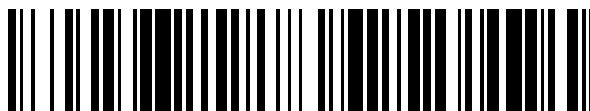


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 711 734**

51 Int. Cl.:

**A01N 43/90** (2006.01)

**A01N 25/04** (2006.01)

**A01N 25/22** (2006.01)

**A01P 7/02** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.02.2016 PCT/JP2016/054085**

87 Fecha y número de publicación internacional: **25.08.2016 WO16133011**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.02.2016 E 16752397 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **02.01.2019 EP 3259992**

54 Título: **Composición agroquímica**

30 Prioridad:

**17.02.2015 JP 2015028628**

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

**07.05.2019**

73 Titular/es:

**NIPPON SODA CO., LTD. (100.0%)  
2-1, Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku  
Tokyo 100-8165, JP**

72 Inventor/es:

**KAI TETSUTARO;  
OKADA ERIKO y  
MAEKAWA TAKAHIRO**

74 Agente/Representante:

**VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro**

ES 2 711 734 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

## DESCRIPCIÓN

Composición agroquímica

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a una composición agroquímica. Más particularmente, la presente invención se refiere a una composición agroquímica que contiene un compuesto que tiene una estructura de azabicyclo, con actividad residual de la misma mejorada.

10 La presente invención reivindica prioridad sobre la base de la Solicitud de Patente Japonesa n.º 2015-028628 presentada el 17 de febrero de 2015.

15 **Antecedentes de la invención**

Los Documentos de Patente 1 o 2 divulgan compuestos de amina cíclica tales como un compuesto que tiene una estructura de azabicyclo. Estos compuestos exhiben control de los efectos en ácaros nocivos para los cultivos.

20 Además, algunos de estos compuestos se descomponen debido a los ácidos orgánicos tales como ascorbato de sodio o ácido DL-málico o luz. Si existe capacidad de descomposición frente a ascorbato de sodio, la posibilidad de descomposición en plantas es elevada debido a que el ascorbato de sodio se encuentra presente en las plantas. Si existe capacidad de descomposición frente a la luz, la posibilidad de descomposición en plantas bajo la luz solar es elevada. Estas descomposiciones aumentan la cantidad necesaria de ingredientes químicos agrícolas, y de este modo se demanda un método de eliminación de dicha descomposición.

25 DOCUMENTOS DE LA TÉCNICA RELACIONADA

**Documentos de Patente**

30 Documento de Patente 1 WO 2011/078081 A1  
Documento de Patente 2 WO 2011/105506 A1

**Sumario de la invención**35 **Problemas a resolver por la invención**

La duración de los efectos acaricidas de un acaricida que contiene un compuesto que tiene una estructura de ariloxiazabicyclo no es suficiente debido a la descomposición del compuesto que tiene una estructura de ariloxiazabicyclo por parte de la luz o ascorbato de sodio en plantas, cuando el acaricida se pulveriza sobre las plantas y posteriormente se le aplica luz solar, o debido al lavado por la lluvia o similar.

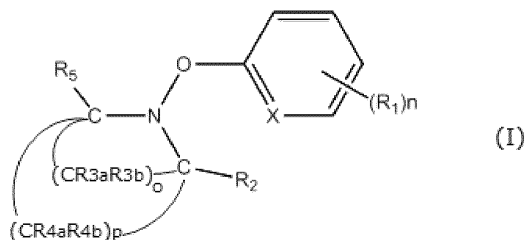
40 Un objetivo de la presente invención consiste en proporcionar una composición agroquímica que contenga un compuesto que tenga una estructura ariloxiazabicyclo, con actividad residual de la misma mejorada.

45 **MEDIOS PARA RESOLVER LOS PROBLEMAS**

La presente invención incluye los siguientes aspectos.

(1) Una composición agroquímica que contiene:

50 un componente (A): un compuesto representado por la fórmula (I) o una de sus sales; y  
un componente (B): un compuesto representado por la fórmula (II); al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en ácido oxálico, un ácido gálico, un ácido tartárico, un almidón, una celulosa, un sorbitol, una poliglicerina, un poli(alcohol vinílico), una glucosa y un ácido cítrico; o una sal de sodio de un copolímero de  
55 2,4,4-trimetilpenteno de ácido maleico,



En la fórmula,

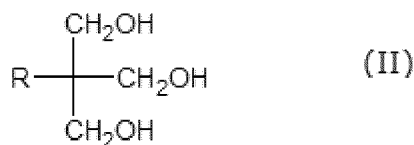
R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3a</sub>, R<sub>3b</sub>, R<sub>4a</sub>, R<sub>4b</sub>, y R<sub>5</sub> representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalcoxi C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo carboxilo, un grupo acilo C1-7 sustituido o no sustituido, un grupo alcocarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxycarbonilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxycarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxycarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo ariloxycarbonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclioxycarbonilo sustituido o no sustituido, un grupo aciloxi C1-7 sustituido o no sustituido, un grupo alcocarboniloxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloxycarboniloxi C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueniloxycarboniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquiniloxycarboniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilaminocarboniloxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilaminocarboniloxi C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilaminocarboniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilaminocarboniloxi C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilaminocarboniloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliaminocarboniloxi sustituido o no sustituido, un grupo alquilidenaminoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo sustituido o no sustituido, un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterocicliloxi sustituido o no sustituido, un grupo sulfoniloxi sustituido, un grupo aminocarbonilo sustituido o no sustituido, un grupo ciano, un grupo nitro o un grupo halógeno,

n representa un número de R<sub>1</sub> y es un número entero de 0 a 4,

o representa un número de (CR<sub>3a</sub>R<sub>3b</sub>) y es un número entero de 2 a 4,

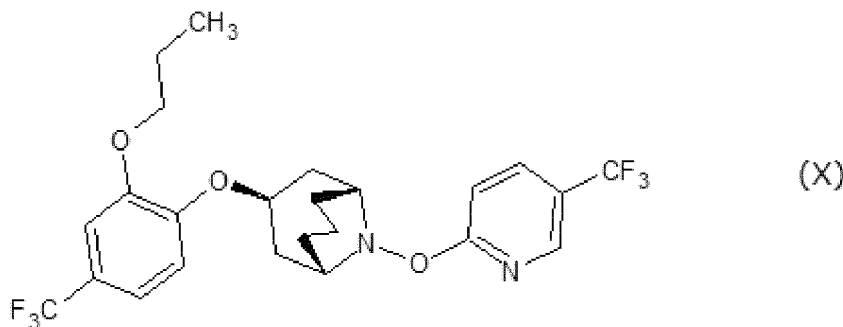
p representa un número de (CR<sub>4a</sub>R<sub>4b</sub>) y es un número entero de 2 a 4, y

X representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno,

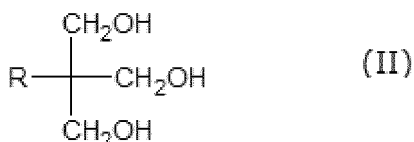


en los que R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-4, un grupo alquenilo C2-4 o un grupo alquinilo C2-4.

(2) La composición de detergente de acuerdo con la reivindicación 1, en la que el componente (A) es un compuesto representado por la fórmula (X):



(3) La composición agroquímica de acuerdo con (1), en la que el componente (B) es un compuesto representado por la fórmula (II).



En la fórmula, R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-4, un grupo alquenilo C2-4 o un grupo

alquinilo C2-4.

(4) La composición agroquímica de acuerdo con (1), en la que el componente (B) es al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en ácido oxálico, un ácido gálico, un ácido tartárico, un almidón, una celulosa, un sorbitol, una poliglicerina, un poli(alcohol vinílico), una glucosa y un ácido cítrico.

(5) La composición agroquímica de acuerdo con (3) o (4), que además contiene una sal de sodio de un copolímero de 2,4,4-trimetilpenteno de ácido maleico.

(6) La composición agroquímica de acuerdo con (3) o (4), en la que, con respecto a una masa total de la composición agroquímica, una cantidad del componente (A) es de un 1 a un 50 % en masa, una cantidad del componente (B) es de un 1 a un 40 % en masa, y una relación en masa del componente (A)/el componente (B) es de 20/1 a 1/20.

(7) La composición agroquímica de acuerdo con una cualquiera de (1) a (6) en la que la composición agroquímica está en estado de suspensión acuosa.

