

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 702 336**

51 Int. Cl.:

**C07D 471/04** (2006.01)  
**A01N 43/90** (2006.01)  
**A01P 7/02** (2006.01)  
**A01P 7/04** (2006.01)  
**A61K 31/444** (2006.01)  
**A61P 33/14** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **06.03.2015 PCT/JP2015/056647**

87 Fecha y número de publicación internacional: **11.09.2015 WO15133603**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.03.2015 E 15758439 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **07.11.2018 EP 3115363**

54 Título: **Compuesto heterocíclico condensado y su aplicación para el control de plagas**

30 Prioridad:

**07.03.2014 JP 2014044688**

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

**28.02.2019**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**TANABE, TAKAMASA;  
MIZUNO, HAJIME y  
OKAMOTO, HIROSHI**

74 Agente/Representante:

**VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro**

ES 2 702 336 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

Compuesto heterocíclico condensado y su aplicación para el control de plagas

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a cierto tipo de compuesto heterocíclico condensado y a su aplicación para el control de plagas.

10 **Antecedentes de la técnica**

Hasta ahora, se han estudiado muchos compuestos para controlar plagas y se han aplicado a un uso práctico.

Además, se conoce cierto tipo de compuesto heterocíclico condensado (ver, por ejemplo, Bibliografía de Patentes 1).

15 (Documentos de la técnica relacionados)

(Documentos de Patente)

20 Bibliografía de Patentes 1: documento WO 2013/018928

**Sumario de la invención****(Problemas a resolver por medio de la Invención)**

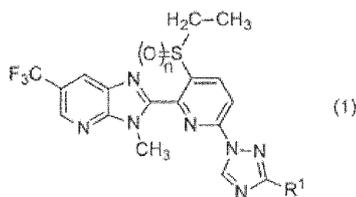
25 Un objetivo de la presente invención es proporcionar un compuesto que tenga una excelente eficacia sobre el control de plagas y un método para controlar plagas usando el mismo.

**(Medios para resolver los problemas)**

30 Los presentes inventores han estudiado intensamente para resolver el problema antes mencionado y han descubierto que un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula (1) mencionada más abajo tiene una excelente eficacia sobre el control de plagas.

35 La presente invención proporciona:

[1] Un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula (1):



40 en la que

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C3, un grupo alcóxicarbonilo C2-C4, un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>, un NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>, un grupo nitro o un grupo ciano;

45 R<sup>2</sup> representa un grupo alquilo C1-C3;

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son iguales o diferentes entre sí y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3;

50 n es 0, 1 o 2; y

m es 0, 1 o 2

o un N-óxido del mismo (en lo sucesivo, el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula (1) o un N-óxido del mismo se menciona como "presente compuesto").

55 [2] El compuesto de acuerdo con [1], en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C3 o un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>.

[3] El compuesto de acuerdo con [1], en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo perfluoroalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3 o un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>.

[4] El compuesto de acuerdo con [1], en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo

de bromo, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi, un grupo metilsulfanilo, un grupo metilsulfinilo o un grupo metilsulfonilo.

[5] El compuesto de acuerdo con [1], en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi, un grupo metilsulfanilo o un grupo metilsulfonilo.

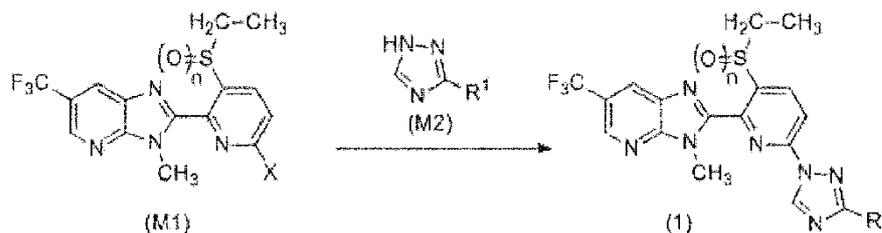
[6] El compuesto de acuerdo con [1], en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno.

[7] El compuesto de acuerdo con una cualquiera de [1] a [6], en el que n es 2.

[8] Una composición para controlar un organismo perjudicial que comprende el compuesto de acuerdo con una cualquiera de [1] a [7] y un vehículo inerte.

[9] Un método para controlar un organismo perjudicial, que comprende una etapa de aplicación de una cantidad efectiva del compuesto de acuerdo con una cualquiera de [1] a [7] a un organismo perjudicial o un hábitat donde vive el organismo perjudicial.

[10] Un método para producir un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula (1), que comprende una etapa de reacción de un compuesto representado por la fórmula (M1) con un compuesto representado por la fórmula (M2):



en la que

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C3, un grupo alcoxycarbonilo C2-C4, un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>, un NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>, un grupo nitro o un grupo ciano;

R<sup>2</sup> representa un grupo alquilo C1-C3;

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son iguales o diferentes entre sí y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3;

n es 0, 1 o 2; y

m es 0, 1 o 2

o un N-óxido del mismo; y

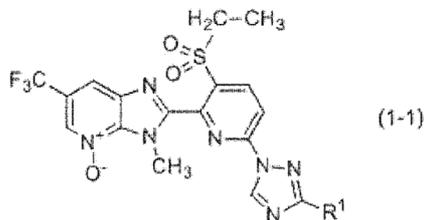
X es un átomo de halógeno.

[11] El método de acuerdo con [10], en el que la etapa de reacción del compuesto representado por la fórmula (M1) con el compuesto representado por la fórmula (M2) se lleva a cabo en presencia de una base.

[12] El método de acuerdo con la reivindicación [11], en el que la base es hidruro de metal alcalino, hidruro de metal alcalinotérreo o carbonato de metal alcalino.

### Modo de llevar a cabo la invención

En el presente compuesto, el N-óxido incluye un compuesto representado por la fórmula (1-1).



en la que cada símbolo es como se definió en la fórmula (1).

En el presente compuesto, la expresión "átomo de halógeno" representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

En el presente compuesto, la expresión "grupo alquilo C1-C3" incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo.

En el presente compuesto, la expresión "grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno" representa un grupo alquilo C1-C3 en el que al menos un átomo de hidrógeno puede estar opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, cada uno de los átomos de halógeno pueden ser iguales o

diferentes entre sí, e incluyen, por ejemplo, un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo yodometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo bromodifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo 2-10-fluoroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo heptafluoropropilo y un grupo heptafluoroisopropilo.

El "grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno" antes mencionado también se expresa mediante la expresión "grupo haloalquilo C1-C3", y en el presente compuesto, la expresión "grupo haloalquilo C1-C3" representa un grupo alquilo C1-C3, en la que al menos un átomo de hidrógeno está sustituido con un átomo de halógeno y cuando dos o más átomos de hidrógeno están sustituidos con átomos de halógeno, cada uno de los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes entre sí.

La expresión "grupo haloalquilo C1-C3" incluye, por ejemplo, un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo difluorometilo, un grupo yodometilo, un grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo bromodifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2, 2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo heptafluoropropilo y un grupo heptafluoroisopropilo.

La expresión "un grupo perfluoroalquilo C1-C3" representa un grupo alquilo C1-C3, en el que todos los átomos de hidrógeno están sustituidos con un átomo de flúor y específicamente incluyen, por ejemplo, un grupo trifluorometilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo heptafluoropropilo y un grupo heptafluoroisopropilo.

En el presente compuesto, la expresión "grupo alcoxi C1-C3" incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propiloxi y un grupo isopropoxi.

En el presente compuesto, la expresión "grupo amino" definido por  $\text{NR}^3\text{R}^4$  representa un grupo en el que  $\text{R}^3$  y  $\text{R}^4$  representan ambos un átomo de hidrógeno.

En el presente compuesto, la expresión "un grupo alquil C1-C3-amino" definido por  $\text{NR}^3\text{R}^4$  incluye, por ejemplo, un grupo metilamino, un grupo etilamino, un grupo propilamino y un grupo isopropilamino.

En el presente compuesto, la expresión "un grupo di(alquil C1-C3)amino" definido por  $\text{NR}^3\text{R}^4$  incluye, por ejemplo, un grupo N,N-dimetilamino, un grupo N,N-dipropilamino, un grupo N,N-diisopropilamino, un grupo N-metil-N-etilamino, un grupo N-metil-N-propilamino, un grupo N-metil-N-isopropilamino, un grupo N-etil-N-propilamino y un grupo N-etil-N-isopropilamino.

En el presente compuesto, la expresión "grupo alcoxycarbonilo C2-C4" representa un grupo en el que el grupo alcoxi C1-C3 se une a un grupo carbonilo e incluye, por ejemplo, un grupo metoxycarbonilo, un grupo etoxycarbonilo, un grupo propoxycarbonilo y un grupo isopropoxycarbonilo.

En el presente compuesto, la expresión " $\text{S}(\text{O})_m\text{R}_2$ " representa un grupo alquilsulfanilo C1-C3 cuando m es 0, un grupo alquilsulfonilo C1-C3 cuando m es 1 y un grupo alquilsulfonilo C1-C3 cuando m es 2.

El grupo alquilsulfanilo C1-C3 incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfanilo, un grupo etilsulfanilo, un grupo propilsulfanilo y un grupo isopropilsulfanilo.

El grupo alquilsulfonilo C1-C3 incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo propilsulfonilo y un grupo isopropilsulfonilo.

El grupo alquil-sulfonilo C1-C3 incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo.

El presente compuesto (1) abarca un compuesto marcado con isótopos (tales como  $^3\text{H}$ ,  $^{13}\text{C}$ ,  $^{14}\text{C}$ ,  $^{15}\text{N}$ ,  $^{18}\text{F}$ ,  $^{35}\text{S}$  y  $^{125}\text{I}$ ) o el producto de intercambio de deuterio.

Un ejemplo de la realización del presente compuesto incluye los siguientes:

un compuesto de fórmula (1), en la que n es 0 ( $n=0$ );

un compuesto de fórmula (1), en la que n es 1 ( $n=1$ );

un compuesto de fórmula (1), en la que n es 2 ( $n=2$ );

un compuesto de fórmula (1), en la que  $\text{R}^1$  representa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno;

un compuesto de fórmula (1) en la que  $\text{R}^1$  representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un átomo de bromo;

un compuesto de fórmula (1) en la que  $\text{R}^1$  representa un átomo de hidrógeno;

un compuesto de fórmula (1) en la que  $\text{R}^1$  representa un átomo de halógeno;

un compuesto de fórmula (1) en la que  $\text{R}^1$  representa un átomo de cloro o un átomo de bromo;

- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3 sustituido con uno o más átomos de halógeno;
- 5 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo perfluoroalquilo C1-C3;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilo o un grupo trifluorometilo;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo metilo;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo haloalquilo C1-C3;
- 10 un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo perfluoroalquilo C1-C3;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo trifluorometilo;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo alcoxi;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo metoxi;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un  $S(O)_mR^2$ ;
- 15 un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfanilo, un grupo metilsulfinilo o un grupo metilsulfonilo;
- un compuesto de fórmula (1), en la que  $R^1$  representa un grupo alquilsulfanilo C1-C3 o un grupo alquilsulfonilo C1-C3;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfanilo o un grupo metilsulfonilo;
- 20 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilsulfanilo C1-C3;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfanilo;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilsulfonilo C1-C3;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfonilo;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un  $NR^3R^4$ ;
- 25 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo amino, un grupo alquilamino C1-C3, un grupo di(alquil C1-C3)amino o un grupo nitro;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo amino o un grupo nitro;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo amino, un grupo alquil C1-C3 amino o un grupo di(alquil C1-C3) amino;
- 30 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo amino;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alcoxicarbonilo C2-C4 o un grupo ciano;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alcoxicarbonilo C2-C4;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metoxicarbonilo;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo ciano;
- 35 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un átomo de bromo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un átomo de hidrógeno y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un átomo de halógeno y  $n=2$ ;
- 40 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un átomo de cloro o un átomo de bromo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3 que está sustituido con uno o más átomos de halógeno y  $n=2$ ;
- 45 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo perfluoroalquilo C1-C3 y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilo o un grupo trifluorometilo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilo C1-C3 y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilo y  $n=2$ ;
- 50 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo haloalquilo C1-C3 y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo perfluoroalquilo C1-C3 y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo trifluorometilo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alcoxi y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metoxi y  $n=2$ ;
- 55 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un  $S(O)_mR^2$  y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfanilo, un grupo metilsulfinilo o un grupo metilsulfonilo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquilsulfanilo C1-C3 o un grupo alquilsulfonilo C1-C3 y  $n=2$ ;
- 60 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfanilo o un grupo metilsulfonilo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfanilo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo alquil-sulfonilo C1-C3 y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo metilsulfonilo y  $n=2$ ;
- un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un  $NR^3R^4$  y  $n=2$ ;
- 65 un compuesto de fórmula (1) en la que  $R^1$  representa un grupo amino, un grupo alquilamino C1-C3, un grupo di(alquil C1-C3)amino o un grupo nitro y  $n=2$ ;



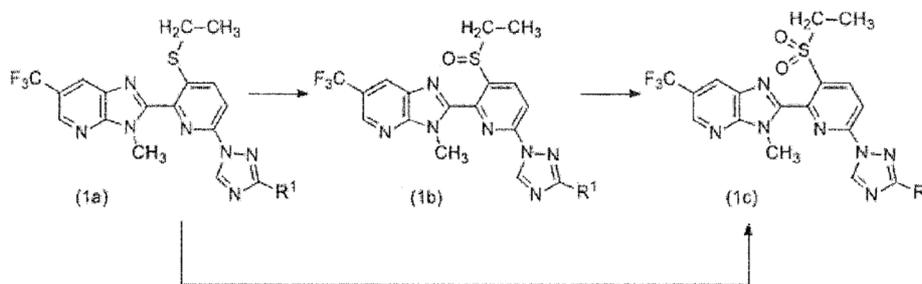
un compuesto de fórmula (1), en la que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3 o un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup> y n=2;  
 un compuesto de fórmula (1), en la que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo perfluoroalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3 o un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup> y n=2;  
 un compuesto de fórmula (1) en la que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi, un grupo metilsulfanilo, un grupo metilsulfinilo o un grupo metilsulfonilo y n=2; y  
 un compuesto de fórmula (1), en la que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi, un grupo metilsulfanilo o un grupo metilsulfonilo y n=2.

A continuación, se explica un proceso para preparar el presente compuesto.

El presente compuesto y los compuestos intermedios para producirlos, se pueden preparar, por ejemplo, de acuerdo con cualquier proceso descrito en el (Proceso 1) al (Proceso 7) siguientes.

(Proceso 1)

Un presente compuesto (1b) como un compuesto de fórmula (1), en la que n = 1 y un presente compuesto (1e) como un compuesto de fórmula (1), en la que n=2, se pueden preparar haciendo reaccionar un presente compuesto (1a) como un compuesto de fórmula (1), en la que n = 0 con un agente oxidante.



[en la que, cada símbolo es como se definió en la fórmula (1)].

En primer lugar, se describe el proceso para preparar el presente compuesto (1b) a partir del presente compuesto (1a).

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; nitrilos tales como acetonitrilo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos del agente oxidante para usar incluyen peryodato de sodio, ácido m-cloroperóxibenzoico y peróxido de hidrógeno.

Si una solución acuosa de peróxido de hidrógeno se usa como el agente oxidante, la reacción también se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base o un catalizador.

Los ejemplos de la base para usar en la reacción incluyen carbonato de sodio.

Los ejemplos del catalizador para usar en la reacción incluyen ácido tungstico y tungstato de sodio.

En la reacción, el agente oxidante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 1,2 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1a).

Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y una base, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 1,2 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 1 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1a).

Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y un catalizador, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 1,2 molar y el catalizador se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 0,5, molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1a).

La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 80 °C. El periodo de reacción de la

reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 12 horas.

5 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolventes orgánicos y las capas orgánicas resultantes se lavan, si es necesario, con una solución acuosa de un agente reductor (tal como sulfito de sodio y tiosulfato de sodio) y una solución acuosa de una base (tal como hidrógenocarbonato de sodio). Las capas orgánicas lavadas se secan y se concentran para aislar el presente compuesto (1b). El presente compuesto aislado (1b) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

10 A continuación, se describe el proceso para preparar el presente compuesto (1c) a partir del presente compuesto (1b).

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

15 Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; nitrilos tales como acetonitrilo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos del agente oxidante para utilizar incluyen ácido m-cloroperoxibenzoico y una solución acuosa de peróxido de hidrógeno.

20 La reacción se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base o un catalizador.

Los ejemplos de la base para usar en la reacción incluyen carbonato de sodio.

25 Los ejemplos del catalizador para usar en la reacción incluyen tungstato de sodio.

En la reacción, el agente oxidante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 4 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1b). Preferiblemente, el agente oxidante se usa dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 2 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1b).

30 Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y una base, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 4 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 1 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1b).

35 Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y un catalizador, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 1,2 molar y el catalizador se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 0,5 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1b).

40 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 120 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 12 horas.

45 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se lavan, si es necesario, con una solución acuosa de un agente reductor (tales como sulfito sodio y tiosulfato de sodio) y una solución acuosa de una base (tal como hidrógenocarbonato de sodio). Las capas orgánicas se secan y se concentran para aislar el presente compuesto (1c). El presente compuesto (1c) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

50 Además, el presente compuesto (1c) se puede preparar en una etapa haciendo reaccionar el presente compuesto (1a) con un agente oxidante.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

55 Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; nitrilos tales como acetonitrilo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de disolventes de los mismos.

60 Los ejemplos del agente oxidante para usar incluyen ácido m-cloroperoxibenzoico y una solución acuosa de peróxido de hidrógeno.

Si una solución acuosa de peróxido de hidrógeno se usa como el agente oxidante para la reacción, la reacción también se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base o un catalizador.

Los ejemplos de la base para usar en la reacción incluyen carbonato de sodio.

Los ejemplos del catalizador para usar en la reacción incluyen ácido tungstico y tungstato de sodio.

- 5 En la reacción, el agente oxidante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 2 a 5 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1a).

10 Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y una base, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 2 a 5 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 1 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1a).

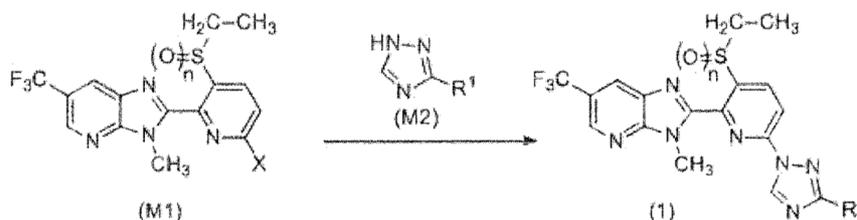
15 Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y un catalizador, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 2 a 5 molar y el catalizador se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 0,5 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1a).

20 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0 a 120 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 12 horas.

25 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se lavan, si es necesario, con una solución acuosa de un agente reductor (tales como sulfito de sodio y tiosulfato de sodio) y una solución acuosa de una base (tal como hidrógenocarbonato de sodio). Las capas orgánicas se secan y se concentran para aislar el presente compuesto (1c). El presente compuesto aislado (1c) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso 2)

- 30 El presente compuesto se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (M1) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M1)") con un compuesto representado por la fórmula (M2)" (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M2)").



- 35 [en la que, X representa un átomo de halógeno y los otros símbolos son como se definen en la fórmula (1)]

El compuesto (M2) se conoce o se puede preparar de acuerdo con el método conocido.

- 40 El presente compuesto (1a) se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto (M1a) como el compuesto (M1), en el que n=0, con el compuesto (M2).

El presente compuesto (1b) se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto (M1b) como el compuesto (M1), en el que n=1 con el compuesto (M2).

