la singular capacidad de los huevos de algunas plagas para resistir a los plaguicidas, pueden ser deseables las aplicaciones repetidas para controlar las larvas recién emergidas.

5 Se puede usar el movimiento sistémico de los plaguicidas en plantas para controlar plagas en una porción de la planta aplicando los plaguicidas a una parte diferente de la planta, o a un lugar donde el sistema de raíces de una planta pueda absorber plaguicidas. Por ejemplo, el control de insectos de alimentación foliar se puede controlar mediante riego por goteo o aplicación de surcos, o mediante el tratamiento de la semilla antes de la siembra. Se puede aplicar el tratamiento de las semillas a todo tipo de semillas, incluyendo aquellas que germinarán de plantas genéticamente transformadas para expresar rasgos especializados. Ejemplos representativos incluyen aquellas que expresan proteínas tóxicas para plagas de invertebrados, como *Bacillus thuringiensis* u otras toxinas insecticidas, aquellas que expresan resistencia a herbicidas, como semillas "Roundup Ready", o aquellas con genes exógenos "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia a herbicidas, mejora de la nutrición o cualquier otro rasgo beneficioso. Además, dichos tratamientos de semillas con la invención descritos en este documento pueden adicionalmente mejorar la capacidad de una planta para soportar mejor las condiciones de crecimiento estresantes. Esto da lugar a una planta más sana, más vigorosa, que puede dar lugar a rendimientos más altos en la cosecha.

10 Debe ser fácilmente evidente que la invención se puede usar con plantas transformadas genéticamente para expresar rasgos especializados, como *Bacillus thuringiensis* u otras toxinas insecticidas, o aquellas que expresan resistencia a herbicidas, o aquellas con genes exógenos "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia a herbicidas, mejora de la nutrición o cualquier otro rasgo beneficioso. Un ejemplo de tal uso es pulverizar dichas plantas con la invención descrita en este documento.

15 La invención descrita en este documento es adecuada para controlar endoparásitos y ectoparásitos en el sector de la medicina veterinaria o en el campo de la conservación de animales. Los compuestos de acuerdo con la invención se aplican aquí de una manera conocida, como mediante administración oral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, gránulos, por aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, inmersión, pulverización, vertido, manchado, y espolvoreado, y mediante administración parenteral en forma de, por ejemplo, una inyección.

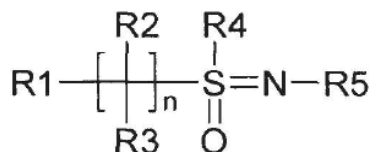
20 La invención descrita en este documento también puede emplearse de forma ventajosa en mantenimiento de ganado, por ejemplo, ganado vacuno, ovejas, cerdos, pollos, y gansos. Se administran oralmente las formulaciones adecuadas a los animales con el agua potable o comida. Las dosificaciones y formulaciones que son adecuadas dependen de la especie.

25 Antes de que se pueda usar o vender comercialmente un plaguicida, dicho plaguicida pasa por largos procesos de evaluación por varias autoridades gubernamentales (locales, regionales, estatales, nacionales, internacionales). Los voluminosos requisitos de datos se especifican por las autoridades reguladoras y se deben abordar a través de la generación y presentación de datos por el registrante del producto o por otro en nombre del registrante del producto. Estas autoridades gubernamentales revisan entonces esos datos y si se concluye una determinación de seguridad, proporcionan al usuario potencial o al vendedor la aprobación del registro del producto. A partir de entonces, en esa localidad donde se concede y apoya el registro del producto, dicho usuario o vendedor puede usar o vender dicho plaguicida.

30 Los encabezados de este documento son sólo por conveniencia y no deben usarse para interpretar ninguna parte de los mismos.

REIVINDICACIONES

1. Una composición que comprende un compuesto que tiene la siguiente fórmula general:



en donde

5 R1 es

(a) un pirimidinilo, piridazinilo, o pirazinilo no sustituido, o

(b) un pirimidinilo, piridazinilo, o pirazinilo sustituido, en donde cada pirimidinilo, piridazinilo, o pirazinilo sustituido tiene uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxi, halo, o halo(C₁-C₆)alquilo;

R2 es H, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxi, halo, o halo(C₁-C₆)alquilo;

R3 es H, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxi, halo, o halo(C₁-C₆)alquilo;

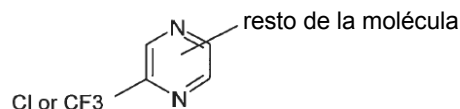
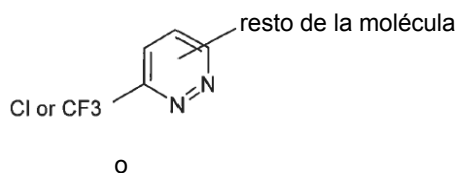
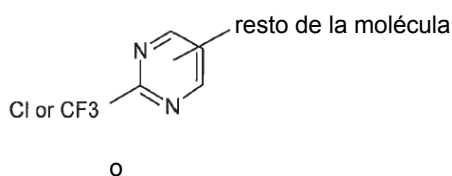
15 R4 es H, (C₂-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)alqueniloxi, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)alquiniloxi, arilo, (C₃-C₆)cicloalquenilo, (C₃-C₆)cicloalqueniloxi, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalcoxi, halo, o halo(C₁-C₆)alquilo;

R5 es NO₂, CN, o CO₂R₆,

en donde R6 = (C₁-C₃)alquilo; y

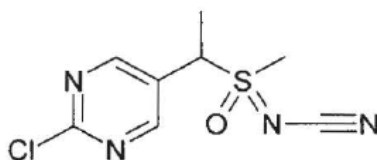
n es 0, 1, 2, o 3.

20 2. Una composición según la reivindicación 1 en donde R1 es

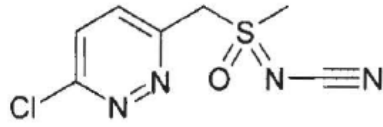


25

3. Una composición según la reivindicación 1 que comprende un compuesto que tiene la siguiente fórmula

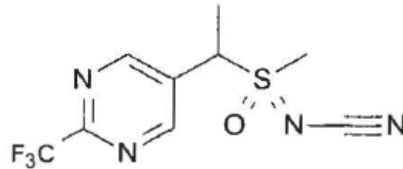


4. Una composición según la reivindicación 1 que comprende un compuesto que tiene la siguiente fórmula



(2)

5. Una composición según la reivindicación 1 que comprende un compuesto que tiene la siguiente fórmula



(3)

6. La composición según la reivindicación 1, en donde R1 es un pirimidinilo, piridazinilo, o pirazinilo sustituido, en donde cada pirimidinilo, piridazinilo, o pirazinilo sustituido tiene uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halo o halo(C_1 - C_6)alquilo.
7. La composición según la reivindicación 1, en donde R2 es H o (C_1 - C_6)alquilo.
8. La composición según la reivindicación 1, en donde R3 es H o (C_1 - C_6)alquilo.
9. La composición según la reivindicación 1, en donde R4 es H o (C_1 - C_6)alquilo.
10. 10. La composición según la reivindicación 1, en donde R5 es NO_2 o CN.
11. Un proceso no terapéutico que comprende aplicar una composición según la reivindicación 1 o 2 a una localización para controlar plagas.