### Efectos de la invención

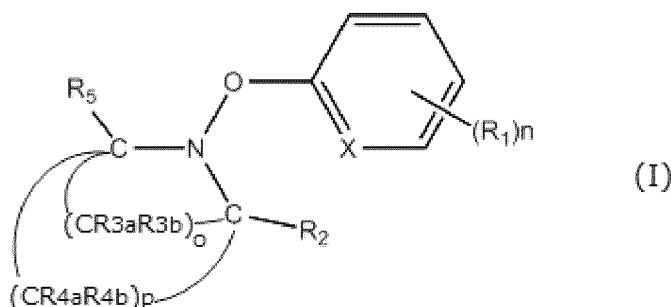
La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención exhibe una relación residual elevada de un compuesto que tiene una estructura de azabicyclo que es un principio activo agrícola después de la pulverización. El uso de la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención hace posible controlar los ácaros nocivos para los cultivos agrícolas exhibiendo efectos acaricidas durante un largo período de tiempo.

### REALIZACIONES PARA LLEVAR A CABO LA INVENCION

Una composición agroquímica de acuerdo con la presente invención contiene un componente (A) y un componente (B).

(Componente (A))

Un componente (A) disponible en la presente invención es un compuesto representado por medio de la fórmula (I) (a continuación, abreviado como compuesto (1)) o una sal del compuesto (I).



En la fórmula (I),

$R_1$ ,  $R_2$ ,  $R_{3a}$ ,  $R_{3b}$ ,  $R_{4a}$ ,  $R_{4b}$ , y  $R_5$  representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalcoxi C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinoxilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo carboxilo, un grupo acilo C1-7 sustituido o no sustituido, un grupo alcocarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo carbonilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno carbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinoxilo carbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo carbonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo carbonilo sustituido o no sustituido, un grupo acilo C1-7 sustituido o no sustituido, un grupo alcocarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo oxocarbonilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno oxocarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinoxilo carbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo carbonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo carbonilo sustituido o no sustituido, un grupo alquilaminocarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilaminocarbonilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno aminocarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinoxilo carbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquilaminocarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilaminocarbonilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno aminocarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo carbonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo aminocarbonilo sustituido o no sustituido, un grupo alquilideno amino C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterociclilo sustituido o no sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo aminocarbonilo sustituido o no sustituido, un grupo ciano, un grupo nitro o un grupo halógeno,

$n$  representa un número de  $R_1$  y es un número entero de 0 a 4,

o representa un número de (CR<sub>3a</sub>R<sub>3b</sub>) y es un número entero de 2 a 4,

p representa un número de (CR<sub>4a</sub>R<sub>4b</sub>) y es un número entero de 2 a 4, y

5 X representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno.

En primer lugar, se explican los significados de la expresión "no sustituido" y el término "sustituido" en la fórmula (I).

10 La expresión "no sustituido" significa que el grupo especificado está formado únicamente por un grupo que sirve como núcleo materno. Cuando únicamente se menciona el nombre del grupo que sirve como núcleo materno sin mención de "sustituido", significa "no sustituido", a menos que se indique lo contrario.

15 Por otro lado, el término "sustituido" significa que un átomo de hidrógeno de un grupo que sirve como núcleo materno se ha sustituido con un sustituyente que tiene la misma estructura o una estructura diferente del núcleo materno. El "sustituyente" es un grupo diferente que se une al grupo que sirve como núcleo materno. El "sustituyente" puede ser uno o dos o más. Al menos dos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes. Por ejemplo, un grupo alquilo C1-6 sustituido tiene un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono como núcleo materno, estando cualquiera de los átomos de hidrógeno del grupo alquilo sustituido con (a) grupo(s) que tiene una estructura diferente de los mismos.

20 Los términos tales como "C1-6" o similares indican que el número de átomos de carbono del grupo que sirve como núcleo materno es de 1 a 6 o similares. El número de átomos de carbono no incluye el número de átomos de carbono en un sustituyente. Por ejemplo, un grupo butilo que tiene un grupo epoxi como sustituyente se clasifica como grupo alquilo C4 alcoxi C2.

25 El "sustituyente" no está particularmente limitado con tal de que sea químicamente aceptable y tenga los efectos de la presente invención.

30 Los posibles ejemplos del "sustituyente" incluyen: un grupo halógeno tal como un grupo fluoro, un grupo cloro, un grupo bromo o un grupo yodo;

un grupo alquilo, tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo o un grupo n-hexilo, preferentemente un grupo alquilo C1-6;

35 un grupo cicloalquilo tal como un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo o un grupo cicloheptilo, preferentemente un grupo cicloalquilo C3-8;

un grupo alqueno tal como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, un grupo 5-hexenilo y un grupo cinamilo, preferentemente un grupo alquienilo C2-6;

40 un grupo cicloalqueno tal como un grupo 2-ciclopropenilo, un grupo 2-ciclopentenilo, un grupo 3-ciclohexenilo o un grupo 4-ciclooctenilo, preferentemente un grupo cicloalqueno C3-8;

un grupo alquino tal como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1-hexinilo o un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo, preferentemente un grupo alquinilo C2-6;

45 un grupo alcoxi tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi o un grupo t-butoxi, preferentemente un grupo alcoxi C1-6;

50 un grupo alquenoilo tal como un grupo viniloilo, un grupo aliloilo, un grupo propenoilo o un grupo butenoilo, preferentemente un grupo alquenoilo C2-6;

un grupo alquinoilo tal como un grupo etiniloilo o un grupo propargiloilo, preferentemente un grupo alquinoilo C2-6;

un grupo arilo tal como un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo o un grupo 2-naftilo, preferentemente un grupo arilo C6-10;

un grupo ariloilo tal como un grupo feniloilo o un grupo 1-naftiloilo, preferentemente un grupo ariloilo C6-10;

un grupo aralquilo tal como un grupo bencilo o un grupo fenetilo, preferentemente un grupo aralquilo C7-11;

55 un grupo aralquiloilo tal como un grupo benciloilo o un grupo fenetiloilo, preferentemente un grupo aralquiloilo C7-12;

un grupo acilo tal como un grupo formilo, un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo benzoilo o un grupo ciclohexilcarbonilo, preferentemente un grupo arilo C1-7;

un grupo aciloilo tal como un grupo formiloilo, un grupo acetiloilo, un grupo propioniloilo, un grupo benzoiloilo o un grupo ciclohexilcarboniloilo, preferentemente un grupo aciloilo C1-7;

60 un grupo alcoxycarbonilo tal como un grupo metoxycarbonilo, un grupo etoxycarbonilo, un grupo n-propoxycarbonilo, un grupo i-propoxycarbonilo, un grupo n-butoxycarbonilo y un grupo t-butoxycarbonilo, preferentemente un grupo alcoxycarbonilo C1-6;

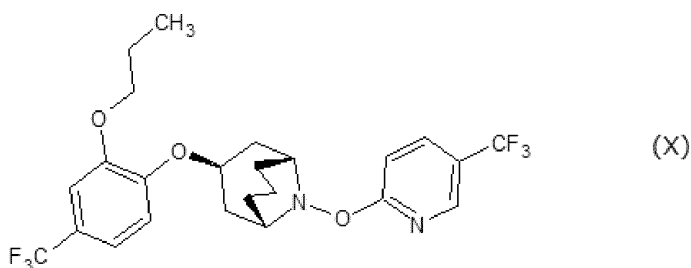
un grupo carboxilo;

un grupo hidroxilo;

65 un grupo haloalquilo tal como un grupo clorometilo, un grupo cloroetilo, un grupo 1,2-dicloro-n-propilo, un grupo 1-fluoro-n-butilo o un grupo perfluoro-n-pentilo, preferentemente un grupo halo alquilo C1-6;