- 45 El presente compuesto (1c) se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto (M1c) como el compuesto (M1), en el que n=2, con el compuesto (M2).

50 La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano y éter terc-butilmetílico; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, benceno y xileno; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y dimetilsulfóxido; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y quinolina; y mezclas de disolventes de los mismos.

55 Los ejemplos de la base para usar incluyen hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; hidruros de metal alcalinotérreo tales como hidruro de calcio; y carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; y bases orgánicas tales como trietilamina, diisopropilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina.

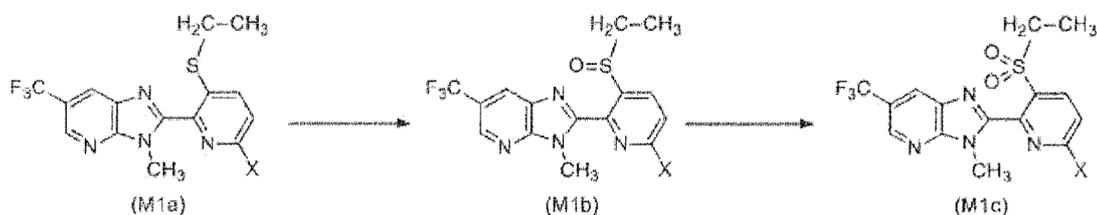
En la reacción, el compuesto (M2) se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 2 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 5 molar, en lugar de 1 mol del compuesto (M1).

- 5 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0 a 120 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se vierten en agua y a continuación se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se concentran; las mezclas de reacción se vierten en agua y los sólidos resultantes se recogen por filtración; de modo alternativo, los sólidos formados en la mezcla de reacción se recogen por filtración, para dar el presente compuesto. El presente compuesto aislado se puede purificar a continuación, por ejemplo, por recristalización y cromatografía.

(Proceso 3)

- 15 El compuesto (M1b) como el compuesto (M1), en el que n=1 y el compuesto (11c) como el compuesto (M1), en el que n=2 se pueden preparar haciendo reaccionar el compuesto (M1a) como el compuesto (M1), en el que n=0 con un agente oxidante.

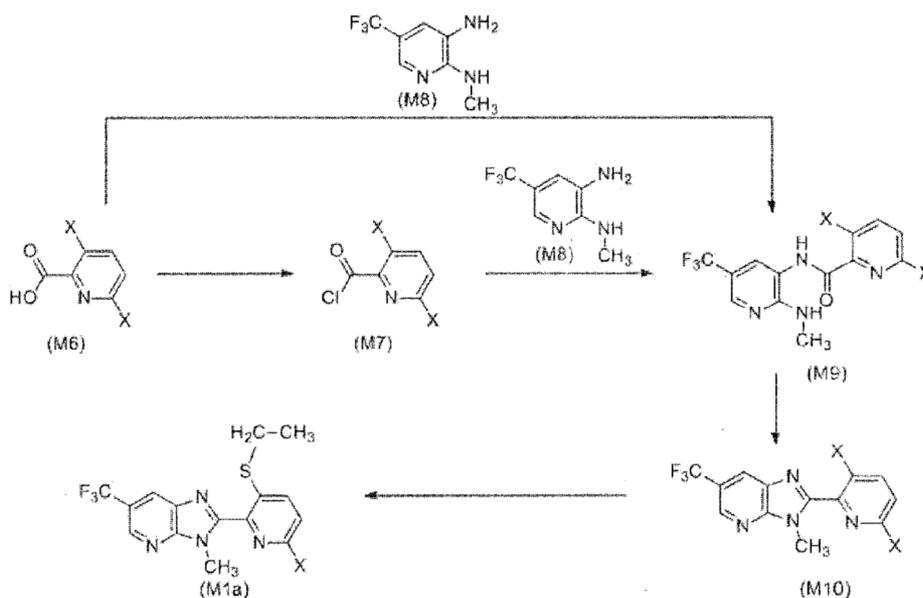


20 [en la que, X representa un átomo de halógeno].

25 La reacción se puede llevar a cabo de acuerdo con la reacción descrita en el Proceso 1 reemplazando el presente compuesto (1a), el presente compuesto (1b) o el presente compuesto (1c) con el compuesto (M1a), el compuesto (M1b) o el compuesto (M1c), respectivamente.

(Proceso 4)

- 30 El compuesto (M1a) como el compuesto (M1), en el que n=0, se puede preparar de acuerdo con el esquema de reacción mencionado más abajo.



35 [en la que, X representa un átomo de halógeno].

Un compuesto representado por la fórmula (M7) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M7)") se puede preparar haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (M6) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M6)") con un agente clorante.

Los ejemplos del compuesto (M6) incluyen ácido 3,6-difluoropiridin-2-carboxílico y ácido 3,6-dicloropiridin-2-carboxílico, los cuales están comercializados.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos del agente clorante para usar incluyen cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo y cloruro de fosforilo.

En la reacción, el agente clorante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 15 molar en lugar de 1 mol del compuesto (M6).

La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez finalizada la reacción, los disolventes de reacción se destilan para aislar el compuesto (M7).

El compuesto representado por la fórmula (M9) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M9)") se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto (M7) con un compuesto representado por la fórmula (M8) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M8)").

La N2-metil-5-(trifluorometil)piridin-2,3-diamina, que se indica como compuesto (M8), se puede preparar mediante un método descrito en el documento WO 2010/125985.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen éteres tales como tetrahidrofurano, etilenglicol dimetil éter, éter terc-butilmetílico y 1,4-dioxano; hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como clorobenceno; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona y dimetilsulfóxido; y mezclas de disolventes de los mismos.

En la reacción, si es necesario, se puede añadir una base.

Los ejemplos de la base para usar incluyen carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y 4-dimetilaminopiridina.

En la reacción, el compuesto (M7) se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 3 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 10 molar, en lugar de 1 mol del compuesto (M8).

La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 100 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez finalizada la reacción, se vierte agua a las mezclas de reacción y las mezclas resultantes se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se procesan (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el compuesto (M9). El compuesto aislado (M9) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

Además, el compuesto (M9) se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto (M6) con el compuesto (M8) en presencia de un agente de condensación.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano y éter terc-butilmetílico; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano y clorobenceno; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, benceno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como clorobenceno; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y dimetilsulfóxido; compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y quinolina; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos del agente de condensación para usar en la reacción incluyen carbodiimidias tales como la sal clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida, y 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

En la reacción, si es necesario, se puede añadir un catalizador.

Los ejemplos del catalizador para usar en la reacción incluyen 1-hidroxibenzotriazol.

En la reacción, el compuesto (M6) se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 2 molar, el agente de condensación se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 5 molar y el catalizador se emplea habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 1 molar, en lugar de 1 mol del compuesto (M8).

La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0 a 120 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se vierten en agua y a continuación se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se concentran; las mezclas de reacción se vierten en agua y los sólidos resultantes se recogen por filtración; de modo alternativo, los sólidos formados en la mezcla de reacción se recogen por filtración, para dar el compuesto (M9). El compuesto aislado (M9) se puede purificar a continuación, por ejemplo, por recristalización y cromatografía.

Un compuesto representado por la fórmula (M10) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M10)") se puede preparar realizando una condensación intermolecular del compuesto (M9).

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahidrofurano y éter terc-butilmetílico; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano y clorobenceno; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, benceno y xileno; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y dimetilsulfóxido; compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y quinolina; y mezclas de disolventes de los mismos.

En la reacción, si es necesario, se puede añadir un agente de condensación, un ácido, una base o un agente colorante.

Los ejemplos del agente de condensación para usar, incluyen anhídridos de ácido tales como anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético; 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida; una mezcla de trifenilfosfina, base y tetracloruro de carbono o tetrabromuro de carbono; y una mezcla de trifenilfosfina y azodiésteres tales como azodicarboxilato de dietilo.

Los ejemplos del ácido para usar incluyen ácidos sulfónicos tales como ácido para-toluensulfónico; ácidos carboxílicos, tales como ácido acético; y ácido polifosfórico.

Los ejemplos de la base para usar incluyen piridina, picolina, 2,6-lutidina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno (en lo sucesivo, a veces mencionado como DBU), compuestos heterocíclicos que contienen nitrógeno tales como 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-5-noneno; aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; y bases inorgánicas tales como fosfato tripotásico, carbonato de potasio e hidruro de sodio.

Los ejemplos del agente clorante para usar incluyen cloruro de fosforilo.

En la reacción, cuando se usa un agente de condensación, el agente de condensación se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 5 molar y cuando se usa un ácido, el ácido se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,1 a 5 molar y cuando se usa una base, la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 5 molar y cuando se usa un agente clorante, el agente clorante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 5 molar, en lugar de 1 mol del compuesto (M9).

La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0 a 200 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se vierten en agua y a continuación se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se concentran; las mezclas de reacción se vierten en agua y los sólidos resultantes se recogen por filtración; de modo alternativo, los sólidos formados en la mezcla de reacción se recogen por filtración, para dar el compuesto (10). El compuesto aislado (10) se puede purificar a continuación, por ejemplo, por recristalización y cromatografía.

Un compuesto representado por la fórmula (M1a) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M1a)") se puede

preparar haciendo reaccionar el compuesto (M10) con etilmercaptano en presencia de una base.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente. Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen éteres tales como tetrahidrofurano, etilenglicol dimetil éter, éter terc-butilmetílico y 1,4- dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona y dimetilsulfóxido; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos de la base para usar incluyen carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; y un hidruro de metal alcalino, tal como hidruro de sodio.

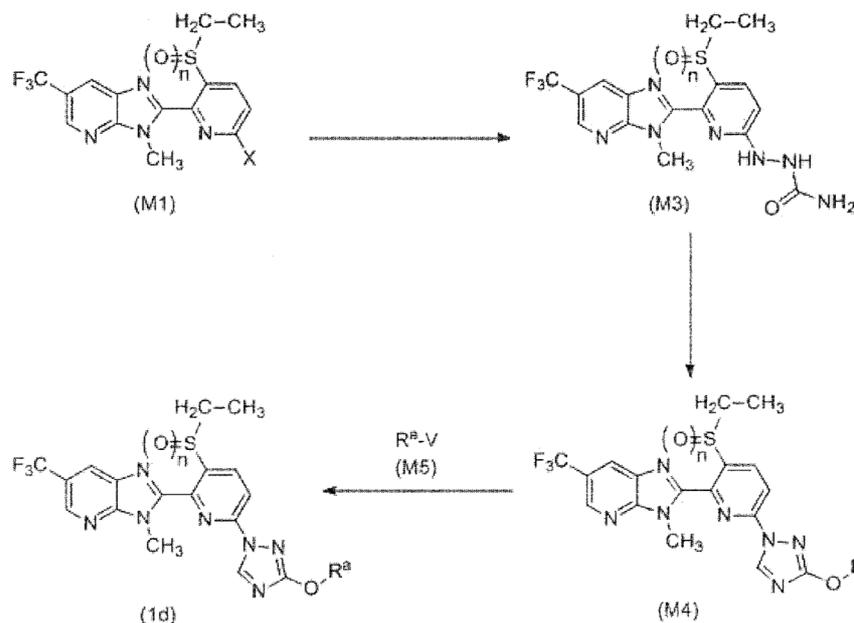
En la reacción, el etilmercaptano se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 10 molar, la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 10 molar, en lugar de 1 mol del compuesto (M10). Preferiblemente, el etilmercaptano se usa dentro de un intervalo de proporción molar de 1,0 a 1,1 molar y la base se usa dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 2 molar, en lugar de 1 mol de compuesto (M10).

La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,5 a 24 horas.

Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se procesan (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el compuesto (M1a). El compuesto aislado (M1a) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso 5)

El presente compuesto (1d) como el compuesto de fórmula (1), en la que R<sup>1</sup> representa un grupo alcoxi C1-C3, se puede preparar, por ejemplo, de acuerdo con el esquema de reacción mencionado más abajo.



[en el que, X representa un átomo de halógeno, R<sup>a</sup> representa un grupo alquilo C1-C3, V representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo y los otros símbolos son como se definen en la fórmula (1)].

Un compuesto representado por la fórmula (M3) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M3)") se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto (M1) con clorhidrato de semicarbazida en presencia de una base.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen nitrilos tales como acetonitrilo; y disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y dimetilsulfóxido; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos de la base para usar en la reacción incluyen carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; aminas terciarias tales como trietilamina y diisopropiltilo; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y 4- dimetilaminopiridina.

En la reacción, el clorhidrato de semicarbazida se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 3 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporciones de 1 a 10 molar, en lugar de 1 mol de compuesto (M1).

5 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 100 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

10 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se vierten en agua y se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se concentran; las mezclas de reacción se vierten en agua y los sólidos resultantes se recogen por filtración; de modo alternativo, los sólidos formados en las mezclas de reacción se recogen por filtración, para dar el compuesto (M3). El compuesto aislado (M3) se puede purificar a continuación, por ejemplo, por recristalización y cromatografía.

15 Un compuesto representado por la fórmula (M4) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M4)") se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto (M3) con ácido fórmico u ortoformiato de trialquilo.

20 Los ejemplos del ortoformiato de trialquilo para usar en la reacción incluyen ortoformiato de trimetilo y ortoformiato de trietilo.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

25 Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados tales como 1,2-dicloroetano y clorobenceno; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, benceno y xileno; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y dimetilsulfóxido; alcoholes tales como metanol, etanol y n-butanol; y mezclas de disolventes de los mismos.

Cuando se usa ácido fórmico en la reacción, el ácido fórmico se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 10 molar en lugar de 1 mol del compuesto (M3).

30 Cuando se usa en la reacción ortoformiato de trialquilo, el ortoformiato de alquilo se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 10 molar en lugar de 1 mol del compuesto (M3).

35 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

40 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se vierten en agua y se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se concentran; las mezclas de reacción se vierten en agua y los sólidos resultantes se recogen por filtración; de modo alternativo, los sólidos formados en las mezclas de reacción se recogen por filtración, para dar el compuesto (M4). El compuesto aislado (M4) se puede purificar a continuación, por ejemplo, por recristalización y cromatografía.

El presente compuesto (1d) se puede preparar haciendo reaccionar el compuesto (M4) con un compuesto representado por la fórmula (M5) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (M5)") en presencia de una base.

45 Los ejemplos del compuesto (M5) incluyen yodometano, yodoetano, 1-yodopropano y 2-yodopropano, los cuales están comercializados.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

50 Ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen éteres tales como 1,4-dioxano, éter dietílico, tetrahydrofurano y éter terc-butilmetílico; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, benceno y xileno; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y dimetilsulfóxido; y mezclas de disolventes de los mismos.

55 Los ejemplos de la base para usar incluyen un metal alcalino tales como hidruro de sodio e hidruros de metal alcalinotérreo tales como hidruro de potasio e hidruro de calcio; y carbonatos de metal alcalino tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; y bases orgánicas tales como trietilamina, diisopropiletilamina, piridina, 4-dimetilaminopiridina.

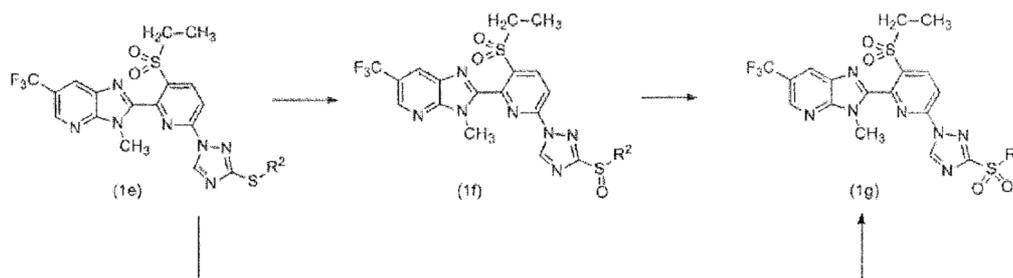
60 En la reacción, el compuesto (M5) se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 10 molar, la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,1 a 5 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (M4).

65 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 120 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Una vez finalizada la reacción, las mezclas de la reacción se vierten en agua y se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se concentran; las mezclas de reacción se vierten en agua y los sólidos resultantes se recogen por filtración; de modo alternativo, los sólidos formados en las mezclas de reacción se recogen por filtración, para dar el presente compuesto (1d). El presente compuesto aislado (1d) se puede purificar a continuación, por ejemplo, por recristalización y cromatografía.

Proceso 6

El presente compuesto (1g) como el compuesto de la fórmula (1), en la que n es 2, R<sup>1</sup> representa S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup> y m es 2 y el presente compuesto (f) como el compuesto de fórmula (1), en la que n es 2, R<sup>1</sup> representa S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup> y m es s, se puede preparar haciendo reaccionar el presente compuesto (1e) como el compuesto de fórmula (1), en la que n es 2, R<sup>1</sup> representa S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup> y m es 0 con un agente oxidante.



[en la que, los símbolos son igual que lo definido en la fórmula (1)].

El presente compuesto (1f) se puede preparar haciendo reaccionar el presente compuesto (1e) con un agente oxidante.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; nitrilos tales como acetonitrilo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos del agente oxidante para usar incluyen peróxido de sodio, ácido m-cloroperoxibenzoico y peróxido de hidrógeno.

Si una solución acuosa de peróxido de hidrógeno se usa como el agente oxidante, la reacción también se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base o un catalizador.

Los ejemplos de la base para usar en la reacción incluyen carbonato de sodio.

Los ejemplos del catalizador para usar en la reacción incluyen ácido tungstico y tungstato de sodio.

En la reacción, el agente oxidante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 1,2 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1e).

Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y una base, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 1,2 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 1 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1e).

Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y un catalizador, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 1,2 molar y el catalizador se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 0,5 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1e).

La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 80 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 12 horas.

Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se lavan, si es necesario, con una solución acuosa de un agente reductor (tal como sulfito de sodio y tiosulfato de sodio) y una solución acuosa de una base (tal como hidrógenocarbonato de sodio). Las capas orgánicas lavadas se secan y se concentran para aislar el presente compuesto (1f). El presente compuesto aislado (1f) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

El presente compuesto (1g) se puede preparar haciendo reaccionar el presente compuesto (1f) con un agente oxidante.

5 La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano, y cloroformo; nitrilos tales acetonitrilo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de disolventes de los mismos.

10 Los ejemplos del agente oxidante para usar incluyen peryodato de sodio, ácido m-cloroperoxibenzoico y solución acuosa de peróxido de hidrógeno.

15 La reacción se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base o un catalizador.

Los ejemplos de la base para usar en la reacción incluyen carbonato de sodio.

Los ejemplos del catalizador para usar en la reacción incluyen tungstato de sodio.

20 En la reacción, el agente oxidante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 4 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1f). Preferiblemente, el agente oxidante se usa dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 2 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1f).

25 Cuando la reacción emplea una solución acuosa peróxido de hidrógeno y una base, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 4 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 0,5 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1f).

30 Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y un catalizador, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 4 molar y el catalizador se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 0,5 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1f).

35 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 120 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 12 horas.

40 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se lavan, si es necesario, con una solución acuosa de un agente reductor (tal como sulfito de sodio y tiosulfato de sodio) y una solución acuosa de una base (tal como hidrógenocarbonato de sodio). Las capas orgánicas lavadas se secan y se concentran para aislar el presente compuesto (1g). El presente compuesto aislado (1g) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

45 Además, el presente compuesto (1g) se puede preparar en una etapa haciendo reaccionar el presente compuesto (1e) con un agente oxidante.

La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

50 Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo; nitrilos tales como acetonitrilo; alcoholes tales como metanol y etanol; ácido acético; agua; y mezclas de disolventes de los mismos.

Los ejemplos del agente oxidante para usar incluyen ácido m-cloroperoxibenzoico y una solución acuosa de peróxido de hidrógeno.

55 Si una solución acuosa de peróxido de hidrógeno se usa como el agente oxidante para la reacción, la reacción también se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base o un catalizador.

Los ejemplos de la base para usar en la reacción incluyen carbonato de sodio.

60 Los ejemplos del catalizador para usar en la reacción incluyen ácido tungstico y tungstato de sodio.

En la reacción, el agente oxidante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 2 a 5 molar en lugar de 1 mol del presente compuesto (1e).

65 Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y una base, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 2 a 5 molar y la base se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 1 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto

(1e).

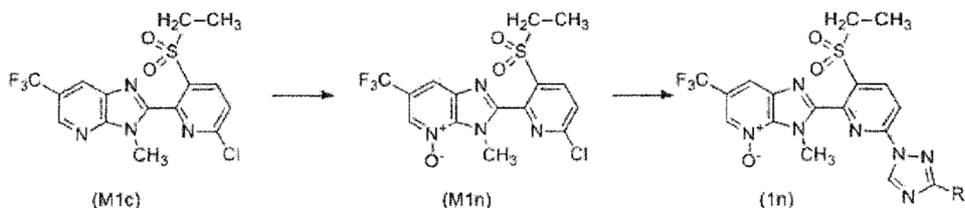
5 Cuando la reacción emplea una solución acuosa de peróxido de hidrógeno y un catalizador, la solución acuosa de peróxido de hidrógeno se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 2 a 5 molar y el catalizador se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 0,01 a 0,5 molar, en lugar de 1 mol del presente compuesto (1e).

10 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0 a 120 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 12 horas.

15 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se lavan, si es necesario, con una solución acuosa de un agente reductor (tal como sulfito de sodio y tiosulfato de sodio) y una solución acuosa de una base (tal como hidrógenocarbonato de sodio). Las capas orgánicas se secan y se concentran para aislar el presente compuesto (1g). El presente compuesto (1g) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso 7)

20 El compuesto de N-óxido representado por la fórmula (1n) (en lo sucesivo, mencionado como "presente compuesto (1n)") se puede preparar, por ejemplo, de acuerdo con la síntesis mencionada abajo.



25 [en la que, los símbolos son como se definen en la fórmula (1)]

En primer lugar, el proceso para preparar un compuesto representado por la fórmula (M1n) (en lo sucesivo, mencionado como "compuesto (1ln)") a partir del compuesto (M1c).

30 La reacción se lleva a cabo habitualmente en presencia de disolvente.

Los ejemplos del disolvente para usar en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados alifáticos tales como diclorometano y cloroformo.

35 Los ejemplos del agente oxidante para usar incluyen ácido m-cloroperoxibenzoico.

En la reacción, el agente oxidante se utiliza habitualmente dentro de un intervalo de proporción molar de 1 a 10 molar en lugar de 1 mol de compuesto (M1c).

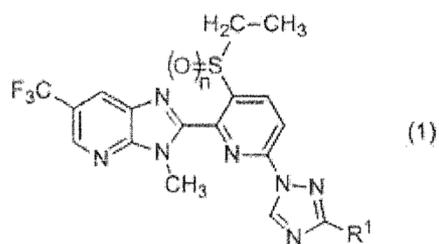
40 La temperatura de reacción está habitualmente dentro de un intervalo de -20 a 80 °C. El período de reacción de la reacción está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 12 horas.

45 Una vez finalizada la reacción, las mezclas de reacción se extraen con disolvente(s) orgánico(s) y las capas orgánicas resultantes se lavan, si es necesario, con una solución acuosa de un agente reductor (tal como sulfito de sodio y tiosulfato de sodio) y una solución acuosa de una base (tal como hidrógenocarbonato de sodio). Las capas orgánicas se secan y se concentran para aislar el compuesto (M1n). El compuesto (M1n) se puede purificar adicionalmente, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

A continuación, se describe el proceso para preparar el presente compuesto (1n) a partir del compuesto (M1n).

50 El presente compuesto (1n) se puede preparar de acuerdo con un método descrito en el proceso 2 o el proceso 5 usando el compuesto (M1n) en lugar del compuesto (M1).

A continuación, se muestran ejemplos específicos del presente compuesto.



un presente compuesto de fórmula (1), en la que n y R<sup>1</sup> representan una de sus combinaciones enumeradas en las Tablas 1 a 3:

5

Tabla 1

R <sup>1</sup>	n
H	0
H	1
H	2
F	0
F	1
F	2
Cl	0
Cl	1
Cl	2
Br	0
Br	1
Br	2
I	0
I	1
I	2
CH <sub>3</sub>	0
CH <sub>3</sub>	1
CH <sub>3</sub>	2
CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
CF <sub>3</sub>	0
CF <sub>3</sub>	1
CF <sub>3</sub>	2
CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2
CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2
CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2
OCH <sub>3</sub>	0
OCH <sub>3</sub>	1
OCH <sub>3</sub>	2
OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2

OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2

Tabla 2

R <sup>1</sup>	n
SCH <sub>3</sub>	0
SCH <sub>3</sub>	1
SCH <sub>3</sub>	2
SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
S(O)CH <sub>3</sub>	0

R <sup>1</sup>	n
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
S(O) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
S(O) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
S(O) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
NH <sub>2</sub>	0
NH <sub>2</sub>	1
NH <sub>2</sub>	2
NHCH <sub>3</sub>	0

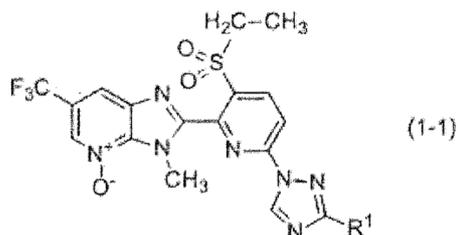
S(O)CH <sub>3</sub>	1
S(O)CH <sub>3</sub>	2
S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
S(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
S(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
S(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2

NHCH <sub>3</sub>	1
NHCH <sub>3</sub>	2
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2

Tabla 3

R <sup>1</sup>	n
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
N[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>	0
N[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>	1
N[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>	2
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2

N (CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
N(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
N (CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
N (CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
N (CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
N (CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
N (CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
N (CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
N (CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
C(O)OCH <sub>3</sub>	0
C(O)OCH <sub>3</sub>	1
C(O)OCH <sub>3</sub>	2
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	1
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2
C(O)OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	0
C(O)OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	1
C(O)OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2
NO <sub>2</sub>	0
NO <sub>2</sub>	1
NO <sub>2</sub>	2
CN	0
CN	1
CN	2



un presente compuesto de fórmula (1-1) en la que R<sup>1</sup> representa un resto enumerado en la Tabla 4:

5

Tabla 4

R <sup>1</sup>
H
F
Cl
Br
I
CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
CF <sub>3</sub>
CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
OCH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
SCH <sub>3</sub>
SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
SCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

S(O)CH <sub>3</sub>
S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S(O) CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S(O)CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S(O) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S(O) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
NH <sub>2</sub>
NHCH <sub>3</sub>
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
N[CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> ] <sub>2</sub>
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
N(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
C(O)OCH <sub>3</sub>
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
C(O)OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
NO <sub>2</sub>
CN

Los organismos perjudiciales sobre las que un compuesto de la presente invención tiene una eficacia de control incluyen, por ejemplo, artrópodos dañinos tales como insectos dañinos y ácaros dañinos y nematodos dañinos tales como gusanos redondos. Ejemplos específicos de organismos perjudiciales son los siguientes:

5

Hemípteros:

*Delphacidae* (por ejemplo, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, o *Sogatella furcifera*),  
*Deltocephalidae* (por ejemplo, *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix virescens*, o *Empoasca onukii*),  
10 *Aphididae* (por ejemplo, *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis spiraecola*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Rhopalosiphum padi*, *Toxoptera citricidus*, o *Hyalopterus pruni*),  
*Pentatomidae* (por ejemplo, *Nezara antennata*, *Riptortus clavetus*, *Leptocoris chinensis*, *Eysarcoris parvus*, o *Halyomorpha mista*),  
*Aleyrodidae* (por ejemplo, *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci*, *Dialeurodes citri*, o *Aleurocanthus spiniferus*),  
15 *Coccoidea* (por ejemplo, *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosa*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens*, *Icerya purchasi*, *Planococcus Kraunhia*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis Pentagona*),  
*Tingidae*,  
*Cimicoidea* (por ejemplo, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*) y  
20 *Psyllidae*;

20

y otros.

Lepidópteros:

*Pyralidae* (por ejemplo, *Chilo suppressalis*, *Tryporyza incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata*,  
*Plodia interpunctella*, *Ostrinia furnacalis*, *Hellula undalis*, o *Pediasia teterrellus*),  
*Noctuidae* (por ejemplo, *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Mythimna separata*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis*  
25 *ipilon*, *Plusia nigrisigna*, *Trichoplusia* spp., *Heliothis* spp., o *Helicoverpa* spp.),  
*Pieridae* (por ejemplo, *Pieris rapae*),  
30 Género *Adokisofiesu*,  
*Tortricidae* (por ejemplo, *Grapholita molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Matsumuraeses azukivora*, *Adoxophyes*  
*orana fasciata*, *Adoxophyes honmai*, *Homona magnanima*, *Archips fuscocupreanus*, o *Cydia pomonella*).  
*Gracillariidae* (por ejemplo, *Caloptilia theivora*, o *Phyllonorycter ringoneella*),  
*Carposinidae* (por ejemplo, *Carposina niponensis*),  
35 *Lyonetiidae* (por ejemplo, *Lyonetia* spp.),  
*Lymantriidae* (por ejemplo, *Lymantria* spp., o *Euproctis* spp.),

35

*Yponomeutidae* (por ejemplo, *Plutella xylostella*),  
*Gelechiidae* (por ejemplo, *Pectinophora gossypiella*, o *Phthorimaea operculella*),  
*Arctiidae* (por ejemplo, *Hyphantria cunea*) y  
*Tineidae* (por ejemplo, *Tinea translucens*, o *Tineola bisselliella*);

5 y otros.

Tisanópteros:

10 *Thysanopterae* (por ejemplo, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips tabaci*, *Frankliniella intonsa*),

y otros.

15 Dípteros:

Mosquitos domésticos (*Culex* spp.) (por ejemplo, *Culex pipiens pallens*, *Culex tritaeniorhynchus*, o *Culex quinquefasciatus*),

20 *Aedes* spp. (por ejemplo, *Aedes aegypti*, o *Aedes albopictus*),

*Anopheles* spp. (por ejemplo, *Anopheles sinensis*),

*Chironomidae*,

*Muscidae* (por ejemplo, *Musca domestica*, o *Muscina stabulans*),

*Calliphoridae*,

25 *Sarcophagidae*,

*Fanniidae*,

*Anthomyiidae* (por ejemplo, *Delia platura*, o *Delia antiqua*),

*Agromyzidae* (por ejemplo, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, o *Chromatomyia horticola*),

30 *Chloropidae* (por ejemplo, *Chlorops oryzae*),

*Tephritidae* (por ejemplo, *Dacus cucurbitae*, o *Ceratitis capitata*),

*Drosophilidae*,

*Phoridae* (por ejemplo, *Megaselia spiracularis*),

*Psychodidae* (por ejemplo, *Clogmia albipunctata*),

*Sciaridae*,

35 *Simuliidae*,

*Tabanidae* (por ejemplo, *Tabanus trigonus*),

*Hippoboscidae*,

*Stomoxysidae*,

40 y otros.

Coleópteros:

45 Gusanos de la raíz del maíz (*Diabrotica* spp.) (por ejemplo, *Diabrotica virgifera virgifera*, o *Diabrotica undecimpunctata howardi*),

*Scarabaeidae* (por ejemplo, *Anomala cuprea*, *Anomala rufocuprea*, o *Popillia japonica*),

*Curculionidae* (por ejemplo, *Sitophilus zeamais*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Callosobruchus chienensis*, *Echinocnemus squameus*, *Anthonomus grandis*, o *Sphenophorus venatus*),

50 *Tenebrionidae* (por ejemplo, *Tenebrio molitor*, o *Tribolium castaneum*),

*Chrysomelidae* (por ejemplo, *Oulema oryzae*, *Aulacophora femoralis*, *Phyllotreta striolata*, o *Leptinotarsa decemlineata*),

*Dermestidae* (por ejemplo, *Anthrenus verbasci*, *Dermestes maculatus*),

*Anobiidae* (por ejemplo, *Lasioderma serricorne*),

*Epilachna* (por ejemplo, *Epilachna vigintioctopunctata*),

55 *Scolytidae* (por ejemplo, *Lyctus brunneus*, o *Tomicus piniperda*),

*Bostrichidae*,

*Ptinidae*,

*Cerambycidae* (por ejemplo, *Anoplophora malasiaca*),

*Elateridae* (*Agriotes* spp.),

60 *Paederus fuscipes*

y otros.

Ortópteros:

65 *Locusta migratoria*, *Grylotalpa africana*, *Oxya yezoensis*, *Oxya japonica*, *Grylloidea* y otros.

Sifonápteros:

*Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Pulex irritans*, *Xenopsylla cheopis*, y otros.

Anopluros:

*Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Dalmalinia ovis*, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus* y otros.

Malófagos:

*Dalmalinia ovis*, *Dalmalinia bovis*, *Menopon gallinae*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostrata* y otros.

Himenópteros:

*Formicidae* (por ejemplo, *Monomorium pharaonis*, *Formica fusca japonica*, *Ochetellus glaber*, *Pristomyrmex pungens*, *Pheidole noda*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Linepithema humile*),  
*Vespidae*,  
*Bethylidae*,  
*Tenthredinidae* (por ejemplo, *Athalia rosae*, *Athalia japonica*),

y otros.

Blatáridos:

*Blattella germanica*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Blatta orientalis*, y otros.

Isópteros:

*Reticulitermes speratus*, *Coptotermes formosanus*, *Incisitermes minor*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes satsumensis*, *Glyptotermes nakajimai*, *Glyptotermes fuscus*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes kushimensis*, *Hodotermopsis japonica*, *Coptotermes guangzhoensis*, *Reticulitermes miyatakei*, *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Reticulitermes* sp., *Nasutitermes takasagoensis*, *Pericapritermes nitobei*, *Sinocapritermes mushae*, y otros.

Ácaros:

*Tetranychidae* (por ejemplo, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, u *Oligonychus* spp.);  
*Eriophyidae* (por ejemplo, *Aculops pelekassi*, *Phyllocoptruta citri*, *Aculops lycopersici*, *Calacarus carinatus*, *Acaphylla theavagrans*, *Eriophyes chibaensis*, *Aculus schlechtendali*);  
*Tarsonemidae* (por ejemplo, *Polyphagotarsonemus latus*);  
*Tenuipalpidae* (por ejemplo, *Brevipalpus phoenicis*);  
*Tuckerellidae*;  
*Ixodidae* (por ejemplo, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, *Dermacentor variabilis*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes scapularis*, *Amblyomma americanum*, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*),  
*Acaridae* (por ejemplo, *Tyrophagus putrescentiae*, o *Tyrophagus similis*),  
*Pyroglyphidae* (por ejemplo, *Dermatophagoides farinae*, o *Dermatophagoides ptrebyssus*),  
*Cheyletidae* (por ejemplo, *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis*, *Cheyletus moorei*, o *Cheyletiella yasguri*),  
*Sarcoptidae* (por ejemplo, *Octodectes cynotis*, o *Sarcoptes scabiei*),  
*Demodex folliculorum* (por ejemplo, *Demodex canis*);  
*Listrophoridae*,  
Ácaros oribátidos,  
*Dermanyssidae* (por ejemplo, *Ornithonyssus bacoti*, *Ornithonyssus sylvarum*, o *Dermanyssus gallinae*),  
*Trombiculidae* (por ejemplo, *Leptotrombidium akamushi*),

Arácnidos:

Arañas (por ejemplo, *Chiracanthium japonicum*, o *Latrodectus hasseltii*).

Quilópodos:

*Thereuonema hilgendorfi*, o *Scolopendra subspinipes* y otros,  
Diplópodos:

*Oxidus gracilis*, o *Nedyopus tambanus* y otros.

Isópodos:

5

*Armadillidium vulgare* y otros.

Gastrópodos:

10

*Limax marginatus*, o *Limax flavus* y otros.

Gusanos redondos:

15

*Aphelenchoides besseyi*, *Nothotylenchus acris*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycines*, *Globodera rostochiensis*, *Pratylenchus coffeae*, o *Pratylenchus neglectus* y otros.

El organismo perjudicial descrito en la presente memoria incluye un organismo perjudicial que tiene menor susceptibilidad a los pesticidas frente a un pesticida existente, teniendo así una resistencia a los pesticidas adquirida.

20

El agente para controlar plagas de la presente invención comprende el presente compuesto y un vehículo activo inerte. El agente para controlar plagas se prepara habitualmente mezclando el presente compuesto con un vehículo activo inerte, tal como un vehículo sólido, vehículo líquido o vehículo gaseoso y, si es necesario, añadiendo tensioactivos y los otros agentes auxiliares para la formulación, para formular en concentrados emulsionables, soluciones oleosas, formulaciones en polvo, agentes fluidos secos, gránulos finos, gránulos, polvos humectables, polvos solubles en agua, sustancias fluidas, microcápsulas, aerosoles, agentes fumantes, cebos venenosos, formulaciones resinosas, formulaciones en champú, formulaciones de tipo pasta, espumas, formulaciones de dióxido de carbono, comprimidos y otros. Tales formulaciones se pueden procesar en espirales repelentes de mosquitos, esteras eléctricas repelentes de mosquitos, formulaciones líquidas para mosquitos, agentes fumantes, fumigantes, formulaciones en láminas, formulaciones de aplicación tópica o formulaciones para tratamiento oral.

30

El agente para controlar plagas de la presente invención comprende habitualmente del 0,01 al 95 % en peso del presente compuesto.

35

Los ejemplos del vehículo sólido antes mencionado para usar en la formulación incluyen polvos finos o gránulos de arcillas (por ejemplo, arcilla de caolín, tierra de diatomácea, bentonita, arcilla Fubasami o arcilla blanca ácida), óxidos de silicio hidratados sintéticos, talcos, cerámicas, otros minerales inorgánicos (por ejemplo, sericita, cuarzo, azufre, carbón activado, carbonato de calcio o sílice hidratada) o fertilizantes químicos (por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea o cloruro de amonio) y otros; así como resinas sintéticas (por ejemplo, resinas de poliéster tales como polipropileno, poliacrilonitrilo, metacrilato de polimetilo y tereftalato de polietileno; resinas de nylon (por ejemplo, nylon-6, nylon-11 y nylon-66); resinas de poliamida; poli(cloruro de vinilo), poli(cloruro de vinilideno), copolímeros de cloruro de vinilo-propileno, y otros).

40

45

Los ejemplos de los vehículos líquidos antes mencionados incluyen (por ejemplo, agua; alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, alcohol isopropílico, butanol, hexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, propilenglicol o fenoxietanol); cetonas (por ejemplo, acetona, metiletilcetona o ciclohexanona); hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, tolueno, xileno, etilbenceno, dodecibenceno, fenilxililetano o metilnaftaleno); hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, hexano, ciclohexano, queroseno o aceite ligero); ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, acetato de butilo, miristato de isopropilo, oleato de etilo, adipato de diisopropilo, adipato de diisobutilo o acetato de propilenglicol monometil éter); nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo o isobutironitrilo); éteres (por ejemplo, éter diisopropílico, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetiléter, dietilenglicol dimetiléter, dietilenglicol monometil éter, propilenglicol monometil éter, dipropilenglicol monometil éter o 3-metoxi-3-metil-1-butanol); amidas de ácido (por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N,N-dimetilacetamida); hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, tricloroetano o tetracloruro de carbono); sulfóxidos (por ejemplo, dimetilsulfóxido); propilencarbonato; y aceites vegetales (por ejemplo, aceite de soja o aceite de semillas de algodón).