- un grupo haloalquenilo tal como un grupo 2-cloro-1-propenilo o un grupo 2-fluoro-1-butenilo, preferentemente un grupo halo alquenilo C2-6;
- un grupo haloalquinilo tal como un grupo 4,4-dicloro-1-butenilo, un grupo 4-fluoro-1-penteno o un grupo 5-bromo-2-penteno, preferentemente un grupo halo alquinilo C2-6;
- 5 un grupo haloalcoxi tal como un grupo 2-cloro-n-propoxi o un grupo 2,3-diclorobutoxi, preferentemente un grupo halo alcoxi C1-6;
- un grupo haloalquenilo tal como un grupo 2-cloropropenilo o un grupo 3-bromobutenilo, preferentemente un grupo halo alquenilo C2-6;
- 10 un grupo haloarilo tal como un grupo 4-clorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo y un grupo 2,4-diclorofenilo, preferentemente un grupo halo arilo C6-10;
- un grupo haloariloxi tal como un grupo 4-fluorofenoxi o un grupo 4-cloro-1-naftiloxi, preferentemente un grupo halo ariloxi C6-10;
- un grupo haloacilo tal como un grupo cloroacetilo, un grupo trifluoroacetilo, un grupo tricloroacetilo o un grupo 4-clorobenzoilo;
- 15 un grupo ciano; un grupo isociano; un grupo nitro; un grupo isocianato; un grupo cianato; un grupo amino;
- un grupo alquilamino tal como un grupo metilamino, un grupo dimetilamino o un grupo dietilamino;
- un grupo arilamino tal como un grupo anilino, un grupo naftilamino o un grupo antracencilamino;
- un grupo aralquilamino tal como un grupo bencilamino o un grupo fenetilamino;
- 20 un grupo alquilsulfonilamino tal como un grupo metilsulfonilamino, un grupo etilsulfonilamino, un grupo n-propilsulfonilamino, un grupo i-propilsulfonilamino, un grupo n-butilsulfonilamino o un grupo t-butilsulfonilamino, preferentemente un grupo alquilsulfonilamino C1-6;
- un grupo arilsulfonilamino tal como un grupo fenilsulfonilamino, preferentemente un grupo arilsulfonilamino C6-10;
- un grupo sulfonilamino heterocíclico tal como un grupo piperazinil sulfonilamino, preferentemente un grupo sulfonilamino heterocíclico de 3 a 6 miembros;
- 25 un grupo acilamino tal como un grupo formilamino, un grupo acetilamino, un grupo propanoilamino, un grupo butirilamino, un grupo i-propilcarbonilamino o un grupo benzoilamino, preferentemente un grupo acilamino C1-7;
- un grupo alcóxicarbonilamino tal como un grupo metóxicarbonilamino, un grupo etóxicarbonilamino, un grupo n-propóxicarbonilamino o un grupo i-propóxicarbonilamino, preferentemente un grupo alcóxicarbonilamino C1-6;
- 30 un grupo haloalquilsulfonilamino tal como un grupo fluoro metilsulfonilamino, un grupo clorometilsulfonilamino, un grupo bromo metilsulfonilamino, un grupo difluorometilsulfonilamino, un grupo diclorometilsulfonilamino, un grupo 1,1-difluoroetilsulfonilamino, un grupo trifluorometilsulfonilamino, un grupo 1,1,1-trifluoroetilsulfonilamino o un grupo pentafluoroetilsulfonilamino, preferentemente un grupo halo alquilsulfonilamino C1-6;
- un grupo bis(alquilsulfonil)amino tal como un grupo bis(metilsulfonil)amino, un grupo bis(etilsulfonil) amino, un grupo(etilsulfonil) (metilsulfonil) amino, un grupo bis(n-propilsulfonil) amino, un grupo bis(i-propilsulfonil) amino, un
- 35 un grupo bis(n-butilsulfonil) amino o un grupo bis(t-butilsulfonil) amino, preferentemente un grupo bis(alquilsulfonil C1-6) amino;
- un grupo bis(haloalquilsulfonil)amino tal como un grupo bis(fluorometilsulfonil)amino, un grupo bis(clorometilsulfonil) amino, un grupo bis(bromometilsulfonil) amino, un grupo bis(difluorometilsulfonil) amino, un grupo bis(diclorometilsulfonil) amino, un grupo bis(1,1-difluoroetilsulfonil) amino, un grupo bis(trifluorometilsulfonil) amino, un grupo bis(1,1,1-trifluoroetilsulfonil) amino o un grupo bis(halo alquil C1-6 sulfonil) amino;
- 40 un grupo hidrazino sustituido o no sustituido tal como un grupo hidrazino, un grupo N'-fenilhidrazino, un grupo N'-metóxicarbonilhidrazino, un grupo N'-acetilhidrazino o un grupo N'-metilhidrazino;
- un grupo aminocarbonilo sustituido o no sustituido tal como un grupo aminocarbonilo, un grupo
- 45 dimetilaminocarbonilo, un grupo fenilaminocarbonilo o un grupo N-fenil-N-metilaminocarbonilo;
- un grupo hidrazinocarbonilo sustituido o no sustituido tal como un grupo hidrazinocarbonilo, un grupo N'-metilhidrazinocarbonilo o un grupo N'-fenilhidrazinocarbonilo;
- un grupo iminoalquilo con o sin N-sustitución tal como un grupo hidrazino, un grupo 1-N-feniliminoetilo, un grupo N-hidroxiiminoetilo o un grupo N-metoxiiminoetilo;
- 50 un grupo mercapto; un grupo isotiocianato; un grupo tiocianato; un grupo alquiltio tal como un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo i-propiltio, un grupo n-butiltio, un grupo i-butiltio, un grupo s-butiltio, un grupo t-butiltio, preferentemente un grupo alquiltio C1-6;
- un grupo alqueniltio tal como un grupo viniltio o un grupo aliltio, preferentemente un grupo alqueniltio C2-6;
- un grupo alquiniltio tal como un grupo etiniltio o un grupo propargiltio, preferentemente un grupo alquiniltio C2-6;
- 55 un grupo ariltio tal como un grupo feniltio o naftiltio, preferentemente un grupo ariltio C6-10;
- un grupo heteroariltio tal como un grupo 2-piridiltio o un grupo 3-piridaziltio, preferentemente un grupo heteroarilo de 5 a 6 miembros;
- un grupo aralquiltio tal como un grupo benciltio o un grupo feniltio, preferentemente un grupo aralquiltio C7-10;
- 60 un grupo alquiltiocarbonilo tal como un grupo metiltiocarbonilo, un grupo etiltiocarbonilo, un grupo n-propiltiocarbonilo, un grupo i-propiltiocarbonilo, un grupo n-butiltiocarbonilo, un grupo i-butiltiocarbonilo, un grupo s-butiltiocarbonilo o un grupo t-butiltiocarbonilo, preferentemente un grupo alquiltiocarbonilo C1-6;
- un grupo alquilsulfinilo tal como un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo o un grupo t-butilsulfinilo, preferentemente un grupo alquilsulfinilo C1-6;
- un grupo alquilsulfinilo tal como un grupo alilsulfinilo, preferentemente un grupo alquilsulfinilo C2-6;
- 65 un grupo alquilsulfinilo tal como un grupo propargilsulfinilo, preferentemente un grupo alquilsulfinilo C2-6;
- un grupo arilsulfinilo tal como un grupo fenilsulfinilo, preferentemente un grupo arilsulfinilo C6-10;

- un grupo heteroarilsulfonilo tal como un grupo 2-piridilsulfonilo o un grupo 3-piridilsulfonilo, preferentemente un grupo heteroarilsulfonilo de 5 a 6 miembros;
- un grupo aralkilsulfonilo tal como un grupo bencilsulfonilo o un grupo fenilsulfonilo, preferentemente un grupo aralkilsulfonilo C7-10;
- 5 un grupo alkilsulfonilo tal como un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo o un grupo t-butilsulfonilo, preferentemente un grupo alkilsulfonilo C1-6;
- un grupo alquilsulfonilo tal como un grupo alilsulfonilo, preferentemente un grupo alquilsulfonilo C2-6;
- un grupo alquinsulfonilo tal como un grupo propargilsulfonilo, preferentemente un grupo alquilsulfonilo C2-6;
- un grupo arilsulfonilo tal como un grupo fenilsulfonilo, preferentemente un grupo arilsulfonilo C6-10;
- 10 un grupo heteroarilsulfonilo tal como un grupo 2-piridilsulfonilo o un grupo 3-piridilsulfonilo, preferentemente un grupo heteroarilsulfonilo de 5 a 6 miembros;
- un grupo aralkilsulfonilo tal como un grupo bencilsulfonilo o un grupo fenilsulfonilo, preferentemente un grupo aralkilsulfonilo C7-10;
- 15 un grupo heterocíclico de 5 miembros insaturado tal como un grupo furan-2-ilo, un grupo furan-3-ilo, un grupo tiofen-2-ilo, un grupo tiofen-3-ilo, un grupo pirrol-2-ilo, un grupo pirrol-3-ilo, un grupo oxazol-2-ilo, un grupo oxazol-4-ilo, un grupo oxazol-5-ilo, un grupo tiazol-2-ilo, un grupo tiazol-4-ilo, un grupo tiazol-5-ilo, un grupo isooxazol-3-ilo, un grupo isooxazol-4-ilo, un grupo isooxazol-5-ilo, un grupo isotiazol-3-ilo, un grupo isotiazol-4-ilo, un grupo isotiazol-5-ilo, un grupo imidazol-2-ilo, un grupo imidazol-4-ilo, un grupo imidazol-5-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo, un grupo pirazol-5-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-4-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo o un grupo 1,2,4-triazol-5-ilo;
- 20 un grupo heterocíclico de 6 miembros insaturado tal como un grupo piridin-2-ilo, un grupo piridin-3-ilo, un grupo piridin-4-ilo, un grupo 5-cloro-piridin-3-ilo, un grupo 3-trifluorometil-piridin-2-ilo, un grupo piridazin-3-ilo, un grupo piridazin-4-ilo, un grupo pirazin-2-ilo, un grupo pirimidin-2-ilo, un grupo pirimidin-4-ilo, un grupo pirimidin-5-ilo, un grupo 1,3,5-triazin-2-ilo o un grupo 1,2,4-triazin-3-ilo;
- 25 un grupo heterocíclico saturado tal como un grupo tetrahidrofuran-2-ilo, un grupo tetrahidrapiran-4-ilo, un grupo piperidin-3-ilo, un grupo pirrolidin-2-ilo, un grupo morfolino, un grupo piperidino o un grupo N-metilpiperazinilo; y un grupo heterocíclico tal como un grupo 2-piridiloxi o un grupo 3-oxazoliloxi.
- 30 Ejemplos adicionales de "sustituyente" incluyen un grupo representado por medio de  $-\text{Si}(\text{R}^6)(\text{R}^7)(\text{R}^8)$ , tal como  $-\text{Si}(\text{Me})_3$ ,  $-\text{SiPh}_3$ ,  $-\text{Si}(\text{cPr})_3$ , o  $-\text{Si}(\text{Me})_2(\text{tBu})$ .  $\text{R}^6$ ,  $\text{R}^7$ , y  $\text{R}^8$  en la fórmula representan cada uno independientemente un grupo alquilo C1-6, un grupo cicloalquilo C3-8 o un grupo fenilo. Los ejemplos específicos del grupo alquilo C1-6 y el grupo cicloalquilo C3-8 incluyen los mismos grupos que se ha mencionado con anterioridad. Estos "sustituyentes" pueden además presentar otro "sustituyente".
- 35 Es preferible que  $\text{R}_1$  en la fórmula (I) sea un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido y más preferentemente un grupo halo alquilo C1-6.
- Es preferible que  $n$  en la fórmula (I) sea 1.
- 40 Es preferible que  $X$  en la fórmula (I) sea un átomo de nitrógeno.
- Es preferible que  $\text{R}_{3a}$  y  $\text{R}_{3b}$  en la fórmula (I) representen cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido y más preferentemente un átomo de hidrógeno.
- 45 Es preferible que  $o$  en la fórmula (I) sea 3.
- Es preferible que  $\text{R}_{4a}$  y  $\text{R}_{4b}$ , en la fórmula (I) representen cada uno independientemente un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-6 sustituido o no sustituido y más preferentemente un átomo de hidrógeno.
- 50 Es preferible que  $p$  en la fórmula (I) sea 3.
- Es preferible que  $\text{R}_5$  en la fórmula (I) sea un grupo ariloxi C6-10 sustituido o no sustituido y más preferentemente un grupo fenoxi sustituido. Es preferible que uno sustituyente del mismo sea un grupo alquilo C1-6, un grupo halo alquilo C1-6 y/o un grupo alcoxi C1-6.
- 55 Además es preferible que el compuesto (I) sea un compuesto representado por medio de la fórmula (X).



5 El compuesto X es (1R, 5R, 7S)-7-(2-propoxi-4-(trifluorometil) fenoxi)-9-[[5-(trifluorometil) piridin-2-il]oxi]-9-azabicyclo[3.3.1]non-2-ino.

Una sal del compuesto (I) no se encuentra particularmente limitada, con la condición de que la sal sea una sal agrícola y hortícolamente aceptable. Ejemplos de la misma incluyen: sales de un ácido inorgánico tal como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; sales de un ácido orgánico tal como ácido acético o ácido láctico; sales de un metal alcalino, tal como litio, sodio o potasio; sales de un metal alcalinotérreo tal como calcio o magnesio; sales de un metal de transición tales como hierro o cobre; y sales de una base orgánica tal como amoníaco, trietilamina, tributilamina, piridina o hidrazina.

15 El compuesto (I) no está particularmente limitado por los métodos de producción del mismo. Por ejemplo, el compuesto (I) se puede obtener por medio de un método divulgado en el Documento de Patente 1 o 2. Además, la sal del compuesto (I) se puede obtener, por ejemplo, por medio de un método convencional a partir del compuesto (I).

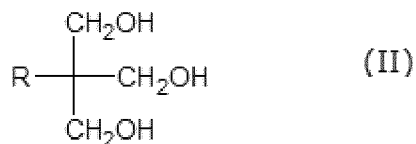
20 El compuesto (I) o la sal del compuesto (I) tiene una actividad de control de la enfermedad de la planta tal como actividad acaricida.

25 La cantidad del componente (A) presente en la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención, con respecto a la masa total de la composición agroquímica, es preferentemente de un 1 a un 50 % en masa, más preferentemente de un 5 a un 30 % en masa, e incluso más preferentemente de un 10 a un 25 % en masa.

(Componente (B))

30 El componente (B) disponible en la presente invención es un inhibidor de hidrólisis. El inhibidor de hidrólisis es un compuesto que contribuye a la eliminación de la hidrólisis o fotólisis del compuesto (I) en presencia de un ascorbato de sodio que existe sobre las hojas. El inhibidor de hidrólisis es un compuesto que aumenta la cantidad del compuesto (I) 24 horas después de producirse la mezcla entre el compuesto (I), un ácido ascórbico y el inhibidor de hidrólisis y posteriormente se deja en un lugar oscuro o bajo luz solar, en comparación con el caso en el que no se añade inhibidor alguno.

35 El componente (B) disponible en la presente invención puede ser un componente (B1) que es un compuesto representado por la fórmula (II) (en lo sucesivo, abreviado como compuesto (II)).



40 En la fórmula (II), R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-4, un grupo alqueno C2-4 o un grupo alquino C2-4.

45 Los ejemplos del grupo alquilo C1-4 incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo y un grupo terc-butilo.

Los ejemplos del grupo alqueno C2-4 incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo y un grupo 2-metil-2-propenilo.

50 Los ejemplos del grupo alquino C2-4 incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo y un grupo 1-metil-2-propinilo.

Es preferible que R en la fórmula (II) sea un grupo etilo.



Los ejemplos específicos del compuesto (II) incluyen un trimetilolmetano, un trimetiloletano y un trimetilolpropano.

5 Como componente (B), se puede usar un tipo del compuesto (II), o dos o más tipos del compuesto (II) en combinación.

10 El componente (B) disponible en la presente invención puede ser un componente (B2) que sea al menos un seleccionado entre el grupo que consiste en ácido oxálico, un ácido gálico, un ácido tartárico, un almidón, una celulosa, un sorbitol, una poliglicerina, un poli(alcohol vinílico), una glucosa y un ácido cítrico, y preferentemente un ácido oxálico, un ácido gálico, un ácido tartárico, un almidón o una celulosa.

Como componente (B) disponible en la presente invención, se pueden usar el componente (B1) y el componente (B2) en combinación.

15 Es preferible que la cantidad del componente (B) (la masa total del componente B1 y el componente B2), con respecto a la masa total de la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención, sea de un 1 a un 40 % en masa, más preferentemente de un 5 a un 30 % en masa, e incluso más preferentemente de un 10 a un 25 % en masa.

20 Es preferible que la relación en masa del componente (A) / el componente (B) (la masa total del componente B1 y el componente B2) en la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención sea de 1/20 a 20/1, más preferentemente de 1/15 a 15/1, e incluso más preferentemente de 1/10 a 10/1.