55

Los ejemplos del vehículo gaseoso antes mencionado incluyen fluorocarbono, gas butano, gas de petróleo licuado (LPG), éter dimetilico y gas dióxido de carbono.

60

Los ejemplos de tensioactivos incluyen tensioactivos no iónicos tales como alquiléteres polioxietilenados, alquilariléteres polioxietilenados y ésteres de ácido graso de polietilenglicol; y tensioactivos aniónicos tales como sulfonatos de alquilo, sulfonatos de alquilbenceno y sulfatos de alquilo.

65

Los ejemplos de los otros agentes auxiliares para la formulación incluyen un aglutinante, un dispersante y un estabilizante. Los ejemplos específicos incluyen caseína, gelatina, polisacáridos (por ejemplo, almidón, goma arábica, derivados celulósicos y ácido alginico), derivados de lignina, bentonita, polímeros sintéticos hidrosolubles (por ejemplo, poli(alcohol vinílico), polivinilpirrolidona y ácidos poliacrílicos), PAP (fosfato de isopropilo ácido), BHT (2,6- di-terc-butil-

4-metilfenol), BHA (una mezcla de 2-terc-butil- 4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol).

Los ejemplos del material de base de la formulación de resina incluyen polímeros de poli(cloruro de vinilo), poliuretano y otros y se puede añadir a estos materiales de base, si es necesario, un plastificante tal como ésteres de ftalato (por ejemplo, dimetilftalato, dioctilftalato), ésteres de ácido adípico y ácido esteárico. La formulación de resina se puede preparar mezclando el compuesto de la presente invención con el material de base antes mencionado, amasando la mezcla, seguido por moldeo por inyección, moldeo por extrusión o moldeo por presión, y similares. La formulación de resina resultante se puede someter a posterior moldeo o procedimiento de corte y similares, si es necesario, se puede procesar en formas tales como una placa, película, cinta, red o cadena. Estas formulaciones de resina se pueden procesar en collares de animales, etiquetas para orejas de animales, productos estratificados, cuerdas de trampa, soportes de jardinería y otros productos.

Los ejemplos de un material de base para los cebos venenosos incluyen ingredientes de cebo tales como granos en polvo, aceite vegetal, sacarido y celulosa cristalina y, si es necesario, con adición de antioxidantes tales como dibutilhidroxitolueno y ácido nordihidroguayarático, conservantes tales como ácido deshidroacético, inhibidores de la ingestión accidental para niños y mascotas tales como chile en polvo, fragancias para atracción de insectos tales como sabor a queso, sabor a cebolla y aceite de cacahuete.

El método para controlar plagas de la presente invención se lleva a cabo aplicando una cantidad efectiva del presente compuesto a un organismo perjudicial directamente y/o su hábitat (por ejemplo, cuerpos de planta, suelo, un interior de una casa, cuerpos animales). En el método para controlar plagas de la presente invención, el presente compuesto se emplea habitualmente en forma de un agente de control de plagas.

Cuando un agente para el control de plagas de la presente invención se usa para controlar plagas en un campo agrícola, la dosis de aplicación como una cantidad del presente compuesto está habitualmente dentro de un intervalo de 1 a 10.000 g por 10.000 m<sup>2</sup>. El concentrado emulsionable, el polvo humectable o la formulación fluida, etc., de un agente para controlar plagas de la presente invención se aplica habitualmente diluyéndolo con agua de modo tal que una concentración del ingrediente activo este dentro de un intervalo de 0,01 a 10.000 ppm. La formulación granular o la formulación en polvo, etc., se aplica habitualmente como tal sin diluirla.

Estas formulaciones o una de sus diluciones acuosas se pueden rociar directamente sobre los organismos perjudiciales o las plantas a proteger de las plagas y también se pueden aplicar al suelo de la tierra cultivable, con el objetivo de controlar los organismos perjudiciales que viven en el mismo. Cuando se aplican al suelo, el suelo puede ser un suelo en el que las plantas se cultivan o el suelo donde se van a cultivar las plantas.

La preparación de resina que se procesa en una lámina o una cadena se puede aplicar envolviendo un cultivo con una lámina o una cadena de la preparación de resina, poniendo una cadena de la preparación de resina alrededor de un cultivo de modo que el cultivo quede rodeado por la cadena o poniendo una lámina de la preparación de resina sobre la superficie del suelo cerca de la raíz de un cultivo.

El área a la que se aplica el agente para controlar plagas de la presente invención incluye, por ejemplo, arrozales, tierras cultivadas, jardines de té, huertas y tierras no cultivables. Además, el agente para controlar plagas de la presente invención se puede usar en una bandeja de plántulas en crecimiento, una caja de plántulas en crecimiento, una cumblera de plántulas en crecimiento, una estera de plántulas en crecimiento y un medio de cultivo acuoso en una granja hidropónica, y otros. El método para cultivar plantas en arrozales y tierras cultivadas puede ser la labranza o la siembra directa.

Cuando el agente para controlar plagas de la presente invención se usa para controlar plagas que viven dentro de una casa, la dosis de aplicación como una cantidad del presente compuesto está habitualmente dentro de un intervalo de 0,01 a 1.000 mg por 1 m<sup>2</sup> de un área por tratar, en el caso de usarla en un área plana. En el caso de usarla espacialmente, la dosis de aplicación como una cantidad del presente compuesto está habitualmente dentro de un intervalo de 0,01 a 500 mg por 1 m<sup>3</sup> del espacio a tratar. Cuando el agente para controlar plagas de la presente invención se fórmula en concentrados emulsionables, polvos humectables, compuestos fluidos u otros, estas formulaciones se aplican habitualmente después de diluirlo con agua de modo que una concentración del ingrediente activo esté dentro de un intervalo de 0,1 a 10.000 ppm y a continuación rociándolo. En el caso de formularlas en soluciones oleosas, aerosoles, agentes fumantes, cebos venenosos y otros, estas formulaciones se usan como tal sin diluirlas.

Cuando el agente para controlar plagas de la presente invención se aplica para controlar parásitos externos del ganado tales como vacas, caballos, cerdos, ovejas, cabras y gallinas y pequeños animales tales como perros, gatos, ratas y ratones, el agente de control de plagas de la presente invención se puede aplicar a los animales mediante un método conocido en el campo de la veterinaria. Específicamente, cuando se pretende un control sistémico, el agente de control de plagas de la presente invención se administra a los animales como un comprimido, una mezcla con alimento o un supositorio o por inyección (incluyendo inyecciones intramusculares, subcutáneas, intravenosas e intraperitoneales). Por otro lado, cuando se pretende un control no sistémico, el agente de control de plagas de la presente invención se aplica a los animales por medio de pulverización de la solución oleosa o solución acuosa, tratamiento de vertido o de

aplicación tópica o lavado del animal con una formulación en champú o poniéndole un collar o etiqueta de oreja de las formulaciones de resina al animal. En caso de administrar al cuerpo de un animal, la dosis del presente compuesto está habitualmente dentro de un intervalo de 0,1 a 1.000 mg por 1 kg de peso corporal del animal.

- 5 El agente para controlar plagas de la presente invención se puede usar en tierras agrícolas donde se cultivan las plantas mencionadas más abajo (en lo sucesivo mencionadas como "presentes plantas").

Cultivos:

- 10 maíz, arroz, trigo, cebada, centeno, triticale, avena, sorgo, algodón, soja, cacahuete, arachis, judía común (frijol), habas, judía adzuki, caupi, judía mung, judía urd, judía escaleta, judía de arroz, judía de polilla, judía tepari, haba, guisante, garbanzo, lentejas, altramuces, guandul, trigo sarraceno, remolacha, colza, girasol, caña de azúcar, tabaco, lúpulo, y similares;

Verduras:

- 15 verduras solanáceas (por ejemplo, berenjena, tomate, pimiento, pimienta, pimiento morrón y patata),  
verduras cucurbitáceas (por ejemplo, pepino, calabaza, calabacín, sandía y melón),  
verduras crucíferas (por ejemplo, rábano japonés, rábano blanco, rábano picante, colinabo, repollo chino, repollo, mostaza de hoja, brócoli y coliflor),  
verduras asteráceas (por ejemplo, bardana, crisantemo, alcachofa y lechuga),  
20 verduras liliáceas (por ejemplo, cebolla verde, cebolla, ajo y espárrago),  
verduras apiáceas (por ejemplo, zanahoria, perejil, apio y nabo),  
verduras quenopodiáceas (por ejemplo, espinaca y cardo suizo),  
verduras lamiáceas (por ejemplo, *Perilla frutescens*, menta, albahaca y lavanda),  
fresas, batata, *Dioscorea japonica*, colocasia y similares;

25

Frutas:

- frutas pomáceas (por ejemplo, manzana, pera, pera japonesa, membrillo chino y membrillo),  
frutos de hueso (por ejemplo, melocotón, ciruela, nectarina, *Prunus mume*, cereza, albaricoque y ciruela pasa),  
30 frutas cítricas (por ejemplo, *Citrus unshiu*, naranja, limón, lima y pomelo),  
frutos secos (por ejemplo, castañas, nueces, avellanas, almendras, pistachos, anacardos nueces de macadamia),  
bayas (por ejemplo, arándano, arándanos rojo, mora y frambuesas),  
uva, caqui persimón, oliva, ciruela japonesa, plátano, café, palmera datilera, coco, palma de aceite, y otros;

- 35 Árboles distintos de árboles frutales:

árbol del té, morera,

planta de flor (por ejemplo, azalea enana, camelia, hidrangea, sasanqua, *Illicium anisatum*, cerezos, tulipanes, mirto crepe y oliva de olor),

- 40 árboles que crecen al lado de los caminos (por ejemplo, fresno, abedul, cerezo silvestre, Eucaliptus, Ginkgo biloba, lila, arce, Quercus, álamo, árbol de Judas, *Liquidambar formosana*, plátano, zelkova, tuya del Japón, abeto, cicuta, enebro, pino, picea, *Taxus cuspidate*, olmo y castaño de Indias japonés), dulce viburnum, *Podocarpus macrophyllus*, cedro japonés, ciprés japonés, crotón, husillo japonés y *Photinia glabra*; y similares

- 45 Césped:

césped (por ejemplo, *Zoysia japonica*, *Zoysia matrella*), grama (por ejemplo, *Cynodon dactylon*), *Agrostis* (por ejemplo, *Agrostis gigantea*, *Agrostis stolonifera*, *Agrostis capillaris*), Poa (por ejemplo, *Poa pratensis*, *Poa trivialis*),  
50 festucos (por ejemplo, *Festuca arundinacea* Schreb., *Festuca rubra* L. var. *commutata* Gaud., *Festuca rubra* L. var. genuina Hack),  
loliium (por ejemplo, *Lolium multiflorum* Lam, *Lolium perenne* L),  
*Dactylis glomerata*, *Phleum pratense*;  
y otros;

- 55 cultivos forrajeros: alfalfa y otros.

Otros:

flores (por ejemplo, rosa, clavel, crisantemo, *Eustoma*, *gypsophila*, gerbera, caléndula, salvia, petunia, verbena, tulipán, áster, genciana, lirio, pensamiento, ciclamen, orquídea, lirio del valle, lavanda, alhelí, col ornamental, primula, poinsettia, gladiolo, cattleya, margarita, cymbidium y begonia),

- 60 plantas para biocombustible (por ejemplo, jatrofa, curcas, cártamo, Camelina, pasto varilla, *Miscanthus giganteus*, *Phalaris arundinacea*, *Arundo donax*, kenaf (*Hibiscus cannabinus*), yuca (*Manihot esculenta*), sauce (*Salicaceae*), algas, etc.

plantas de follaje ornamentales, y otros.

- 65 La presente planta incluye una planta cultivada por tecnología de híbridos.

Además, la presente planta incluye también plantas genéticamente modificadas que se preparan por medio de una tecnología de ingeniería genética.

5 La presente planta también incluye una planta a la que se ha conferido tolerancia a herbicidas por una tecnología de ingeniería genética o un método clásico de cultivo.

La presente planta también incluye una planta a la que se ha conferido una capacidad de producir toxinas selectivas a organismos perjudiciales mediante tecnología de ingeniería genética.

10 La presente planta también incluye plantas a las que se ha conferido una capacidad de producir sustancias antipatogénicas por tecnología de ingeniería genética.

La presente planta también incluye plantas a las que se han conferido caracteres ventajosos tales como caracteres mejorados en ingredientes oleosos o caracteres que tienen un contenido reforzado de aminoácidos.

15 Los ejemplos típicos de un método de aplicación del agente para controlar plagas de la presente invención a la presente planta que se ha de proteger para que no sea devorada por organismos pejudiciales incluyen una aplicación a tallos y hojas, órgano de la flor o espiga de las plantas; una aplicación a las semillas de plantas u órganos de propagación vegetativa (tales como patatas de semilla, bulbos, tubérculos, bulbos escamosos, artemijos); y una aplicación a un vivero (incluyendo un corte) y similares.

20 Los ejemplos típicos de un método de aplicación del agente para controlar plagas de la presente invención a los tallos y hojas, órgano florales o espiga de plantas incluyen un método de aplicación sobre la superficie de las plantas, tales como aplicación al follaje y aplicación al tronco del árbol y también una aplicación al órgano floral o las plantas enteras en los momentos de la floración que incluye antes de la floración, durante la floración y después de la floración y, en el caso de cultivos como planta, incluye un método de aplicación a espigas o plantas enteras en los momentos de la germinación.

25 Los ejemplos típicos de un método de aplicación del agente para controlar plagas de la presente invención a semillas de plantas u órganos de propagación vegetativos incluyen un método de cobertura, untado o empapado de semillas u órganos de propagación vegetativos, un método de untado de semillas u órganos de propagación vegetativos en formulación líquida y un método de recubrimiento de semillas u órganos de propagación vegetativos (tales como un tratamiento de recubrimiento de película, un tratamiento de recubrimiento de gránulo).

30 En el método, la dosis del presente compuesto se puede aplicar habitualmente dentro de un intervalo de 0, 2 a 5.000 g y preferentemente dentro de un intervalo de 0,5 a 1.000 g por 100 kg de semillas u órganos de propagación vegetativos de las plantas. La forma de dosis preferida incluye formulaciones en suspensión líquida acuosa tales como concentrados emulsionantes, polvos humectables, compuestos fluidos y microcápsulas. En particular, la planta a ser aplicada por el método incluye, entre las presentes plantas, soja, maíz, algodón, trigo, cebada, centeno, triticale, avena, arroz, sorgo, arachis, legumbres distintas de la soja y el arachis, nabo, colza, girasol, patata, caña de azúcar y verduras.

35 Cuando se aplica a la caña de azúcar, el presente agente se puede aplicar a artemijos de la caña de azúcar en un cultivo de caña de azúcar.

40 El presente compuesto se puede mezclar o combinar con pesticidas, mitocidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del crecimiento de plantas y sinergistas conocidos. Además, el agente para controlar plagas de la presente invención se puede usar en combinación con herbicidas conocidos. Cada uno de los ingredientes activos como los pesticidas, mitocidas, nematocidas, fungicidas, herbicidas o sinergistas incluyen los siguientes:

50 Ingrediente activo como pesticidas

(1) Compuestos de organofósforo

55 acefato, fosfuro de aluminio, butatofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorpirifos, clorpirifosmetilo, cianofos (abrev. CYAP), diazinona, diclofentiona (abrev. ECP), diclorvos (abrev. DDVP), dimetoato, dimetilvinfos, disulfotona, EPN, etiona, etoprofos, etrimfos, fentiona (abrev. MPP), fenitrotiona (abrev. MEP), fostiazato, formotiona, fosfuro de hidrógeno, isofenfos, isoxationa, malationa, mesulfenfos, metidationa (abrev. DMTP), monocrotofos, naled (abrev. BRP), oxideprofos (abrev. ESP), parationa, fosalona, fosmet (abrev. PMP), pirimifos-metilo, piridafentiona, quinalfos, fentoato (abrev. PAP), profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salitiona, sulprofos, tebupirinfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometona, triclorfona (abrev. DEP), vamidotona, forato y cadusafos.

(2) Compuestos de carbamato

65 alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb (abrev. MIPC), metolcarb, metomilo, metiocarb, NAC, oxamilo,

pirimicarb, propoxur (abrev. PHC), XMC, tiodicarb, xililcarb y taldicarb.

(3) Compuestos piretroides

5 acrintrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, tetrametrina, fenotrina, cifenotrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, Lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, furametrina, tau-fluvalinato, metoflutrina, proflutrina, dimeflutrina, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-  
10 dimetil-3-prop-1-enilciclopropancarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, (EZ)-(1RS,3RS/1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-lenilciclopropancarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbencilo, (1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)-ciclopropancarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, y (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-(2-ciano-1-propenil)-ciclopropancarboxilato de 2,3,5,6- tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo.

15 (4) Compuestos de toxina de Nereis

cartap, bensultap, tiociclam, monosultap y bisultap.

(5) Compuestos neonicotinoides

20 imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, dinotefurano y clotianidina.

(6) Compuestos de benzoilurea

25 clorfluazurona, bistriflurona, diafentiurona, diflubenzurona, fluazurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona, triflumurona y triazurona.

(7) Compuestos de fenilpirazol,

30 acetoprol, etiprol, fipronilo, vaniliprol, piriprol y piraf luprol.

(8) Toxinas Bt

35 esporas vivas y toxinas cristalinas derivadas de *Bacillus thuringiensis* y una mezcla de ellas.

(9) Compuestos de hidracina,

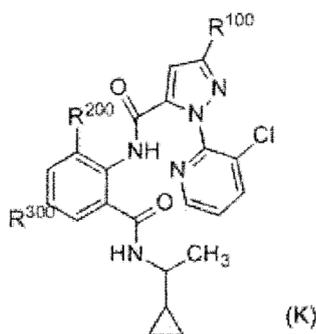
cromafeno zida, halofeno zida, metoxifeno zida y tebufeno zida.

40 (10) Compuestos de organocloro

aldrina, dieldrina, dienoclor, endosulfano, metoxiclor.

(11) Otros ingredientes activos pesticidas

45 aceite de máquina, sulfato de nicotina, avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciantraniliprol, ciromazina, D-D (1,3-Dicloropropeno), benzoato de emarmectina, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, metopreno, indoxacarb, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetrozina, piridalilo, piriproxifeno, espinosad, sulfuramida, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, lepimectina, ácido arsénico, benclotiaz, cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamida, flurinfeno, formetanato, metam-amonio, metam-sodio, bromuro de metilo, oleato de potasio, protrifenbute, espiromesifeno, sulfoxaflor, azufre, metaflumizona, espirotetramato, pirifluquinazona, espinetoram, clorantraniliprol, tralopirilo y ciantraniliprol.  
50 un compuesto representado por la siguiente fórmula (K):

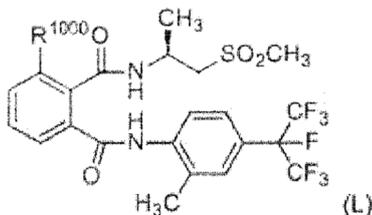


55

[en la que,

- 5 R<sup>100</sup> representa un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;  
 R<sup>200</sup> representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metilo; y  
 R<sup>300</sup> representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo ciano] y

un compuesto representado por la siguiente fórmula (L):



10

[en la que

R<sup>1000</sup> representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo].

15 Ingrediente activo como miticidas

acequinocilo, amitraz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, clorobencilato, CPCBS (clorfensona), clofentezina, ciflumetofeno, queltano (también denominado dicofol), etoxazol, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacripirim, fluproxifeno, hexitiazox, propargita (abrev. BPPS), polinactinas, piridabeno, pirimidifeno, tebufenpirad, tetradifona, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato, amidoflumet, cienopirafeno y otros.

20

Ingrediente activo como nematocidas

25 DCIP, fostiazato, levamisol, metiisotiocianato, tartarato de morantel, imiciafos y otros.

Ingrediente activo como fungicidas:

30 compuestos fungicidas de azol tales como propiconazol, protioconazol, triadimenol, procloraz, penconazol, tebuconazol, flusilazol, diniconazol, bromuconazol, epoxiconazol, difenoconazol, ciproconazol, metconazol, triflumizol, tetraconazol, miclobutanilo, fenbuconazol, hexaconazol, fluquinconazol, triticonazol, bitertanol, imazalilo, flutriafol y otros;

30

compuestos fungicidas de amina cíclica tales como fenpropimorf, tridemorf, fenpropimorf y otros;

35

compuestos fungicidas de bencimidazol tales como carbendazim, benomilo, tiabendazol, tiofanato-metilo y otros;

procimidona; ciprodinilo; pirimetanilo; dietofencarb; tiuram; fluazinam; mancozeb; ipridona; vinclozolina; clorotalonilo; captano; mepanipirim; fencpiclonilo; fludioxonilo; diclofluanida; folpet; cresoxim-metilo; azoxistrobina; trifloxistrobina; fluoxastrobina; picoxistrobina; piraclostrobina; dimoxistrobina; piribencarb; espiroxamina; quinoxifeno; fenhexamida; famoxadona; fenamidona; zoxamida; etaboxam; amisulbrom; iprovalicarb; bentiavalicarb; ciazofamida; mandipropamida; boscalida; pentiopirad; metrafenona; fluopirano; bixafeno; ciflufenamida; proquinazida; isotianilo; tiadinilo y otros.

40

Ingrediente activo como herbicidas

45 (1) compuestos herbicidas de ácido fenoigraso  
 2,4-D, MCP, MCPB, fenotiol, mecoprop, fluroxipir, triclopir, clomeprop, naproanilida y otros;

(2) compuestos herbicidas de ácido benzoico

2,3,6-TBA, dicamba, clopiralida, picloram, aminopiralida, quinclorac, quinmerac y otros;

(3) compuestos herbicidas de urea

50

diurona, linurona, clortolurona, isoproturona, fluometurona, isourona, tebutiurona, metabenziazurona, cumilurona, diamurona, metil-daimurona y otros;

(4) compuestos herbicidas de triazina

atrazina, ameturina, cianazina, simazina, propazina, simetrina, dimetametrina, prometrina, metribuzina, triaziflam, indaziflam y otros;

55

(5) compuestos herbicidas de biperidinio

paraquat, diguat y otros;

(6) compuestos herbicidas de hidroxibenzonitrilo

bromoxinilo, ioxinilo y otros;

(7) compuestos herbicidas de dinitroanilina

pendimetalina, prodiamina, trifluralina y otros;

- (8) compuestos herbicidas de organofósforo  
amiprofos-metilo, butamifos, bensulida, piperofos, anilofos, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, bialafos y otros;
- (9) compuestos herbicidas de carbamato  
di-alato, tri-alato, EPTC, butilato, bentiocarb, esprocarb, molinato, dimepiperato, swep, clorprofam, fenmedifam,  
5 fenisofam, piributicarb, asulam y otros;
- (10) compuestos herbicidas de amida ácida  
propanilo, propizamida, bromobutide, etobenzanida y otros;
- (11) compuestos herbicidas de cloroacetanilida  
10 acetoclor, alaclor, butaclor, dimetenamida, propaclor, metazaclor, metolaclor, pretilaclor, tenilclor, petoxamida y otros;
- (12) compuestos herbicidas de éter difenílico  
acifluorfen-sodio, bifenox, oxifluorfen, lactofeno, fomesafeno, clometoxinilo, aclonifeno y otros,
- (13) compuestos herbicidas de imida cíclica  
oxadiazona, cinidona-etilo, carfentrazona-etilo, surfentrazona, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, piraflofen-etilo,  
15 oxadiargilo, pentoxazona, flutiacet-metilo, butafenacilo, benzfendizona, bencarbazona y otros;
- (14) compuestos herbicidas de pirazol  
benzofenap, pirazolato, pirazoxifeno, topramezona, pirasulfotol y otros;
- (15) compuestos herbicidas de tricetona  
isoxaflutol, benzobiciclona, sulcotriona, mesotriona, tembotriona, tefuriltriona y otros;
- (16) compuestos herbicidas de ariloxifenoxipropionato  
20 clodinafop-propargilo, cihalofop-butilo, diclofop-metilo, fenoxaprop-etilo, fluazifop-butilo, haloxifop-metilo, quizalofop-etilo, metamifop y otros;
- (17) compuestos herbicidas de triona oxima  
aloxidim-sodio, setoxidim, butroxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxidim, tepraloxidim, tralkoxidim, profoxidim y  
25 otros;
- (18) compuestos herbicidas de sulfonilurea  
clorsulfurona, sulfometurona-metilo, metsulfuronametilo, clorimurona-etilo, tribenurona-metilo, triasulfurona,  
bensulfurona-metilo, tifensulfuronametilo, pirazosulfurona-etilo, primisulfurona-metilo, nicosulfurona,  
30 amidosulfurona, cinosulfurona, imazosulfurona, rimsulfurona, halosulfurona-metilo, prosulfurona, etametsulfurona-metilo, triflusulfuronametilo, flazasulfurona, ciclosulfamurona, flupirsulfurona, sulfosulfurona, azimsulfurona, etoxisulfurona, oxasulfurona, yodosulfurona-metil-sodio, foramsulfurona, mesosulfurona-metilo, trifloxisulfurona, tritosulfurona, ortosulfamurona, flucetosulfurona, propirisulfurona y otros;
- (19) compuestos herbicidas de imidazolinona  
imazametabenz-metilo, imazametapir, imazamox, imazapir, imazaquin, imazetapir y otros;
- (20) compuestos herbicidas de sulfonamida  
35 flumetsulam, metosulam, diclosulam, florasulam, cloransulam-metilo, penoxsulam, piroxsulam y otros;
- (21) compuestos herbicidas de pirimidiniloxibenzoato,  
piritiobac-sodio, bispiribac-sodio, piriminobac-metilo, piribenzoxim, piriftalida, pirimisulfano y otros;
- (22) otros tipos de compuestos herbicidas  
40 bentazona, bromadlo, terbacilo, clortiamida, isoxabeno, dinoseb, amitrol, cinmetilina, tridifano, dalapona, diflufenzopir-sodio, ditiopir, tiazopir, flucarbazona-sodio, propoxicarbazona-sodio, mefenacet, flufenacet, fentrazamida, cafenstrol, indanofano, oxaziclomefona, benfuresato, ACN, piridato, cloridazona, norflurazona, flurtamona, diflufenicano, picolinafeno, beflubutamida, clomazona, amicarbazona, pinoxadeno, piraclonilo, piroxasulfona, tiencarbazona-metilo, aminociclopiraclor, ipfencarbazona, metiozolina y otros;
- 45 y otros.

Ingrediente activo como los sinergistas

- 50 butóxido de piperonilo, sesamex, sulfóxido, N-(2-etilhexil)-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-dicarboximida (MGK 264), N-declimidazol, antirresistente a WARF, TBPT, TPP, IBP, PSCP, yoduro de metilo (CH<sub>3</sub>I), t-fenilbutenona, maleato de dietilo, DMC, FDMC, ETP, ETN y otros.

## Ejemplos

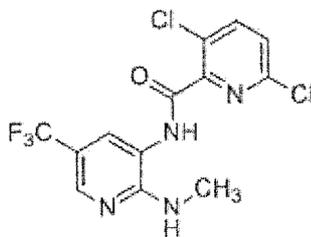
Los siguientes ejemplos que incluyen Ejemplos de preparación, Ejemplos de formulación y Ejemplos de prueba sirven para ilustrar la presente invención con mayor detalle, y no pretenden limitar la presente invención.

En primer lugar, con respecto a una preparación del presente compuesto, se presentan los Ejemplos de preparación.

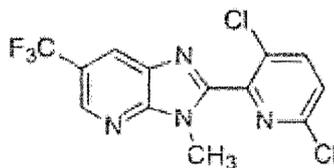
## Ejemplo de preparación 1

(1) A una mezcla de ácido 3,6-dicloropiridin-2-carboxílico 50 g, N,N- dimetilformamida 1 ml y tolueno 130 ml se añade cloruro de tionilo 49 ml a temperatura ambiente. Las mezclas se calentaron a reflujo durante 5 horas con agitación y a continuación la mezcla de reacción se dejó enfriar hasta a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar un compuesto intermedio 1.

(2) A una mezcla de N2-metil-5-(trifluorometil)piridin-2,3-diamina (que se prepara mediante un método descrito en el documento WO 2010/125985) 50 g y tetrahidrofurano 90 ml se añadió gota a gota una mezcla de una cantidad total del compuesto intermedio 1 obtenido con anterioridad y tetrahidrofurano 90 ml a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 5 horas y a continuación a la mezcla de reacción se añadió hexano 200 ml. Los sólidos precipitados se filtraron y se añadieron a una solución saturada de carbonato de sodio y se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y a continuación se concentraron a presión reducida para dar el siguiente compuesto intermedio 2 105 g.

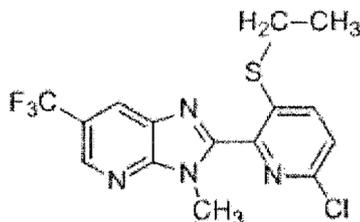


RMN de <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>) δ: 9,17 (1H, s), 8,38 (1H, d), 7,88 (1H, d), 7,82 (1H, d), 7,50 (1H, d), 5,06 (1H, d), 3,08 (3H, d).  
 (3) Una mezcla del compuesto intermedio 2 105 g y ácido acético 350 ml se calentó a reflujo durante 4 horas con agitación. Las mezclas se dejaron enfriar hasta temperatura ambiente y a continuación se añadió agua. Los sólidos precipitados se filtraron y se concentraron a presión reducida para dar el siguiente compuesto intermedio 3 84 g.



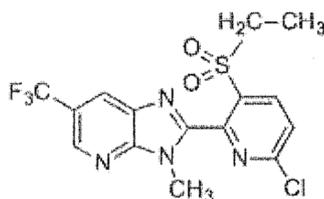
RMN de <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,77 (1H, s), 8,40 (1H, d), 7,92 (1H, d), 7,49 (1H, d), 4,02 (3H, s).

(4) A una mezcla del compuesto intermedio 3 54 g, hidruro de sodio al 60 % (dispersión en parafina líquida) 6,9 g y tetrahidrofurano 800 ml se añadió gota a gota etilmercaptano 12 ml a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a 0 °C durante 3 horas y a la misma se añadió agua. Los sólidos precipitados se lavaron con agua y hexano y los sólidos obtenidos se concentraron a presión reducida para dar el siguiente compuesto intermedio 4 como producto crudo 51 g.

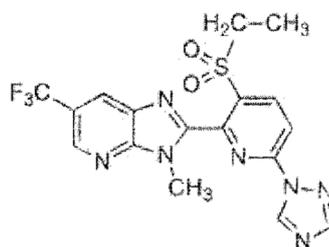


RMN de <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,74 (1H, s), 8,40 (1H, s), 7,75 (1H, d), 7,42 (1H, d), 4,11 (3H, s), 2,97 (2H, c), 1,36 (3H, t).

(5) A una mezcla del compuesto intermedio 4 como producto crudo 50 g y cloroformo 450 ml se añadió ácido m-clorometilbenzoico al 75 %, 66 g a 0 °C. Las mezclas se agitaron a 0 °C durante 5 horas y a continuación a la mezcla de reacción se añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. Las capas orgánicas se lavaron con salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida y el residuo resultante se recristalizó en cloroformo y hexano para dar el siguiente compuesto intermedio 5 50 g.

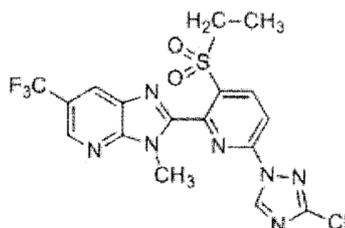


5 RMN de  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ : 8,78 (1H, d), 8,48 (1H, d), 8,32 (1H, d), 7,73 (1H, d), 3,93 (3H, s), (3,86 (2H, c), 1,36 (3H, t).  
 (6) A una mezcla del compuesto intermedio 5 400 mg y piridina 3 ml se añadió 1H-1,2,4-triazol 101 mg a temperatura ambiente. Las mezclas se calentaron hasta  $90^\circ\text{C}$  y se agitaron durante 10 horas y a continuación agua se vertió a la mezcla de reacción y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 1 160 mg.



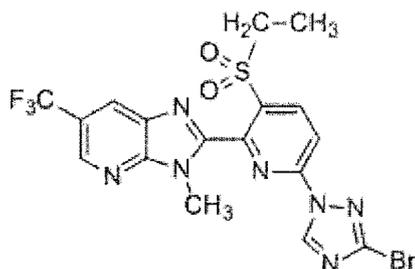
### 15 Ejemplo de preparación 2

60 A una mezcla del compuesto intermedio 5, 500 mg, hidruro de sodio al 60 % (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 60 mg y N,N-dimetilformamida 2,5 ml se añadió 3-cloro-1H-1,2,4-triazol 141 mg a  $0^\circ\text{C}$  durante 2,5 horas. A la mezcla de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 2 435 mg.



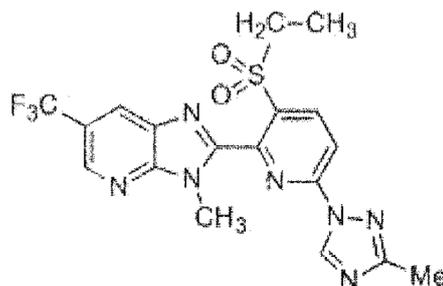
### 25 Ejemplo de preparación 3

30 A una mezcla del compuesto intermedio 5 300 mg, carbonato de potasio 133 mg y N,N-dimetilformamida 3 ml se añadió 3-bromo-1H-1,2,4-triazol 132 mg a  $0^\circ\text{C}$ . Las mezclas se agitaron a  $0^\circ\text{C}$  durante 2,5 horas y a la mezcla de reacción se añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 3, 370 mg.



### 35 Ejemplo de preparación 4

5 A una mezcla del compuesto intermedio 5 500 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 60 mg y N,N- dimetilformamida 2,5 ml se añadió 3-metil-1H-1,2,4-triazol (que se preparó mediante un método descrito en el documento US 2006/0293304 A1) 113 mg. Las mezclas se agitaron a durante 2,5 horas. A la mezcla de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el presente compuesto 4 153 mg.

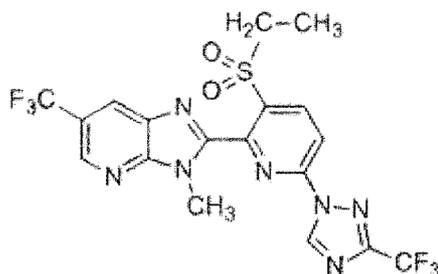


10

#### Ejemplo de preparación 5

15 A una mezcla del compuesto intermedio 5, 300 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 36 mg y N,N-dimetilformamida 1,5 ml se añadió 3-trifluorometil-1H-1,2,4-triazol (que se preparó mediante un método descrito en el documento US 2010/0063063 A1) 112 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a 0 °C durante 2,5 horas y a la mezcla de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 5 326 mg.

20

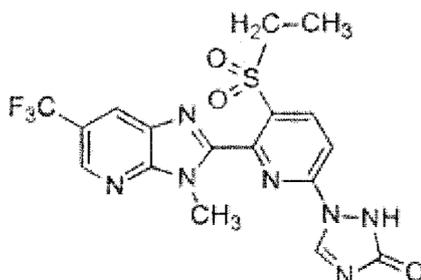


25

#### Ejemplo de preparación 6

(1) A una mezcla del compuesto intermedio 5 2,0 g, diisopropiletilamina 1,7 ml y N-metilpirrolidona 10 ml se añadió clorhidrato de semicarbazida 1,1 g a temperatura ambiente. Las mezclas se calentaron a 70 °C durante 5 horas y se dejaron enfriar hasta temperatura ambiente. A las mezclas de reacción se añadió ortoformiato de trietilo 10 ml y las mezclas se calentaron a 100 °C durante 4 horas con agitación. A las mezclas de reacción se añadieron ácido clorhídrico 2 N 10 ml y agua 30 ml. Los sólidos precipitados se filtraron y se concentraron a presión reducida para dar el siguiente compuesto intermedio 6, 2,1 g.

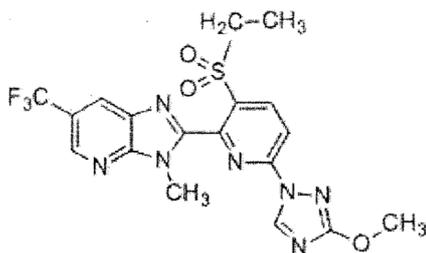
30



35

(2) A una mezcla del compuesto intermedio 6, 1,2 g, carbonato de potasio 600 mg y N-metilpirrolidona 4,3 ml se añadió yodometano 170 µl a 0 °C. Las mezclas de reacción se elevaron hasta temperatura ambiente y se agitaron durante 5 horas. A las mezclas resultantes se añadió agua y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y a continuación se concentraron a presión reducida.

Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 6 740 mg.



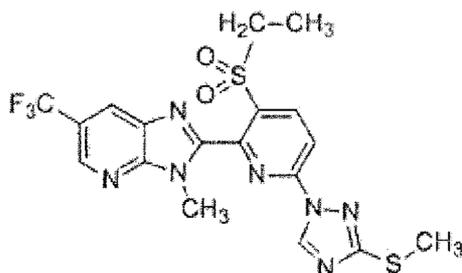
5

#### Ejemplo de preparación 7

A una mezcla del compuesto intermedio 2 500 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 54 mg y N,N-dimetilformamida 2,5 ml se añadió 3-(metil-tio)-1H-1,2,4-triazol (que se preparó mediante un método descrito en Heteroatom Chemistry, 2009, volumen 20, páginas 405-410) 185 mg a 0 °C; Las mezclas se agitaron a 0 °C durante 4,5 horas y a las mezclas de reacción se añadió una solución acuosa saturada de hidrógeno- carbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. A los sólidos resultantes se añadió cloroformo 2 ml y los sólidos se filtraron. Los sólidos se lavaron con hexano y se concentraron a presión reducida para dar el siguiente presente compuesto 7, 270 mg.

10

15

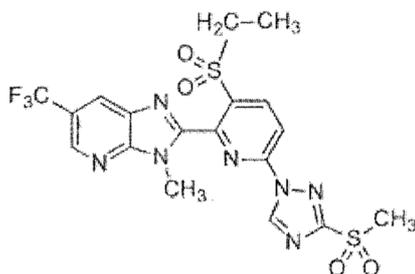


20

#### Ejemplo de preparación 8

A una mezcla del presente compuesto 7, 430 mg y cloroformo 6 ml se añadió ácido m-clorometilbenzoico al 75 %, 440 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a temperatura ambiente durante 12 horas y a continuación se lavaron con solución acuosa saturada de sulfito de sodio y solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio. Las mezclas se extrajeron con cloroformo y las capas orgánicas resultantes se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y a continuación se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 8, 250 mg.