25 El componente (B) disponible en la presente invención puede ser un componente (C) que sea una sal de sodio de un copolímero de 2,4,4-trimetilpenteno de ácido maleico.

El componente (C) se puede usar en combinación con el componente (B1) y/o el componente (B2). La relación residual del componente (A) se aumenta además por medio de la formulación del componente (C).

30 La cantidad del componente (C) presente en la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención, con respecto a la masa total de la composición agroquímica, es preferentemente de un 1 a un 10 % en masa, y más preferentemente de un 2 a un 8 % en masa.

35 La relación en masa del componente (A) / componente (C) en la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención es preferentemente de 2/1 a 20/1, y más preferentemente de 3/1 a 10/1.

La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención puede contener además un compuesto de amina cíclica divulgado en el Documento de Patente 1 o 2 (exceptuando el componente (A): el compuesto (I) o la sal del compuesto (I)).

40 (Otros componentes)

45 La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención, puede contener además un aditivo generalmente disponibles en un agente agrícola y hortícola tal como un tensioactivo, un espesante, un antiespumante, un agente anticongelante, un disolvente orgánico, un conservante, un antioxidante, un inhibidor de cristalización o un agente colorante. Entre estas, preferentemente existe un tensioactivo presente en las mismas.

50 La cantidad del otro componente, con respecto a la masa total de la formulación, es de un 0 a un 10 % en masa, preferentemente de un 0,05 a un 5 % en masa, y más preferentemente de un 0,1 a un 4 % en masa.

(Otro componente: tensioactivo)

55 Los ejemplos de tensioactivo no iónico incluyen: poli(éteres de oxietileno arilo) tales como poli(éteres de oxietileno alquifenilo), poli(éteres de oxietileno bencilfenilo), poli(éteres de oxietileno monoestirilfenilo), poli(éteres de oxietileno diestirilfenilo) y poli(éteres de oxietileno triestirilfenilo); ésteres de ácido graso de sacarosa, poli(ésteres de ácido graso de oxietilensacarosa), ésteres de ácido graso de sorbitano, polioxietileno alquilen glicoles y polímeros de bloques de polioxietileno y polioxipropileno.

60 Los ejemplos de tensioactivo aniónico incluyen: sulfonatos de alquilarilo tales como alquil sulfonatos de sodio, alquilaril sulfonatos de calcio y alquilaril sulfonatos de amonio; poli(éter sulfatos de oxietileno alquifenilo), poli(éter fosfonatos de oxietileno alquifenilo), alquilsulfatos, poli(éter sulfatos de oxietileno alquilo), poli(éter fosfato de oxietileno alquilo), sulfosuccinatos de dialquilo, sulfonato de alquilo naftaleno tales como alquilo naftaleno sulfonatos de sodio, policondensaciones de formaldehído de sulfonatos de naftaleno, sulfonatos de lignina y policarboxilatos.

65 Los ejemplos de tensioactivos catiónico incluyen sales de amonio cuaternario de alquilo, sales de alquilamina y sales de alquilpiridinio.

Los ejemplos de tensioactivo anfótero incluyen alquil betainas, óxidos de amina y sales de alquilamino ácido.

Uno de estos tensioactivos se puede usar solo, o se pueden usar dos o más de los mismos en combinación.

5

(Otro componente: espesante)

Un espesante es un compuesto que aumenta la viscosidad, y con frecuencia se usa un compuesto polimérico. Aunque HPMC ya esté presente en la presente composición, se puede usar un espesante adicional exceptuando el HPMC para aumentar más la viscosidad, a menos que se generen efectos negativos tales como proliferación de cristales.

10

El espesante no está particularmente limitado, con la condición de que el espesante sea un compuesto que tenga la propiedad anteriormente mencionada, y se puede usar un tipo del mismo o dos o más tipos del mismo. Los ejemplos de los mismos incluyen un almidón, una dextrina, una celulosa, una metilcelulosa, una etilcelulosa, una carboximetil celulosa, una hidroxietil celulosa, una hidroxipropil celulosa, un carboximetil almidón, un pululano, un alginato de sodio, un alginato de amonio, un alginato de propilen glicol, una goma guar, una goma de algarrobo, una goma arábiga, una goma de xantano, una gelatina, una caseína, un poli(alcohol vinílico), un óxido de polietileno, un polietilenglicol, un polímero de bloques de etileno y propileno, un poliacrilato de sodio, una polivinil pirrolidona y un carragenano.

15

20

(Otro componente: antiespumante)

Un antiespumante es un compuesto que evita la formación de espuma.

25

La cantidad del antiespumante, con respecto a la masa total de la formulación, es de un 0 a un 5 % en masa, preferentemente de un 0 a un 1 % en masa, y más preferentemente de un 0,1 a un 0,5 % en masa.

Los ejemplos del antiespumante incluyen SILICONE SM5512 (fabricado por Dow Corning Toray Silicone Co., Ltd.), ANTIFOAM E-20 (fabricado por Kao Corporation) y SILFOAM SE39 (fabricado por Wacker Ashikasei Silicone co., Ltd.).

30

(Otro componente: agente anticongelante)

Un agente anticongelante es un compuesto que evita la congelación de formulaciones agroquímicas en zonas frías.

35

Los ejemplos de agente anticongelante incluyen un etilen glicol, un dietilenglicol, un propilenglicol y una glicerina.

(Otro componente: disolvente orgánico)

Un disolvente orgánico es un compuesto que contribuye a disolver un principio activo agroquímico y es un compuesto líquido que tiene solubilidad en agua.

40

Los ejemplos de disolventes orgánicos incluyen: alcoholes inferiores tales como etanol e isopropanol; disolventes basados en glicol tales como etilen glicol, un propilenglicol, un dipropilenglicol, Un polipropilenglicol y una glicerina; disolventes basados en cetona tales como acetona, una metil etil cetona y un carbonato de propileno; disolventes polares, tales como dimetilformamida, un sulfóxido de dimetilo, un acetonitrilo y una N-metilpirrolidona.

45

(Otro componente: conservante)

Un conservante es un compuesto que se usa para evitar la proliferación de bacterias u hongos.

50

La cantidad del conservante, con respecto a la masa total de la formulación, es de un 0 a un 5 % en masa, preferentemente de un 0,01 a un 1 % en masa, y más preferentemente de un 0,02 a un 0,5 % en masa.

55

Los ejemplos del conservante incluyen: conservantes basados en isotiazolina tales como metilisotiazolinona (MIT, MI), una clorometilisotiazolinona (CMIT, CMI), una octilisotiazolinona (OIT, OI), una diclorooctilisotiazolinona (DCOIT, DCOI) y una bencisotiazolinona (BIT): una hexametileno tetramina, un propionato de sodio, un ácido sórbico, una solución de ácido sulfuroso, un paraformaldehído, un ácido benzoico, un p-hidroxibenzoato de propilo, p-hidroxibenzoato de metilo, un benzoato de sodio, un ácido ascórbico, un palmitato de ascorbilo y sodio = 1,1'-bifenil-2-olato. Ejemplos de conservante comercialmente disponible incluyen: LEGEND MK (fabricado por Rohm & Haas Company), DENISAIDO BIT-20N (fabricado por Nagase ChemteX Corporation), PROXEL GXL (fabricado por Avecia Co., Ltd.), y CAISSON CG (fabricado por The Dow Chemical Company, Ltd.).

60

(Otro componente: antioxidante)

65

## ES 2 711 734 T3

Un antioxidante es un compuesto que se usa para evitar la oxidación de las formulaciones agroquímicas.

Los ejemplos de antioxidante incluyen galato de n-propilo e hidroxianisol butilado.

5 (Otro componente: inhibidor de cristalización)

Un inhibidor de cristalización es un compuesto que está presente para evitar la precipitación de los cristales de una formulación agroquímica.

10 Los ejemplos de inhibidor de cristalización incluyen resinas solubles en agua tales como serie Agrimer VEMA (fabricada por ISP Co., Ltd.), serie Agrimer VA (fabricada por ISP Japana Co., Ltd.) y SOKALAN HP 53 (fabricada por BASF Corp.).

(Otro componente: agente colorante)

15 Un agente colorante es un compuesto que se usa para colorear una formulación agroquímica con el fin de evitar la ingestión accidental.