25

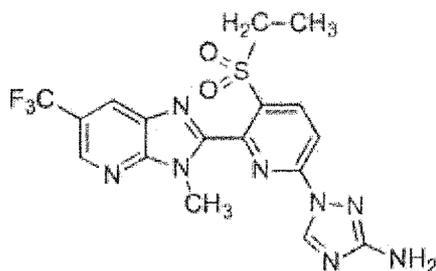


30

#### Ejemplo de preparación 9

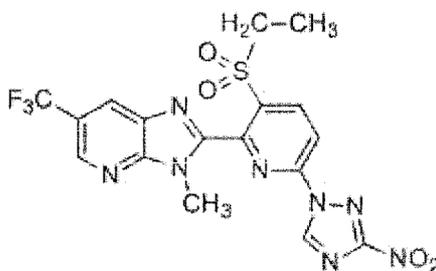
A una mezcla del compuesto intermedio 5 500 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 60 mg y N,N- dimetilformamida 2,5 ml se añadió 3-amino-1H-[1,2,4]triazol 115 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a temperatura ambiente durante 11 horas y a las mezclas de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y a continuación se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 9, 364 mg.

35



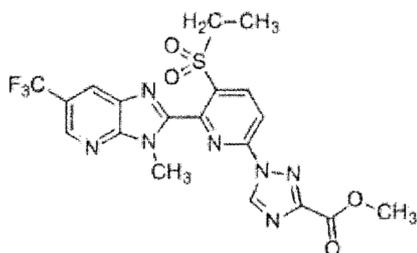
#### Ejemplo de preparación 10

- 5 A una mezcla del compuesto intermedio 5, 500 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 60 mg y N,N-dimetilformamida 2,5 ml se añadió 3-nitro-1H-1,2,4-triazol, 156 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a temperatura ambiente durante 11 horas y a las mezclas de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 10, 518 mg.



#### 15 Ejemplo de preparación 11

- A una mezcla del compuesto intermedio 5 1,1 g, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 119 mg y N-metilpirrolidona 5 ml se añadió 1H-1,2,4-triazol-3-carboxilato de metilo 613 mg. Las mezclas se agitaron a temperatura ambiente durante 12 horas y a las mezclas de reacción se añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 11, 633 mg.

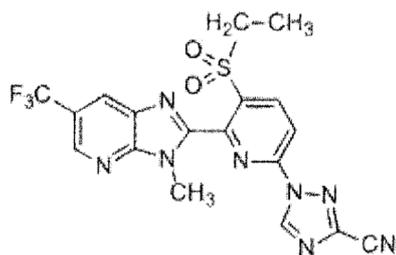


25

#### Ejemplo de preparación 12

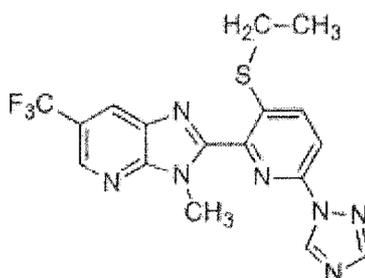
- 30 A una mezcla del compuesto intermedio 5 300 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 40 mg y N,N-dimetilformamida 5 ml se añadió 3-ciano-1H-1,2,4-triazol 94 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a temperatura ambiente durante 12 horas y a las mezclas de reacción se añadió a continuación una solución acuosa de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 12 28 mg.

35



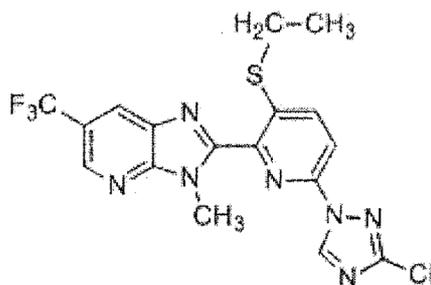
### Ejemplo de preparación 13

- 5 A una mezcla del compuesto intermedio 4 como producto crudo 370 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 48 mg y N,N-dimetilformamida 5 ml se añadió 1H-1,2,4-triazol 83 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a 100 °C durante 12 horas y a la reacción se añadió una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto
- 10 13 300 mg.

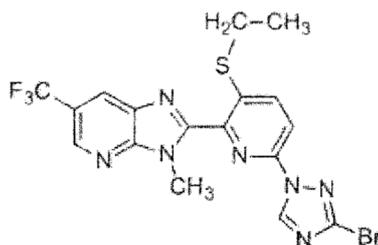


### 15 Ejemplo de preparación 14

El siguiente presente compuesto 14 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 13 usando 3-cloro-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.

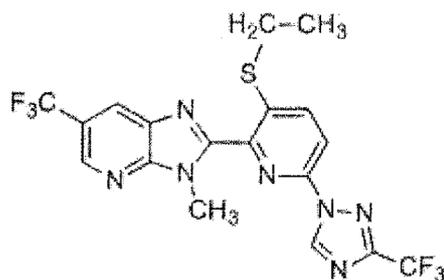


- 20
- ### Ejemplo de preparación 15
- 25 El siguiente presente compuesto 15 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 13 usando 3-bromo-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.



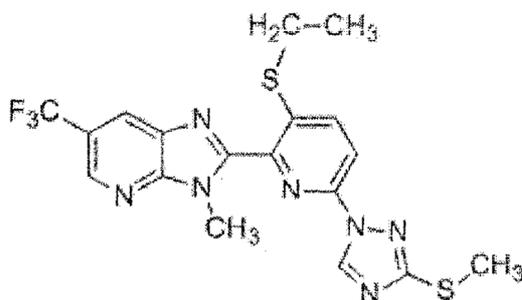
### 30 Ejemplo de preparación 16

El siguiente presente compuesto 16 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 13 usando 3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.



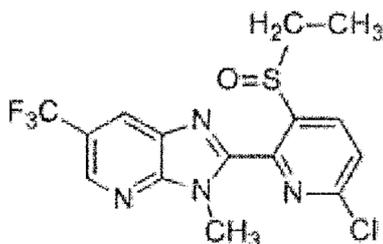
5 **Ejemplo de preparación 17**

El siguiente presente compuesto 17 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 13 usando 3-(metiltio)-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4- triazol.



10 **Ejemplo de preparación 18(1)**

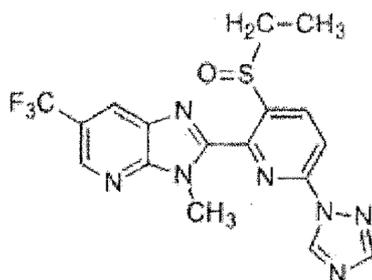
15 A una mezcla del compuesto intermedio 4 como producto crudo 3,0 g y cloroformo 25 ml se añadió ácido m-clorometilbenzoico al 75 %, 1,9 g a 0 °C. Las mezclas se agitaron a 0 °C durante 5 horas y a las mezclas de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con cloroformo. Las capas orgánicas se lavaron con salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida y los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente compuesto intermedio 7, 2,6 g.



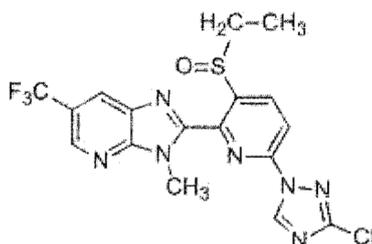
20 RMN de <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,79 (1H, d), 8,62 (1H, d), 8,36 (1H, d), 7,69 (1H, d), 4,38 (3H, s), 3,70-3,60 (1H, m), 3,16-3,06 (1H, m), 1,47 (3H, t).

25 **Ejemplo de preparación 18(2)**

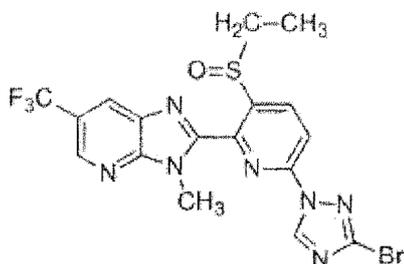
30 A una mezcla del compuesto intermedio 7, 200 mg, hidruro de sodio (dispersión en parafina líquida) al 60 %, 25 mg y N,N-dimetilformamida 4 ml se añadió 1H-1,2,4-triazol 43 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a temperatura ambiente durante 12 horas y a las mezclas de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 18 75 mg.

**Ejemplo de preparación 19**

- 5 El siguiente presente compuesto 19 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 18(2) usando 3-cloro-1H-1,2,4-triazol en vez 1H-1,2,4-triazol.

**10 Ejemplo de preparación 20**

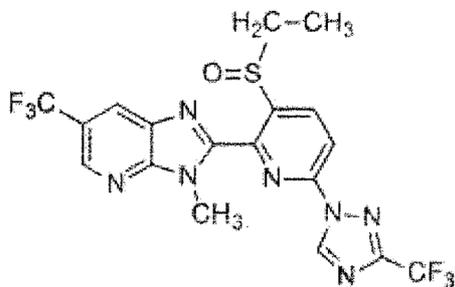
- El siguiente presente compuesto 20 de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 18(2) usando 3-bromo-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.



15

**Ejemplo de preparación 21**

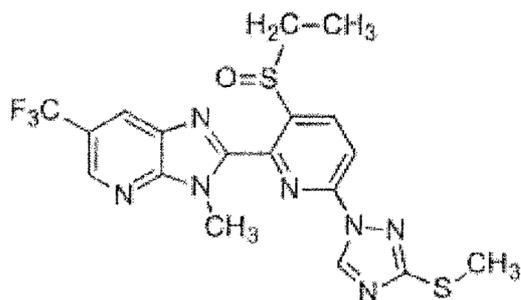
- 20 El siguiente presente compuesto 21 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 18(2) usando 3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.



25

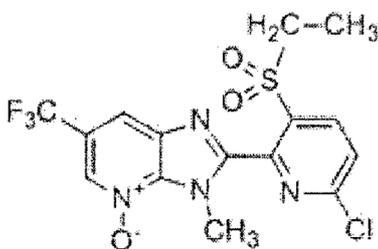
**Ejemplo de preparación 22**

- El siguiente presente compuesto 22 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 18(2) usando 3-(metiltio)-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.



#### Ejemplo de preparación 23(1)

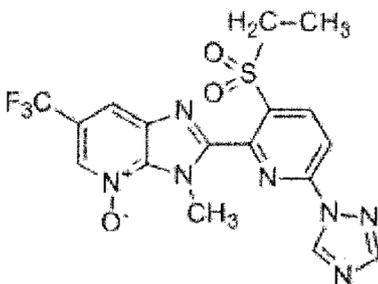
- 5 A una mezcla del compuesto intermedio 5 2,0 g y cloroformo 10 ml se añadió ácido m-clorometilbenzoico al 75 %, 3,4 g a 0 °C. Las mezclas de reacción se agitaron a 50 °C durante 10 horas. Las mezclas se dejaron enfriar hasta a temperatura ambiente y a las mezclas de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida y los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente compuesto intermedio 8, 1,1 g.



- 15 RMN de <sup>1</sup>H (CDCl<sub>3</sub>) δ: 8,48 (1H, s), 8,46 (1H, d), 7,92 (1H, s), 7,76 (1H, d), 4,33 (3H, s), 3,70 (2H, c), 1,36 (3H, t).

#### Ejemplo de preparación 23(2)

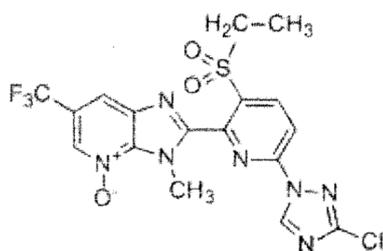
- 20 A una mezcla del compuesto intermedio 8, 100 mg, carbonato de potasio 50 mg y N,N-dimetilformamida 2,0 ml se añadió 1H-1,2,4- triazol 25 mg a 0 °C. Las mezclas se agitaron a temperatura ambiente durante 12 horas y a las mezclas de reacción se añadió a continuación una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato de sodio y las mezclas se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y salmuera y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Las capas orgánicas resultantes se concentraron a presión reducida. Los residuos resultantes se sometieron a una cromatografía en columna de gel de sílice para dar el siguiente presente compuesto 23, 80 mg.



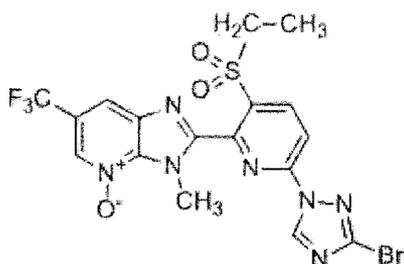
25

#### Ejemplo de preparación 24

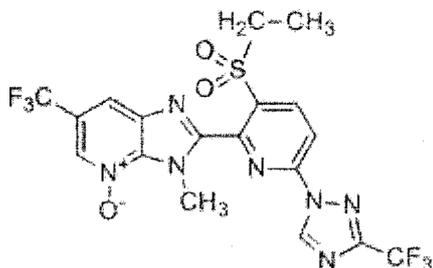
- 30 El siguiente presente compuesto 24 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 23(2) usando 3-cloro-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.

**Ejemplo de preparación 25**

- 5 El siguiente presente compuesto 25 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 23(2) usando 3-bromo-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.

10 **Ejemplo de preparación 26**

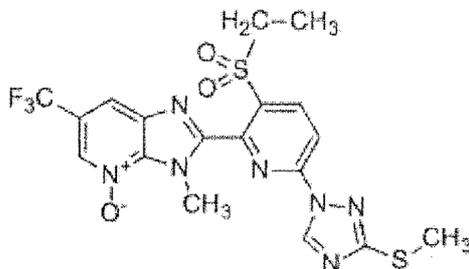
- El siguiente presente compuesto 26 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 23(2) usando 3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.



15

**Ejemplo de preparación 27**

- 20 El siguiente presente compuesto 27 se preparó de acuerdo con el método descrito en el Ejemplo de preparación 23(2) usando 3-(metiltio)-1H-1,2,4-triazol en vez de 1H-1,2,4-triazol.



25 Los valores físicos de los presentes compuestos descritos en los Ejemplos de preparación antes mencionados se muestran en la Tabla 5.

Tabla 5

Compuesto presente	Propiedad física
1	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,16 (1H, s), 8,81 (1H, s a), 8,72 (1H, d), 8,36 (1H, s a), 8,31 (1H, d), 8,21 (1H, s), 3,93 (3H, s), 3,82 (2H, c), 1,39 (3H, t).
2	RMN de <sup>1</sup> H (DMSO-D <sub>6</sub> ) δ: 9,67 (1H, s), 8,95 (1H, s a), 8,77 (1H, d), 8,75 (1H, s a), 8,29

	(1H, d), 3,96-3,89 (5H, m), 1,26 (3H, t).
3	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,04 (1H, s), 8,81 (1H, s a), 8,73 (1H, d), 8,35 (1H, s a), 8,26 (1H, d), 3,92 (3H, s), 3,81 (2H, c), 1,39 (3H, t).
4	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,03 (1H, s), 8,80 (1H, s a), 8,68 (1H, d), 8,35 (1H, s a), 8,22 (1H, d), 3,92 (3H, s), 3,81 (2H, c), 2,54 (3H, s), 1,39 (3H, t).
5	RMN de <sup>1</sup> H (DMSO-D <sub>6</sub> ) δ: 9,90 (1H, s), 8,95 (1H, s a), 8,81 (1H, d), 8,76 (1H, s a), 8,41 (1H, d), 3,99-3,91 (5H, m), 1,26 (3H, t).
6	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8,88 (1H, s), 8,80 (1H, s a), 8,66 (1H, d), 8,35 (1H, s a), 8,14 (1H, d), 4,13 (3H, s), 3,91 (3H, s), 3,80 (2H, c), 1,38 (3H, t).
7	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,06 (1H, s), 8,80 (1H, s a), 8,68 (1H, d), 8,35 (1H, s a), 8,21 (1H, d), 3,91 (3H, s), 3,80 (2H, c), 2,71 (3H, s), 1,39 (3H, t).
8	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,27 (1H, s), 8,82 (1H, s a), 8,80 (1H, d), 8,41 (1H, d), 8,37 (1H, s a), 3,93 (3H, s), 3,82 (2H, c), 3,39 (3H, s), 1,40 (3H, t).
9	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8,80 (1H, s a), 8,63 (1H, d), 8,35 (1H, s a), 8,29 (1H, d), 7,66 (1H, s), 6,45 (2H, s a), 3,88 (3H, s), 3,70 (2H, c), 1,37 (3H, t).
10	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,24 (1H, s), 8,85-8,82 (2H, m), 8,43 (1H, d), 8,37 (1H, s a), 3,93 (3H, s), 3,82 (2H, c), 1,40 (3H, t).
11	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,24 (1H, s), 8,82 (1H, s a), 8,77 (1H, d), 8,45 (1H, d), 8,36 (1H, s a), 4,09 (3H, s), 3,94 (3H, s), 3,82 (2H, c), 1,40 (3H, t).
12	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,24 (1H, s), 8,83-8,79 (2H, m), 8,37-8,32 (2H, m), 3,92 (3H, s), 3,82 (2H, c), 1,40 (3H, t).
13	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,09 (1H, s), 8,79-8,77 (1H, m a), 8,44-8,42 (1H, m a), 8,15 (1H, s), 8,04 (1H, d), 8,00 (1H, d), 4,11 (3H, s), 3,03 (2H, c), 1,38 (3H, t).
14	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8,98 (1H, s), 8,78 (1H, d), 8,43 (1H, d), 8,00 (1H, d), 7,96 (1H, d), 4,09 (3H, s), 3,03 (2H, c), 1,38 (3H, t).
15	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8,96 (1H, s), 8,78 (1H, d), 8,43 (1H, d), 7,99 (2H, s), 4,08 (3H, s), 3,03 (2H, c), 1,38 (3H, t).
16	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,15 (1H, d), 8,79 (1H, d), 8,44 (1H, d), 8,07 (1H, d), 8,02 (1H, d), 4,10 (3H, s), 3,04 (2H, c), 1,39 (3H, t).
17	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,00 (1H, s), 8,77 (1H, t), 8,43 (1H, t), 7,97 (2H, s), 4,08 (3H, s), 3,01 (2H, c), 2,70 (3H, s), 1,37 (3H, t).
18	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,20 (1H, s), 8,88 (1H, d), 8,82 (1H, d), 8,40 (1H, d), 8,30 (1H, d), 8,22 (1H, s), 4,41 (3H, s), 3,74-3,64 (1H, m), 3,22-3,12 (1H, m), 1,50 (3H, t).
19	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,09 (1H, s), 8,89 (1H, d), 8,82 (1H, d), 8,40 (1H, d), 8,24 (1H, d), 4,40 (3H, s), 3,75-3,64 (1H, m), 3,21-3,11 (1H, m), 1,50 (3H, t).
20	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,07 (1H, s), 8,89 (1H, d), 8,82 (1H, d), 8,40 (1H, d), 8,26 (1H, d), 4,39 (3H, s), 3,74-3,64 (1H, m), 3,21-3,11 (1H, m), 1,50 (3H, t).
21	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,25 (1H, d), 8,93 (1H, d), 8,83 (1H, d), 8,41 (1H, d), 8,34 (1H, d), 4,41 (3H, s), 3,76-3,66 (1H, m), 3,23-3,13 (1H, m), 1,50 (3H, t).
22	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,10 (1H, s), 8,84 (1H, d), 8,81 (1H, d), 8,39 (1H, d), 8,22 (1H, d), 4,39 (3H, s), 3,73-3,63 (1H, m), 3,20-3,11 (1H, m), 2,72 (3H, s), 1,49 (3H, t).
23	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,14 (1H, s), 8,70 (1H, d), 8,50 (1H, d), 8,34 (1H, d), 8,21 (1H, s), 7,96 (1H, s), 4,33 (3H, s), 3,69 (2H, c), 1,38 (3H, t).
24	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,05 (1H, s), 8,71 (1H, d), 8,50 (1H, s), 8,27 (1H, d), 7,95 (1H, s), 4,32 (3H, s), 3,68 (2H, c), 1,38 (3H, t).
25	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,02 (1H, s), 8,71 (1H, d), 8,50 (1H, s), 8,29 (1H, d), 7,95 (1H, s), 4,32 (3H, s), 3,68 (2H, c), 1,38 (3H, t).
26	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,22 (1H, s), 8,76 (1H, d), 8,51 (1H, s), 8,39 (1H, d), 7,96 (1H, s), 4,33 (3H, s), 3,69 (2H, c), 1,39 (3H, t).
27	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9,04 (1H, s), 8,65 (1H, d), 8,50 (1H, s), 8,23 (1H, d), 7,95 (1H, s), 4,31 (3H, s), 3,67 (2H, c), 2,70 (3H, s), 1,37 (3H, t).

A continuación, se presentan los ejemplos de formulación del presente compuesto. Las "partes" representan "partes en peso", a menos que se especifique otra cosa.

#### 5 Ejemplo de formulación 1

En una mezcla de 35 partes de xileno y 35 partes de N,N-dimetilformamida, se disuelven en 10 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y a continuación se añaden 14 partes de polioxietilén estiril fenil éter y 6 partes de dodecilbencensulfonato de calcio, seguido de mezcla para obtener cada formulación.

10

#### Ejemplo de formulación 2

Se mezclan 4 partes de laurilsulfato sódico, 2 partes de ligninsulfonato de calcio, 20 partes de polvo fino de sílice

hidratado sintético y 54 partes de tierra de diatomácea y se añaden otras 20 partes de cada uno de los presentes compuestos, seguido de mezcla para obtener cada uno de los polvos humectables.

**Ejemplo de formulación 3**

5 A 2 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27, se añaden 1 parte de polvo fino de sílice hidratado sintético, 2 partes de ligninsulfonato de calcio, 30 partes de bentonita y 65 partes de arcilla de caolín, seguido de mezcla, granulación con un granulador y secado con aire forzado para obtener cada formulación granular.

**Ejemplo de formulación 4**

10 En una cantidad apropiada de acetona, se disuelve 1 parte de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y a continuación se añaden 5 partes de polvo fino de óxido de silicio hidrogenado sintético, 0,3 partes de isopropilfosfato ácido y 93,7 partes de arcilla de Fubasami, seguido de mezcla con agitación minuciosa y eliminación de la acetona de 15 la mezcla por evaporación para obtener cada una de las formulaciones en polvo.

**Ejemplo de formulación 5**

20 Una mezcla de 35 partes de sal de amonio de polioxietilén alquil éter sulfato y carbón blanco (relación en peso de 1:1), 10 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y 55 partes de agua se mezclan, seguido por molienda fina con un método de molienda por vía húmeda para obtener cada formulación fluida.

**Ejemplo de formulación 6**

25 En una mezcla de 5 partes de xileno y 5 partes de tricloroetano, se disuelven 0,1 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y la mezcla resultante se mezcla a continuación con 89,9 partes de queroseno desodorizado para obtener cada solución oleosa.

**Ejemplo de formulación 7**

30 En 0,5 ml de acetona, se disuelven 10 mg de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y la solución se añade gota a gota a 5 g de un polvo alimenticio sólido para un animal (polvo alimenticio sólido para cría y reproducción CE-2, fabricado por CLEA Japan, Inc.), seguido de mezclado de la mezcla resultante de modo uniforme y a continuación por secado por evaporación de acetona para obtener cada cebo venenoso.

**Ejemplo de formulación 8**

35 En un tubo de aerosol, se colocan 0,1 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y 49,9 partes de Neotiozol (Chuo Kasei Co., Ltd.). Después de montar una válvula de aerosol, se llenan 25 partes de éter dimetilico y 40 25 partes de LPG, seguido por agitación y posterior montaje de un accionador para obtener un aerosol oleoso.

**Ejemplo de formulación 9**

45 Una mezcla de 0,6 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27, 0,01 partes de BHT (2,6-diterc-butil-4-metilfenol), 5 partes de xileno, 3,39 partes de queroseno desodorizado y 1 parte de un emulsionante (Rheodol MO-60 (marca registrada de Kao Corporation) y 50 partes de agua destilada se envasan en un recipiente de aerosol y se adjunta una parte de válvula. A continuación, se envasan 40 partes de un propelente (LPG) a través de la válvula bajo presión para obtener un aerosol acuoso.

**Ejemplo de formulación 10**

50 Se mezclan 0,1 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 en 2 ml de propilenglicol y la solución resultante se impregna en una placa cerámica porosa que tiene un tamaño de 4,0 cm x 4,0 cm y un espesor de 1,2 55 cm, para obtener fumigantes térmicos.

**Ejemplo de formulación 11**

60 Se funden 5 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y 95 partes de copolímero de etileno-metacrilato de metilo (la relación del metacrilato de metilo en el copolímero: 10 % en peso), Acrift (marca registrada) WD 301, fabricado por Sumitomo Chemical Co. Ltd.) y se amasan con un amasador a presión de tipo cerrado y el producto amasado resultante se extruye en una máquina de moldeo por extrusión a través de una matriz de moldeo para obtener un producto moldeado en forma de varilla que tiene una longitud de 15 cm y un diámetro de 3 mm.

**Ejemplo de formulación 12**

65 Se funden 5 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y 95 partes de resina de poli(cloruro de vinilo)

plastificado y se amasan con un amasador a presión de tipo cerrado y el producto amasado resultante se extruye de una máquina de moldeo por extrusión a través de una matriz de moldeo para obtener un producto moldeado en forma de varilla con una longitud de 15 cm y un diámetro de 3 mm.

5 **Ejemplo de formulación 13**

Se mezclan 100 mg de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27, 68,75 mg de lactosa, 237,5 mg de almidón de maíz, 43,75 mg de celulosa microcristalina, 18,75 mg de polivinilpirrolidona, 28,75 mg de carboximetilalmidón sódico y 25 mg de estearato de magnesio y la mezcla resultante se comprimió en un tamaño apropiado para obtener un comprimido.

10 **Ejemplo de formulación 14**

Se mezclan 25 mg de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27, 60 mg de lactosa, 25 mg de almidón de maíz, 26 mg de carmelosa de calcio y una cantidad apropiada de 5 % de hidroxipropilmetilcelulosa y la mezcla resultante se introduce en una capsula de gelatina dura o una cápsula de hidroxipropilmetilcelulosa para obtener cápsulas.

15 **Ejemplo de formulación 15**

20 A 100 mg de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27, 500 mg de ácido fumárico, 2.000 mg de azúcar granulado, 13.000 mg de sorbitol (solución al 70 %), 100 mg de Veegum K (fabricado por Vanderbilt Co.), 35 mg de perfume y 500 mg de agente colorante, se añade agua destilada de modo tal que se fija un volumen final de 100 ml, seguido de mezcla para obtener una suspensión para administración oral.

25 **Ejemplo de formulación 16**

En una mezcla de 85 % en peso de polisorbato, 3 % en peso de alcohol bencílico y 30 % en peso de propilenglicol, se disuelven 5 % en peso de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y se añade tampón de fosfato para que el pH de la solución quede entre 6,0 y 6,5 y se añade agua como las partes restantes para obtener la solución para administración oral.

30 **Ejemplo de formulación 17**

35 A una mezcla de 57 % en peso de aceite de palma destilado fraccionado y 3 % en peso de polisorbato 85, se añade 5 % en peso de diestearato de aluminio y se calienta para dispersarla. La mezcla resultante se enfría hasta temperatura ambiente y se dispersa 25 % en peso de sacarina en un vehículo oleoso. Diez (10) % en peso de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 se divide para obtener una pasta para administración oral.

40 **Ejemplo de formulación 18**

Se mezcla 5 % en peso de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 con 95 % en peso de carga de cal, seguido por una granulación húmeda de la mezcla resultante para obtener un granulo para administración oral.

45 **Ejemplo de formulación 19**

En 80 partes de dietilenglicol monometil éter, se disuelven 5 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y se añaden 15 partes de carbonato de propileno y la mezcla resultante se mezcla para obtener una solución para aplicación tópica.

50 **Ejemplo de formulación 20**

En 70 partes de dietilenglicol monometil éter, se disuelven 10 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y se añaden 20 partes de 2-octildodecanol y la mezcla resultante se mezcla para obtener una solución para verter.

55 **Ejemplo de formulación 21**

60 A 0,5 partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27, se añaden 60 partes de Nikkol (marca registrada) TEALS- 42 (fabricado por Nikko Chemical Co. Ltd.: 42 % de una solución acuosa de trietanolamina de ácido laurilsulfúrico) y 20 partes de propilenglicol y la mezcla resultante se mezcla con agitación minuciosa y 19,5 partes de agua y la mezcla resultante se mezcla a continuación con agitación minuciosa para obtener una solución hidrogenada de formulación en champú.

**Ejemplo de formulación 22**

65 Se mezclan con agitación minuciosa 0,15 % en peso de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27, 95 % en peso de alimento animal, así como 4,85 % en peso de una mezcla de fosfato de calcio dibásico, tierra de diatomeas, aerosol

y carbonato (o creta) para obtener una premezcla para alimento animal.

**Ejemplo de formulación 23**

5 Se funden 7,2 g de cada uno de los presentes compuestos 1 a 27 y 92,8 g de Hosco (marca registrada) S-55 (fabricado por Maruishi Pharmaceuticals) y se mezclan a 100 °C y la mezcla resultante se vertió en un molde de supositorios, seguido por una solidificación por enfriamiento para obtener un supositorio.

10 A continuación se presentan los Ejemplos de formulación del agente para controlar plagas que comprenden el presente compuesto. Las “partes” representan “partes en peso”, a menos que se especifique otra cosa.

**Ejemplo de formulación 1A**

15 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 1 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 2A**

20 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 2 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 3A**

25 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 3 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 4A**

30 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 4 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 5A**

35 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 5 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 6A**

40 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 6 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 7A**

45 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 7 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 8A**

50 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 8 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 9A**

55 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 9 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 10A**

60 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 10 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 11A**

65 Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 11 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 12A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 12 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

5

**Ejemplo de formulación 13A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 13 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

10

**Ejemplo de formulación 14A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 14 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

15

**Ejemplo de formulación 15A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 15 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

20

**Ejemplo de formulación 16A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 16 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

25

**Ejemplo de formulación 17A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 17 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

30

**Ejemplo de formulación 18A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 18 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

35

**Ejemplo de formulación 19A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 19 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

40

**Ejemplo de formulación 20A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 20 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

45

**Ejemplo de formulación 21A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 21 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

5

**Ejemplo de formulación 22A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 22 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

10

**Ejemplo de formulación 23A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 23 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

15

**Ejemplo de formulación 24A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 24 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

20

**Ejemplo de formulación 25A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 25 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

25

**Ejemplo de formulación 26A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 26 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

30

**Ejemplo de formulación 27A**

Se mezclan 0,1 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 10 partes del presente compuesto 27 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

35

**Ejemplo de formulación 28A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 1 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

40

**Ejemplo de formulación 29A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 2 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

45

**Ejemplo de formulación 30A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 3 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

50

**Ejemplo de formulación 31A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 4 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

55

**Ejemplo de formulación 32A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 5 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

60

**Ejemplo de formulación 33A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 6 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

65

**Ejemplo de formulación 34A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 7 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

5

**Ejemplo de formulación 35A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 8 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

10

**Ejemplo de formulación 36A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 9 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

15

**Ejemplo de formulación 37A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 10 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

20

**Ejemplo de formulación 38A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 11 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

25

**Ejemplo de formulación 39A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 12 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

30

**Ejemplo de formulación 40A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 13 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

35

**Ejemplo de formulación 41A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 14 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

40

**Ejemplo de formulación 42A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 15 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

45

**Ejemplo de formulación 43A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 16 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

50

**Ejemplo de formulación 44A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 17 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

55

**Ejemplo de formulación 45A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 18 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

60

**Ejemplo de formulación 46A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 19 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

65

**Ejemplo de formulación 47A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 20 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 48A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 21 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 49A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 22 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 50A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 23 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 51A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 24 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 52A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 25 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 53A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 26 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 54A**

Se mezclan 10 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 0,1 partes del presente compuesto 27 y 89,9 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 55A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 1 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 56A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 2 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 57A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 3 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 58A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 4 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 59A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 5 y 92 partes de dimetilsulfóxido se mezclan para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 60A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 6 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

5

**Ejemplo de formulación 61A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 7 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

10

**Ejemplo de formulación 62A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 8 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

15

**Ejemplo de formulación 63A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 9 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

20

**Ejemplo de formulación 64A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 10 y 92 partes de dimetilsulfóxido se mezclan para obtener cada solución.

25

**Ejemplo de formulación 65A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 11 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

30

**Ejemplo de formulación 66A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 12 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

35

**Ejemplo de formulación 67A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 13 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

40

**Ejemplo de formulación 68A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 14 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

45

**Ejemplo de formulación 69A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 15 y 92 partes de dimetilsulfóxido se mezclan para obtener cada solución.

50

**Ejemplo de formulación 70A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 16 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

55

**Ejemplo de formulación 71A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 17 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

60

**Ejemplo de formulación 72A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 18 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

65

**Ejemplo de formulación 73A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 19 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 74A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 20 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 75A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 21 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 76A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 22 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 77A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 23 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 78A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 24 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 79A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 25 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 80A**

Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 26 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

**Ejemplo de formulación 81A**

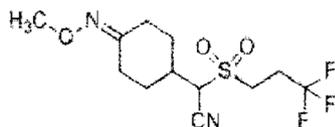
Se mezclan 4 partes de uno cualquiera de los compuestos seleccionados de los siguientes compuestos A1 a A100, 4 partes del presente compuesto 27 y 92 partes de dimetilsulfóxido para obtener cada solución.

Los compuestos A1 a A100 que se usan en los ejemplos de formulación antes mencionados se muestran a continuación.

Piretrina (compuesto A1); Aletrina (compuesto A2); Praletrina (compuesto A3); Imiprotrina (compuesto A4); Resmetrina (compuesto A5); Tetrametrina (compuesto A6); Fenotrina (compuesto A7); Cifenotrina (compuesto A8); Flumetrina (compuesto A9); Metoflutrina (compuesto A10) Transflutrina (compuesto A11); Proflutrina (compuesto A12); Dimeflutrina (compuesto A13); Empentrina (compuesto A14); Flumetrina (compuesto A15); Meperflutrina (compuesto A16); 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencil=2,2-dimetil-3-(2-ciano-1-propenil)-ciclopropancarboxilato (compuesto A17); 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencil=2,2-dimetil-3-3,3,3,1-trifluoro-1-propenil)-ciclopropancarboxilato (compuesto A18); 2,3,5,6-tetrafluoro-4-propargilbencil=2,2,3,3-tetrametilciclopropancarboxilato (compuesto A19);- Acrinatrina (compuesto A20); Bifentrina (compuesto A21); Cicloprotrina (compuesto A22); Ciflutrina (compuesto A23); beta-Ciflutrina (compuesto A24); Cihalotrina (compuesto A25); lambda-cihalotrina (compuesto A26); gamma-cihalotrina (compuesto A27); Cipermetrina (compuesto A28); alfa-Cipermetrina (compuesto A29); beta-Cipermetrina (compuesto A30); theta- Cipermetrina (compuesto A31); zeta-Cipermetrina (compuesto A32); Deltametrina (compuesto A33); Etofenprox (compuesto A34); Fenpropatrina (compuesto A35); Fenvalerato (compuesto A36); Esfenvalerato (compuesto A37); Flucitrinato (compuesto A38); Fluvalinato (compuesto A39); tau-Fluvalinato (compuesto A40); Halfenprox (compuesto A41); Permetrina (compuesto A42); Silafluofeno (compuesto A43); Teflutrina (compuesto A44); Tralormetrina (compuesto A45); Protrifenbute (compuesto A46); Fenitrotión (compuesto A47); Diclorvos (compuesto A48); Propoxur (compuesto A49); Imidacloprid (compuesto A50); Clotianidina (compuesto A51); Tiametoxam (compuesto A52); Dinotefurano (compuesto A53); Acetamiprida (compuesto A54); Tiacloprida (compuesto A55); Nitenpiram (compuesto A56); Etiprol (compuesto A57); Fipronilo (compuesto A58); Acetoprol (compuesto A59); Vaniliprol (compuesto A60); Piriprol (compuesto A61); Pirafluprol (compuesto A62);

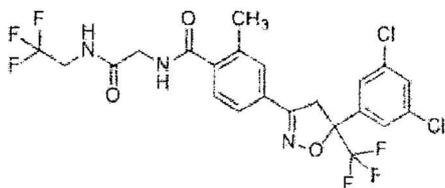
- 5 Abamectina (compuesto A63); Emamectina (compuesto A64); Benzoato de emamectina (compuesto A65); Milbemicina (compuesto A66); Doramectina (compuesto A67); Lepimectina (compuesto A68); Bistriflurona (compuesto A69); Diflubenzurona (compuesto A70); Piriproxifeno (compuesto A71); Hexaflumurona (compuesto A72); Hidroplano (compuesto A73); Metopreno (compuesto A74); Ciromazina (compuesto A75); Etoxazol (compuesto A76); Noviflumurona (compuesto A77); Amitraz (compuesto A78); Clorfenapir (compuesto A79); Metoxadiazona (compuesto A80); Amidoflumet (compuesto A81); Espirotetramato (compuesto A82); Sulfoxaflor (compuesto A83); Pimetrozina (compuesto A84); Piridalilo (compuesto A85); Flupiradifurona (compuesto A86); Indoxacarb (compuesto A87); Butóxido de piperonilo (compuesto A88); N-(2-etilhexil)-5-norbornen-2,3-dicarboximida (compuesto A89);

10



(compuesto A90) :

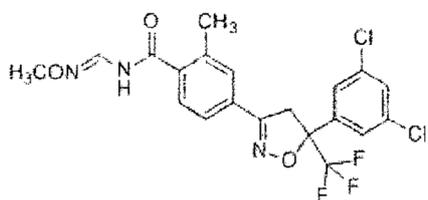
15



(compuesto A91) :

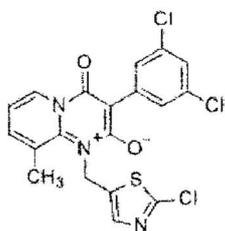


(compuesto A92) :



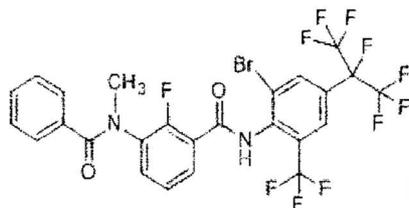
(compuesto A93) :

- 20 Clorantraniliprol (compuesto A94); Ciantraniliprol (compuesto A95); Flubendiamida (compuesto A96); triflumezopirim (compuesto A97);

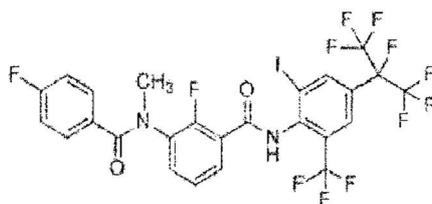


(compuesto A98) :

25



(compuesto A99) ;



(compuesto A100) .

A continuación, se usan los ejemplos de ensayo para mostrar una eficacia de los presentes compuestos sobre el control de plagas.

5

### Ejemplo de prueba 1

Cada uno de los presentes compuestos 1 a 4, 6 a 13, 18, 19 y 22 a 27 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 200 ppm para preparar la solución diluida.

10

Se plantó una plántula de pepino (en el estado de desarrollo de la primera hoja verdadera) en un recipiente de polietileno y se liberaron 30 cabezas de áfido de algodón (*Aphis gossypii*) (en todas las fases de su ciclo vital) sobre las hojas de pepino y se dejaron reposar durante 1 día. Las soluciones diluidas 20 ml se pulverizaron en la plántula.