20 Los ejemplos de agente colorante incluyen: colorantes alimentarios tales como Amarillo Alimentario N.º 5, Rojo Alimentario N.º 2, y Azul Alimentario N.º 2, colorantes de laca comestibles y óxido férrico.

(Forma de composición agroquímica)

25 La forma de la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención puede ser un sólido o un líquido. Es preferible que la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención esté en estado de suspensión acuosa.

30 La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención no está particularmente limitada por los métodos de producción de la misma. La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención se puede preparar por medio de mezcla uniforme de una parte o la totalidad del componente (A), el componente (B) y el componente (C) con agua, molienda en húmedo de la mezcla, y posterior adición de agua y los restantes componentes, si es necesario, para homogeneizar uniformemente la mezcla.

(Uso de la composición agroquímica)

35 La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención es apropiada para su aplicación a plantas (aplicación foliar), suelo sobre el cual crecen las plantas (aplicación al suelo), agua de arrozal (aplicación a la superficie del agua) o semillas (tratamiento de semillas). La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención se puede diluir con agua hasta una concentración baja a aplicar. Es preferible que la composición agroquímica se diluya con agua de forma que la concentración del componente (A) sea de 1 a 10000 ppm y más preferentemente de 10 a 1000 ppm, dependiendo de los cultivos, enfermedades o métodos de aplicación objetivo.

45 En caso de aplicación foliar, la composición agroquímica diluida con agua, como se ha mencionado anteriormente, se pulveriza preferentemente a 10 a 300 l, más preferentemente de 10 a 100 l, por cada 10 acres (4,05 hectáreas).

En caso de aplicación al suelo o aplicación a la superficie del agua, la composición agroquímica diluida con agua como se ha mencionado anteriormente se pulveriza preferentemente de forma que el componente (A) se pulverice a 0,1 a 1000 g, más preferentemente de 10 a 100 g por cada 10 acres (4,05 hectáreas).

50 En caso de tratamiento de semillas, la composición agroquímica diluida con agua como se ha mencionado anteriormente se pulveriza preferentemente de forma que el componente (A) se pulverice a 0,001 a 50 g por cada 1 kg de semillas.

Entre estos métodos de aplicación, la aplicación foliar sobre árboles frutales resulta particularmente preferida.

55 (Forma de dosificación de la composición agroquímica)

60 La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención se puede formular para dar lugar a una forma de dosificación conocida. Los ejemplos de la forma de dosificación incluyen un agente fluido, un concentrado emulsionable, un polvo humectable, un concentrado soluble, un polvo soluble en agua, un polvo seco y un gránulo. Entre estas formas de dosificación, se prefiere el agente fluido y se prefiere más un agente SC (concentrado de suspensión). La formulación se puede obtener por métodos conocidos.

65 El significado general del agente fluido, el concentrado emulsionable, el polvo humectable, el concentrado soluble, el polvo soluble en agua, el polvo seco y el gránulo se explica a continuación.

(Agente fluido (agente SC (concentrado de suspensión), agente EW (emulsión de aceite en agua) y agente SE (suspo emulsión))

5 El agente fluido es una formulación obtenida por medio de molienda en húmedo de una materia prima agroquímica (sólido insoluble en agua), adición de un adyuvante (tal como un agente humectante, un agente de dispersión o un agente anticongelante) a la misma, y posterior dispersión de la mezcla en agua y se puede clasificar en un agente SC, un agente EW o un agente SE. El agente EW es una formulación en la cual la materia prima agroquímica revestida con un polímero soluble en agua o un tensioactivo apropiado se dispersa en agua. El agente SE es una formulación que incluye tanto el agente SC como el agente EW.

10 (Concentrado Emulsionable (agente EC))

15 El concentrado emulsionable es una formulación en la que se estabiliza un principio activo que tiene baja solubilidad en agua y disuelto en un disolvente orgánico, por medio de la presencia de un emulsionante tal como un tensioactivo, de forma que las partículas finas uniformes del mismo se dispersan en agua cuando se agitan en agua, y una formulación que se vuelve turbia cuando se diluye con agua.

(Polvo humectable (agente WP))

20 El polvo humectable es una formulación en la cual las partículas finas de un principio activo que tiene baja solubilidad en agua se mezclan con un carbono blanco o un tensioactivo, y la formulación se vuelve turbia cuando se diluye con agua.

(Concentrado Soluble (agente SL))

25 El concentrado soluble es una formulación líquida que contiene un principio activo soluble en agua. El concentrado soluble se usa directamente o tras dilución o disolución con agua. La dilución con agua es transparente y estable. La expresión "soluble en agua" se usa en ocasiones como expresión general de un agroquímico a diluir con agua.

30 (Polvo soluble en agua (agente SP))

35 El polvo soluble en agua es una formulación sólida en la cual el principio activo soluble en agua está como polvo o gránulo, y una formulación que se vuelve fácilmente una solución acuosa cuando se disuelve en agua. La dilución con agua del mismo es transparente y estable.

(Polvo seco (agente DP))

40 El polvo seco es una formulación que se obtiene por medio de dilución de una materia prima agroquímica con un expansor tal como una arcilla, adición de un estabilizador o similar a la dilución, según sea necesario, y posterior pulverización de la parte resultante para obtener un diámetro particular de 44 µm o menos y un diámetro promedio de partícula de aproximadamente 10 µm.

(Gránulo (agente GR))

45 El gránulo es una formulación sólida granular preparada por medio de granulado de una mezcla de una materia prima agroquímica con un expansor tal como una bentonita o un talco, o mediante absorción o revestimiento de una materia prima agroquímica con un grano hueco (únicamente un expansor). El tamaño de partícula de la misma está en el intervalo de 300 a 1700 µm.

## 50 Ejemplos

La presente invención se explica de forma adicional con detalle mostrando los ejemplos siguientes. La presente invención no está limitada a estos ejemplos. Los términos "parte" y "%" están basados en masa.

55 Las materias primas usadas se muestran a continuación.

60 Compuesto X: (1R, 5R, 7S)-7-(2-propoxi-4-(trifluorometil)fenoxi)-9-[[5-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]-9-azabicyclo[3.3.1]non-2-ino dilución de 1000 veces del líquido SC que contenía un 20 % del Compuesto X (en lo sucesivo, denominado "dilución del Compuesto X"):

Compuesto X	20,2 partes en masa
Tensioactivo	2,5 partes en masa
Polioxietilen polioxipropilen glicol	0,5 partes en masa
Propilenglicol	5,0 partes en masa

Conservante	0,3 partes en masa
Antiespumante	0,5 partes en masa
Espesante	0,2 partes en masa
Vehículo	0,5 partes en masa
Agua	970,3 partes en masa

**Ejemplo 1**

5 Se añadieron 10 mg de ácido oxálico a 50 ml de dilución del Compuesto X, y posteriormente se disolvió en el mismo para obtener una solución mixta 1.

Ejemplo comparativo 1

10 Se obtuvo una solución 1 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que la cantidad de ácido oxálico se sustituyó por 0 mg.

<Ensayo de estabilidad 1>

15 En una placa de Petri sobre la cual se colocaron 10 mg de ascorbato de sodio para simular el entorno sobre la planta, se colocaron 2 ml de solución mixta 1 para disolver el ascorbato de sodio. Se prepararon dos conjuntos de la muestra obtenida de este modo. A continuación, se secaron estas placas de petri a 40 °C durante 6 horas. Se dejó un grupo de dos conjuntos durante dos días en invernadero para obtener una placa 1 de petri de invernadero. Se dejó el otro durante dos días en un lugar oscuro a temperatura ambiente para obtener una placa 1 de petri de lugar oscuro.

20 Del mismo modo, en dos conjuntos de placas de petri se colocaron 10 mg de ascorbato de sodio, se colocaron 2 ml de solución 1 mixta comparativa sobre las placas de petri, y posteriormente se secó a 40 °C durante 6 horas. Se dejó un grupo de dos conjuntos durante dos días en invernadero para obtener una placa 1 de petri comparativa de invernadero. Se dejó el otro durante dos días en un lugar oscuro a temperatura ambiente para obtener una placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

30 Tras dejar las placas de petri, se midió la cantidad del compuesto X presente en cada placa de petri por medio de análisis cuantitativo usando HPLC. Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 1 de petri de invernadero fue de aproximadamente 7,5 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. La relación residual del compuesto X en la placa 1 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 5,8 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

35 Se confirmó a partir de la comparación del hecho de que la relación residual del compuesto X en la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro fue un 12 % con el hecho de que la relación residual en ausencia de ácido ascórbico fue de aproximadamente 100 % que la degradación avanzó. Además, se confirmó a partir de la comparación del hecho de que la relación residual del compuesto X en la placa 1 de petri comparativa de invernadero fue un 7 % con el hecho de que la relación residual en ausencia de ácido ascórbico fue de aproximadamente 93 % que la degradación avanzó.