15

Se cultivó pepino (cv; *Sagami-hanjiro-fushinari*) en un recipiente de polietileno hasta que se desarrolló la primera hoja verdadera. Se liberaron aproximadamente 30 cabezas de áfido de algodón (*Aphis gossypii*) (incluyendo los adultos y las larvas) sobre las hojas del pepino y al día siguiente, se pulverizaron las diluciones de la sustancia de prueba antes mencionadas 20 ml.

20

Después de 6 días, se examinó el número de insectos supervivientes que eran parásitos sobre las hojas de pepino y el valor de control se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Valor de control (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

25

en la que los símbolos en la fórmula representan las siguientes descripciones.

- Cb: número de insectos antes del tratamiento en el área no tratada;
- Cai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área no tratada;
- Tb: número de insectos antes del tratamiento en el área tratada;
- Tai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área tratada;

30

Aquí, el "área no tratada" representa un área que fue pulverizada con una solución diluida de la formulación descrita en el Ejemplo de formulación 5 sin el presente compuesto con agua en la misma cantidad que la del área tratada.

35

Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1 a 4, 6 a 13, 18, 19 y 22 a 27 respectivamente mostró un 90 % o más que el valor de control.

40

### Ejemplo de prueba 2

40

Cada uno de los presentes compuestos 1, 4, 6, 8, 12 y 23 a 27 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 200 ppm para preparar la solución diluida.

45

Se plantó una plántula de pepino (en el estado de desarrollo de la segunda hoja verdadera) en un recipiente de polietileno y las soluciones diluidas 5 ml se irrigaron en el pie de la planta y las plantas se mantuvieron a 25 °C en un invernadero durante 7 días. Se inocularon aproximadamente 30 cabezas de áfido de algodón (*Aphis gossypii*) (en todas las fases de su ciclo vital) sobre las hojas de pepino y las plantas se mantuvieron en un invernadero durante 6 días más y a continuación se examinó el número de insectos supervivientes que eran parásitos sobre las hojas de pepino y el valor de control se calculó mediante la siguiente ecuación.

50

$$\text{Valor de control (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

55

en la que los símbolos en la fórmula representan las siguientes descripciones.

- Cb: número de insectos antes del tratamiento en el área no tratada;
- Cai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área no tratada;
- Tb: número de insectos antes del tratamiento en el área tratada;
- Tai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área tratada;

60

Aquí, el “área no tratada” representa un área que fue pulverizada con una solución diluida de la formulación descrita en el Ejemplo de formulación 5 sin el presente compuesto con agua en la misma cantidad que la del área tratada.

5 Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1, 4, 6, 8, 12 y 23 a 27 respectivamente mostró un 90 % o más que el valor de control.

### Ejemplo de prueba 3

10 Cada uno de los presentes compuestos 1, 2, 4, 6, 8, 9 y 23 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 200 ppm para preparar la solución diluida.

15 Se plantó una plántula de arroz (en el estado de desarrollo de la segunda hoja verdadera) en un recipiente de polietileno y se pulverizaron las soluciones diluidas 10 ml. Después de secar al aire, se liberaron 20 cabezas de larvas en tercer a cuarto instar de saltamontes marrón (*Nilaparvata lugens*) sobre las hojas de arroz y las plantas se mantuvieron a 25 °C en un invernadero.

20 Después de 6 días, se examinó el número de insectos supervivientes que eran parásitos sobre las hojas del arroz y el valor de control se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Valor de control (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

en la que los símbolos en la fórmula representan las siguientes descripciones.

25 Cb: número de insectos antes del tratamiento en el área no tratada;  
Cai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área no tratada;  
Tb: número de insectos antes del tratamiento en el área tratada;  
Tai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área tratada;

30 Aquí, el “área no tratada” representa un área que fue pulverizada con una solución diluida de la formulación descrita en el Ejemplo de formulación 5 sin el presente compuesto con agua en la misma cantidad que la del área tratada.

35 Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1, 2, 4, 6, 8, 9 y 23 respectivamente mostró un 90 % o más que el valor de control.

### Ejemplo de prueba 4

40 Cada uno de los presentes compuestos 1 a 10, 12, 18, 23 a 25 y 27 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 200 ppm para preparar la solución diluida.

45 Se plantó una plántula de arroz (dos semanas después de la siembra, en el estado de desarrollo de la segunda hoja verdadera) en un recipiente de polietileno y las soluciones diluidas 5 ml se irrigaron en el pie de la planta y las plantas se mantuvieron a 25 °C en un invernadero durante 7 días. Se liberaron veinte (20) cabezas de larvas en tercer a cuarto instar de saltamontes marrón (*Nilaparvata lugens*) sobre las hojas de arroz y las plantas se mantuvieron a 25 °C en un invernadero durante 6 días más y a continuación se examinó el número de insectos supervivientes que eran parásitos sobre hojas de arroz y el valor de control se calculó mediante la siguiente ecuación.

50 
$$\text{Valor de control (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

en la que los símbolos en la fórmula representan las siguientes descripciones.

55 Cb: número de insectos antes del tratamiento en el área no tratada;  
Cai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área no tratada;  
Tb: número de insectos antes del tratamiento en el área tratada;  
Tai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área tratada;

60 Aquí, el “área no tratada” representa un área que fue pulverizada con una solución diluida de la formulación descrita en el Ejemplo de formulación 5 sin el presente compuesto con agua en la misma cantidad que la del área tratada.

Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1 a 10, 12, 18, 23 a 25 y 27, respectivamente mostró un 90 % o más que el valor de control.

**Ejemplo de prueba 5**

El presente compuesto 1 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 200 ppm para preparar la solución diluida.

Se plantó una plántula de tomate (en el estado de desarrollo de la tercera hoja verdadera) en un recipiente de polietileno y se liberaron adultos de moscas blancas del tabaco (*Bemisia tabaci*) y a continuación pusieron huevos durante 72 horas.

La plántula de tomate se mantuvo en un invernadero durante 8 días y cuando las larvas eclosionaron de los huevos proporcionados, se pulverizó la solución diluida en la relación de 20 ml/recipiente y las plantas se mantuvieron a 25 °C en un invernadero. Después de 7 días, se examinó el número de insectos supervivientes sobre las hojas de tomate y el valor de control se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Valor de control (\%)} = \{1 - (\text{Cb} \times \text{Tai}) / (\text{Cai} \times \text{Tb})\} \times 100$$

en la que los símbolos en la fórmula representan las siguientes descripciones.

- Cb: número de insectos antes del tratamiento en el área no tratada;
- Cai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área no tratada;
- Tb: número de insectos antes del tratamiento en el área tratada;
- Tai: número de insectos parásitos supervivientes en el momento de la observación en el área tratada;

Aquí, el “área no tratada” representa un área que fue pulverizada con una solución diluida de la formulación descrita en el Ejemplo de formulación 5 sin el presente compuesto con agua en la misma cantidad que la del área tratada.

Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas del presente compuesto 1 mostró un 90 % o más que el valor de control.

**Ejemplo de prueba 6**

Cada uno de los presentes compuestos 1 a 16 y 18 a 27 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 200 ppm para preparar la solución diluida.

Un repollo en el estado de tercera hoja se plantó en un recipiente de polietileno y se pulverizó la solución diluida en una relación de 20 ml/recipiente. Después de pulverizar, las plantas se secaron al aire y sus tallos y hojas se cortaron y a continuación se introdujeron en un recipiente de 50 ml y se liberaron en el recipiente cinco cabezas de polilla del repollo (*Plutella xylostella*) en los estados larvales de segundo instar y el recipiente se cubrió con la tapa. El recipiente se mantuvo a 25 °C y después de 5 días, se contó el número de insectos muertos y la mortalidad de los insectos se calculó por medio de la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{número de insectos muertos} / \text{número de insectos probados}) \times 100$$

Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1 a 11 respectivamente mostró un 80 % o más de mortalidad de los insectos.

**Ejemplo de prueba 7**

Cada uno de los presentes compuestos 1 y 11 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 200 ppm para preparar la solución diluida.

Una planta de manzano se plantó en un recipiente de polietileno y se cultivó hasta desarrollar la séptima hoja verdadera o la octava hoja verdadera. Sobre la planta de manzano se pulverizó la solución diluida en una relación de 20 ml/recipiente. Después de pulverizar, las plantas se secaron al aire y se liberaron en el recipiente 60 cabezas de tortricido de fruta de verano (*Adoxophies orana fasciata*) en el estado larval de primer instar. El recipiente se ahuecó en el fondo y se recubrió con papel de filtro y a continuación se dio la vuelta y se cubrió. Después de 7 días, se contó el número de insectos muertos y la mortalidad de los insectos se calculó por medio de la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{número de insectos muertos} / \text{número de insectos probados}) \times 100$$

Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1 y 11 respectivamente mostró un 90 % o más de mortalidad de los insectos.

**Ejemplo de prueba 8**

5 Cada uno de los presentes compuestos 1 a 3, 5, 7, 8, 11, 13 a 16, 21 y 22 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 500 ppm para preparar la solución diluida. El fondo del recipiente de polietileno con 5,5 cm de diámetro se cubrió con el mismo tamaño de un papel de filtro y se añadieron 0,7 ml de la solución diluida gota a gota al papel de filtro y se colocaron 30 mg de sacarosa como cebo en el recipiente de polietileno y el recipiente se cubrió con la tapa. Después de 24 horas, se examinó la vida y la muerte de las moscas domésticas y se contó el número de insectos muertos y la mortalidad de los insectos se calculó por medio de la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{número de insectos muertos} / \text{número de insectos probados}) \times 100$$

15 Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1 a 3, 5, 7, 8, 11, 13 a 16, 21 y 22, respectivamente, mostró un 100 % de mortalidad de los insectos.

**Ejemplo de prueba 9**

20 Cada uno de los presentes compuestos 1 a 3, 5, 7 y 13 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 500 ppm para preparar la solución diluida. El fondo del recipiente de polietileno de 5,5 cm de diámetro se cubrió con papel de filtro del mismo tamaño y se añadieron 0,7 ml de la solución diluida gota a gota al papel de filtro y se colocaron 30 mg de sacarosa como cebo en el recipiente de modo uniforme. Se liberaron 2 cabezas de cucaracha alemana adulta macho (*Blattella germanica*) en el recipiente de polietileno y el recipiente se cubrió con la tapa. Después de 6 días, se examinó la vida y la muerte de la cucaracha alemana y se contó el número de insectos muertos y la mortalidad de los insectos se calculó por medio de la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{número de insectos muertos} / \text{número de insectos probados}) \times 100$$

30 Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1 a 3, 5, 7 y 13 respectivamente mostró un 100 % de mortalidad de los insectos.

**Ejemplo de prueba 10**

35 Cada uno de los presentes compuestos 1 a 3, 5, 7, 8, 11, 14 a 17, 21 y 22 se preparó en una formulación de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5 y a continuación se diluyó con agua de modo que la concentración de ingrediente activo se fijó en 500 ppm para preparar la solución diluida. Se añadieron 0,7 ml de la solución diluida a 100 ml de agua de intercambio iónico (la concentración de ingrediente activo de 3,5 ppm). Se liberaron 20 cabezas de larvas de último instar de mosquito doméstico (*Culex pipiens pallens*) en las soluciones y después de 1 día, se examinó la vida y la muerte del mosquito doméstico y se contó el número de insectos muertos y la mortalidad de los insectos se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{número de insectos muertos} / \text{número de insectos ensayados}) \times 100$$

45 Como resultado, el área tratada que se trató con cada una de las soluciones diluidas de los presentes compuestos 1 a 3, 5, 7, 8, 11, 14 a 17, 21 y 22 respectivamente mostró el 95 % o más como la mortalidad de los insectos.

**Ejemplo de prueba 11**

50 Se pesaron 2 mg de una muestra del presente compuesto 1 en un tubo de rosca (fabricado por Maruemu, N.º 5; 27 x 55 mm) y se añadieron 0,2 ml de acetona y el tubo se cubrió con la tapa y a continuación se disolvió la muestra. El tubo de rosca se rota y se invierte y las soluciones se añadieron recubriendo toda la pared interna del tubo de modo uniforme. Se quitó la tapa del tubo y el tubo se secó al aire durante aproximadamente 2 horas y se liberaron cabezas de ácaros jóvenes sin alimentar del grupo de *Longicornis* (*Haemaphysalis longicornis*) en el tubo y a continuación se tapó con la tapa. Después de 2 días, se contó el número de insectos muertos y la mortalidad de los insectos se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{número de insectos muertos} / \text{número de insectos probados}) \times 100$$

60 Como resultado, el área tratada que se trató con la solución diluida del presente compuesto 1 mostró un 60 % o más de mortalidad de los insectos.

**Ejemplo de prueba 12**

65 En 5 ml de carbonato de propileno se disolvieron 10 mg del presente compuesto 1 obteniendo 0,1 % p/v de la solución. El día previo a la administración de la solución, se inocularon en el ratón los ácaros probados (*Longicornis*, ácaros

jóvenes). Antes de un tratamiento por goteo, se eliminaron los ácaros no parásitos.

Sobre toda la superficie del cuerpo del ratón, se instilaron 200 µl de la solución por medio de una pipeta. Por otro lado, como un grupo de control, se instilaron 200 µl solo de carbonato de propileno. La prueba se llevó a cabo tres veces por cada grupo. Después de 2 días de la instilación, se contó el número de insectos muertos y la mortalidad de los insectos se calculó por medio de la siguiente formulación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = \left( \frac{\text{Número de insectos muertos}}{\text{Número de insectos parásitos antes de la instilación}} \right) \times 100.$$

Como resultado, el área tratada que se trató con las soluciones diluidas del presente compuesto 1 mostro un 50 % o más de mortalidad de los insectos.

### Ejemplo de prueba 13

Los presentes compuestos 1 y 2 se disolvieron en acetona y a continuación se prepararon las soluciones al 10 % p/v de acetona.

Una gota (1,0 µl) de la solución se aplicó tópicamente sobre el protórax ventral de cada cucaracha americana hembra (*Periplaneta americana*). a continuación, se transfirieron los individuos tratados a un recipiente de polietileno limpio (diámetro del fondo: 12 cm, altura: 10 cm) con algo de comida y agua. Cada tratamiento consistía en 2 replicaciones de 5 cucarachas/recipiente de polietileno. La mortalidad se determinó a los 7 días después del tratamiento a 25 °C.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = \left( \frac{\text{número de insectos muertos}}{\text{número de insectos probados}} \right) \times 100$$

Como resultado, el área tratada que se trató con las soluciones de acetona de los presentes compuestos 1 y 2, respectivamente, mostró un 100 % de mortalidad de los insectos.

### Ejemplo de prueba 14

El compuesto 112 (en lo sucesivo, mencionado como “compuesto 112”) descrito en la Tabla 40 del documento WO 2013/018928, y el presente compuesto 1 se disolvieron en acetona y a continuación se prepararon las soluciones de acetona de la concentración indicada.

Una gota (1,0 µl) de la solución se aplicó tópicamente sobre el protórax ventral de cada cucaracha americana hembra (*Periplaneta americana*). A continuación, se transfirieron los individuos tratados a un recipiente de polietileno limpio (diámetro del fondo: 12 cm, altura: 10 cm) con algo de comida y agua. Cada tratamiento consistía en 2 réplicas de cucarachas/recipiente de polietileno. La mortalidad se determinó a los 7 días después del tratamiento a 25 °C.

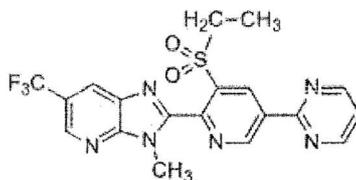
$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = \left( \frac{\text{número de insectos muertos}}{\text{número de insectos probados}} \right) \times 100.$$

El resultado se muestra en la Tabla 6.

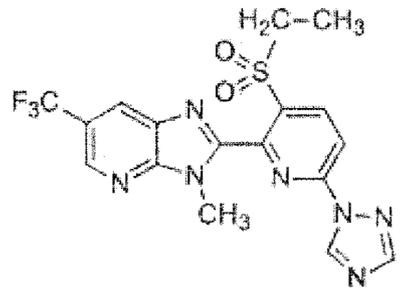
Tabla 6

Concentración del compuesto (p/v %)	Mortalidad (%)	
	Presente compuesto 1	Compuesto 112
4	-	100 %
2	100 %	70 %
1	100 %	-
0,5	100 %	-
0,25	100 %	-

### Compuesto 112:



### Presente compuesto 1

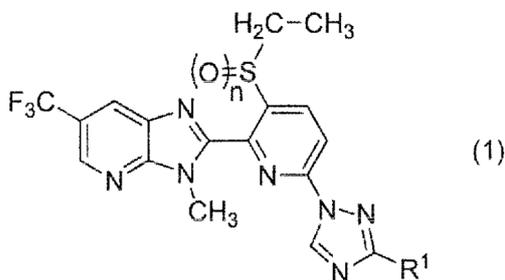


**Aplicabilidad industrial**

- 5 El presente compuesto muestra un excelente efecto de control contra una plaga.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula (1):



5

en la que

10

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C3, un grupo alcoxycarbonilo C2-C4, un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>, un NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>, un grupo nitro o un grupo ciano;

R<sup>2</sup> representa un grupo alquilo C1-C3;

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son iguales o diferentes entre sí y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3;

n es 0, 1 o 2;

15

m es 0, 1 o 2

o un N-óxido del mismo.

20

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C3 o un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>.

25

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo perfluoroalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3 o un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>.

30

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi, un grupo metilsulfanilo, un grupo metilsulfonilo o un grupo metilsulfonilo.

35

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi, un grupo metilsulfanilo o un grupo metilsulfonilo.

40

6. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno.

45

7. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que n es 2.

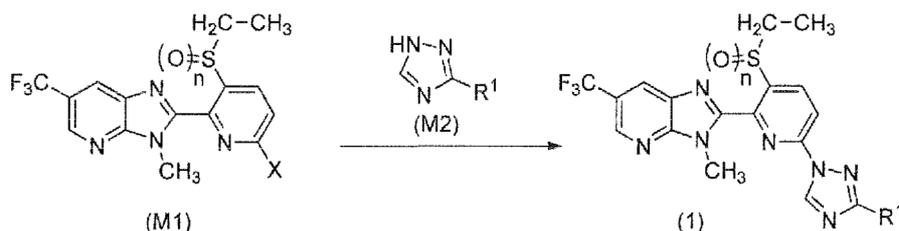
8. Una composición para controlar una plaga que comprende el compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 y un vehículo inerte.

50

9. Un método no terapéutico para controlar una plaga, que comprende una etapa de aplicación de una cantidad efectiva del compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 a un organismo perjudicial o a un hábitat donde vive el organismo perjudicial.

55

10. Un método para producir un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula (1), que comprende una etapa de reacción de un compuesto representado por la fórmula (M1) con un compuesto representado por la fórmula (M2):



50

en las que

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C3, un grupo alcoxycarbonilo C2-C4, un S(O)<sub>m</sub>R<sup>2</sup>, un NR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>, un grupo nitro o un grupo ciano;

R<sup>2</sup> representa un grupo alquilo C1-C3;

5 R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son iguales o diferentes entre sí, y cada uno representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3;  
n es 0, 1 o 2;

m es 0, 1 o 2; y

X es un átomo de halógeno.

10 11. El método de acuerdo con la reivindicación 10, en el que la etapa de reacción del compuesto representado por la fórmula (M1) con el compuesto representado por la fórmula (M2) se lleva a cabo en presencia de una base.

12. El método de acuerdo con la reivindicación 11, en el que la base es hidruro de metal alcalino, hidruro de metal alcalinotérreo o carbonato de metal alcalino.

15