40 Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido oxálico contribuyó a la eliminación de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

45 Nótese que la relación residual es una relación que representa la relación de abundancia antes y después de llevar a cabo el ensayo, y, por ejemplo, la relación residual del compuesto X es la relación de abundancia del compuesto X antes y después de llevar a cabo el ensayo. La relación residual se muestra con un aumento por medio de comparación de la relación residual con otra relación residual, ya que la abundancia antes del ensayo es sustancialmente constante, y por tanto el aumento indica sustancialmente un aumento de las abundancias comparadas después del ensayo. Por ejemplo, la frase "relación residual del compuesto X en la placa 1 de petri de invernadero fue de aproximadamente 7. 5 veces la de la placa 1 de petri comparativa de invernadero" significa que el valor obtenido dividiendo la cantidad residual del compuesto X en la placa 1 de petri de invernadero entre la cantidad residual del compuesto X en la placa 1 de petri comparativa de invernadero fue de aproximadamente 7,5. A continuación, la relación residual y la comparación de las relaciones residuales se usan con el mismo significado.

**Ejemplo 2**

55 Se obtuvo una solución mixta 2 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido gálico en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 2>

60

Se obtuvieron una placa 2 de petri de invernadero y una placa 2 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 2 en lugar de la solución mixta 1.

5 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 2 de petri de invernadero fue de aproximadamente 2,3 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. La relación residual del compuesto X en la placa 2 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 3,3 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

10 Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido gálico contribuyó a la eliminación de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

### Ejemplo 3

15 Se obtuvo una solución mixta 3 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido tartárico en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 3>

20 Se obtuvieron una placa 3 de petri de invernadero y una placa 3 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 3 en lugar de la solución mixta 1.

25 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 3 de petri de invernadero fue de aproximadamente 1,8 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. Además, La relación residual del compuesto X en la placa 3 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 2,3 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

30 Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia del ácido tartárico contribuyó a la eliminación de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

### Ejemplo 4

35 Se obtuvo una solución mixta 4 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó almidón en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 4>

40 Se obtuvieron una placa 4 de petri de invernadero y una placa 4 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 4 en lugar de la solución mixta 1.

45 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 4 de petri de invernadero fue de aproximadamente 2,4 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. Además, La relación residual del compuesto X en la placa 4 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 2,1 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

50 Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de almidón contribuyó a la eliminación de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

### Ejemplo 5

55 Se obtuvo una solución mixta 5 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó celulosa en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 5>

60 Se obtuvieron una placa 5 de petri de invernadero y una placa 5 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 5 en lugar de la solución mixta 1.

65 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 5 de petri de invernadero fue de aproximadamente 2,0 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. Además, La relación residual del compuesto X en la placa 5 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 1,5 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de celulosa contribuyó a la eliminación de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

**Ejemplo 6**

5 Se obtuvo una solución mixta 6 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó trimetilolpropano en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 6>

10 Se obtuvieron una placa 6 de petri de invernadero y una placa 6 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 6 en lugar de la solución mixta 1.

15 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 6 de petri de invernadero fue de aproximadamente 1,9 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. Además, La relación residual del compuesto X en la placa 6 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 1,4 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

20 Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de trimetilolpropano contribuyó a la eliminación de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

**Ejemplo 7**

25 Se obtuvo una solución mixta 7 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó sorbitol en lugar del ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 7>

30 Se obtuvo una placa 7 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 7 en lugar de la solución mixta 1.

Como resultado de ello, La relación residual del compuesto X en la placa 7 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 1,6 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

35 Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de sorbitol contribuyó a la eliminación de la hidrólisis del compuesto X.

**Ejemplo 8**

40 Se obtuvo una solución mixta 8 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó poliglicerina en lugar del ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 8>

45 Se obtuvo una placa 8 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 8 en lugar de la solución mixta 1.

50 Como resultado de ello, La relación residual del compuesto X en la placa 8 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 2,3 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de poliglicerina contribuyó a la eliminación de la hidrólisis del compuesto X.

**Ejemplo 9**

Se obtuvo una solución mixta 9 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó poli(alcohol vinílico) en lugar del ácido oxálico en el Ejemplo 1.

60 <Ensayo de estabilidad 9>

Se obtuvo una placa 9 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 9 en lugar de la solución mixta 1.

65 Como resultado de ello, La relación residual del compuesto X en la placa 9 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 1,3 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de poli(alcohol vinílico) contribuyó a la eliminación de la hidrólisis del compuesto X.

5 **Ejemplo 10**

Se obtuvo una solución mixta 10 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó glucosa en lugar del ácido oxálico en el Ejemplo 1.

10 <Ensayo de estabilidad 10>

Se obtuvo una placa 10 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 10 en lugar de la solución mixta 1.

15 Como resultado de ello, La relación residual del compuesto X en la placa 10 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 1,3 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de glucosa contribuyó a la eliminación de la hidrólisis del compuesto X.

20

**Ejemplo 11**

Se obtuvo una solución mixta 11 de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido cítrico en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

25

<Ensayo de estabilidad 11>

Se obtuvo una placa 11 de petri de lugar oscuro para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución mixta 11 en lugar de la solución mixta 1.

30

Como resultado de ello, La relación residual del compuesto X en la placa 11 de petri de lugar oscuro fue de aproximadamente 1,2 veces la placa 1 de petri comparativa de lugar oscuro.

Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de ácido cítrico contribuyó a la eliminación de la hidrólisis del compuesto X.

35

Ejemplo comparativo 2

Se obtuvo una solución 2 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó glicerina en lugar del ácido oxálico en el Ejemplo 1.

40

<Ensayo de estabilidad 12>

Se obtuvo una placa 2 de petri comparativa de invernadero para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 2 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

45

Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 2 de petri de invernadero fue de aproximadamente 0,3 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero.

50

Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de glicerina contribuyó a la promoción de la fotólisis del compuesto X.

Ejemplo comparativo 3

55

Se obtuvo una solución 3 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido acético en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 13>

60

Se obtuvieron una placa 3 de petri de invernadero comparativa y una placa 3 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 3 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

65 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 3 de petri de invernadero fue de aproximadamente 0,6 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. La relación residual del compuesto X en



la placa 3 de petri de lugar oscuro comparativa fue de aproximadamente 0,6 veces la placa 1 de petri de lugar oscuro comparativa.

5 Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido acético contribuyó a la promoción de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

Ejemplo comparativo 4

10 Se obtuvo una solución 4 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido aconítico en lugar del ácido oxálico del Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 14>

15 Se obtuvieron una placa 4 de petri de invernadero comparativa y una placa 4 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 4 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

20 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 4 de petri de invernadero fue de aproximadamente 0,3 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. La relación residual del compuesto X en la placa 4 de petri de lugar oscuro comparativa fue de aproximadamente 0,6 veces la placa 1 de petri de lugar oscuro comparativa.

25 Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido aconítico contribuyó a la promoción de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

Ejemplo comparativo 5

30 Se obtuvo una solución 5 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido succínico en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 16>

35 Se obtuvieron una placa 5 de petri de invernadero comparativa y una placa 5 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 5 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

40 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 5 de petri de invernadero fue de aproximadamente 0,6 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. La relación residual del compuesto X en la placa 5 de petri de lugar oscuro comparativa fue de aproximadamente 0,6 veces la placa 1 de petri de lugar oscuro comparativa.

45 Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido succínico contribuyó a la promoción de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

Ejemplo comparativo 6

50 Se obtuvo una solución 6 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido tereftálico en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 16>

55 Se obtuvo una placa 6 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 6 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

60 Como resultado de ello, La relación residual del compuesto X en la placa 6 de petri de lugar oscuro comparativa fue de aproximadamente 0,6 veces la placa 1 de petri de lugar oscuro comparativa.

65 Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de ácido tereftálico contribuyó a la promoción de la hidrólisis del compuesto X.

Ejemplo comparativo 7

Se obtuvo una solución 7 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido adípico en lugar del ácido oxálico del Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 17>

5 Se obtuvieron una placa 7 de petri de invernadero comparativa y una placa 7 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 7 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

10 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 7 de petri de invernadero fue de aproximadamente 0,7 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. La relación residual del compuesto X en la placa 7 de petri de lugar oscuro comparativa fue de aproximadamente 0,5 veces la placa 1 de petri de lugar oscuro comparativa.

Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido adípico contribuyó a la promoción de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

15 Ejemplo comparativo 8

Se obtuvo una solución 8 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido malónico en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

20 <Ensayo de estabilidad 18>

25 Se obtuvo una placa 8 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 8 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

Como resultado de ello, La relación residual del compuesto X en la placa 8 de petri de lugar oscuro comparativa fue de aproximadamente 0,5 veces la placa 1 de petri de lugar oscuro comparativa.

30 Se confirmó a partir de los resultados anteriores que la presencia de ácido malónico contribuyó a la promoción de la hidrólisis del compuesto X.

Ejemplo comparativo 9

35 Se obtuvo una solución 9 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido acrílico en lugar del ácido oxálico del Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 19>

40 Se obtuvieron una placa 9 de petri de invernadero comparativa y una placa 9 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 9 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

45 Como resultado de ello, la relación residual del compuesto X en la placa 9 de petri de invernadero fue de aproximadamente 0,6 veces la placa 1 de petri comparativa de invernadero. La relación residual del compuesto X en la placa 9 de petri de lugar oscuro comparativa fue de aproximadamente 0,3 veces la placa 1 de petri de lugar oscuro comparativa.

50 Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido acrílico contribuyó a la promoción de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

Ejemplo comparativo 10

55 Se obtuvo una solución 10 mixta comparativa de la misma manera que en el Ejemplo 1, exceptuando que se usó ácido ftálico en lugar de ácido oxálico en el Ejemplo 1.

<Ensayo de estabilidad 20>

60 Se obtuvieron una placa 10 de petri de invernadero comparativa y una placa 10 de petri de lugar oscuro comparativa para llevar a cabo el ensayo de estabilidad de la misma manera que en el ensayo de estabilidad 1, exceptuando que se usó la solución 10 mixta comparativa en lugar de la solución mixta 1.

Como resultado de ello, el compuesto X no se detectó en la placa 10 de petri de invernadero comparativa y la placa 10 de petri de lugar oscuro comparativa, y se confirmó que el compuesto X estaba ausente en las mismas.

65 Se confirmó a partir de los resultados que la presencia del ácido ftálico contribuyó a la promoción de la fotólisis e hidrólisis del compuesto X.

**Ejemplo 12**

5 Se mezclaron bien 20,2 partes del compuesto X, 2,5 partes de poli(éter de triestirilfenilo) POE, 0,5 partes de copolímero de bloques POE/POP, 5 partes de propilen glicol, 0,5 partes de antiespumante, 0,3 partes de un conservante, y 21,4 partes de agua.

10 Se molió la mezcla en húmedo usando un molino de perlas (DYNO-MILLA RESEARCH LAB: fabricado por Shinmaru Enterprises Corporation) usando perlas de circonio.

15 Se añadieron 19,7 partes de una solución acuosa al 1 % de goma de xantano, 9,9 partes de suspensión acuosa de bentonita al 5 %, y 20 partes de trimetilolpropano (que es el aditivo divulgado en el Ejemplo 6) al producto pulverizado, y se mezcló bien para obtener una composición agroquímica en estado de suspensión acuosa uniforme (formulación 1).

(Ensayo de estabilidad)

20 Se diluyó la formulación con agua 2000 veces, y posteriormente se pulverizó sobre manzanas. Se recogieron 5 hojas de manzana inmediatamente después de la pulverización, o 4 días, 7 días o 14 días después de la pulverización, se lavaron la superficie frontal y la superficie trasera de las mismas con 10 ml de acetonitrilo, y posteriormente se sometieron 40  $\mu$ l del líquido de lavado a HPLC. Se midió el área de pico atribuible al compuesto X. Se midieron las áreas de las hojas de manzana tras el lavado usando un planímetro (planímetro automático tipo AAM-8: fabricado por Hayashi Denko co., Ltd.). Se convirtió el área de pico en área de pico por cada 1 cm<sup>2</sup> de hoja. Se determinó el área de pico por 1 cm<sup>2</sup> de hoja inmediatamente después de la pulverización como un 100 %, y se calculó el área de pico por cada 1 cm<sup>2</sup> de hoja 4 días, 7 días o 14 días después de la pulverización, con respecto al área de pico por cada 1 cm<sup>2</sup> de hoja inmediatamente después de la pulverización, como la relación residual del compuesto X (%).

25 Los resultados del ensayo de estabilidad se muestran en la Tabla 1. Incluso 14 días después de la pulverización, quedó aproximadamente un 90 % del compuesto X.

30

**Ejemplo 13**

35 Se mezclaron bien 20,2 partes del compuesto X, 2,5 partes de poli(éter de triestirilfenilo) POE, 0,5 partes de copolímero de bloques POE/POP, 5 partes de propilen glicol, 0,5 partes de antiespumante, 0,3 partes de un conservante, y 36 partes de agua.

Se molió la mezcla en húmedo usando un molino de perlas (DYNO-MILLA RESEARCH LAB: fabricado por Shinmaru Enterprises Corporation) usando perlas de circonio.

40 Se añadieron 20 partes de una solución acuosa al 1 % de goma de xantano, 10 partes de suspensión acuosa de bentonita al 5 %, y 5 partes de una sal de sodio de copolímero de 2,4,4-trimetilpenteno-ácido maleico al producto pulverizado, y se mezcló bien para obtener una composición agroquímica en estado de suspensión acuosa uniforme (formulación 2).

45 Se llevó a cabo el ensayo de estabilidad de la misma forma que el Ejemplo 12. Los resultados se muestran en la Tabla 1. Quedó aproximadamente un 64 % del compuesto X incluso 14 días después de la pulverización.

**Ejemplo 14**

50 Se mezclaron bien 20,2 partes del compuesto X, 2,5 partes de poli(éter de triestirilfenilo) POE, 0,5 partes de copolímero de bloques POE/POP, 5 partes de propilen glicol, 0,5 partes de antiespumante, 0,3 partes de un conservante, y 21,4 partes de agua.

55 Se molió la mezcla en húmedo usando un molino de perlas (DYNO-MILLA RESEARCH LAB: fabricado por Shinmaru Enterprises Corporation) usando perlas de circonio.

60 Se añadieron 16,4 partes de una solución acuosa al 1 % de goma de xantano, Se añadieron 8,2 partes de una solución acuosa al 5 % de bentonita, 20 partes de trimetilolpropano y 5 partes de una sal de sodio de copolímero de 2,4,4-trimetilpentano-ácido maleico al producto pulverizado, y se mezcló bien para obtener una composición agroquímica acuosa en estado de suspensión (formulación 3).

Se llevó a cabo el ensayo de estabilidad de la misma forma que el Ejemplo 13. Los resultados se muestran en la Tabla 1. Quedó aproximadamente un 74 % del compuesto X incluso 14 días después de la pulverización.

65 Ejemplo comparativo 11

## ES 2 711 734 T3

Se mezclaron bien 20,2 partes del compuesto X, 2,5 partes de poli(éter de triestirilfenilo) POE, 0,5 partes de copolímero de bloques POE/POP, 5 partes de propilen glicol, 0,5 partes de antiespumante, 0,3 partes de un conservante, y 41 partes de agua.

5 Se molió la mezcla en húmedo usando un molino de perlas (DYNO-MILLA RESEARCH LAB: fabricado por Shinmaru Enterprises Corporation) usando perlas de circonio.

10 Se añadieron 20 partes de solución acuosa de goma de xantano al 1 % y 10 partes de suspensión acuosa de bentonita al 5 % al producto pulverizado y se mezcló bien para obtener una composición agroquímica acuosa en estado de suspensión (formulación 4).

Se llevó a cabo el ensayo de estabilidad de la misma forma que el Ejemplo 13. Los resultados se muestran en la Tabla 1. Se redujo aproximadamente un 52 % del compuesto X 14 días después de la pulverización.

Tabla 1

	Área de pico por 1 cm <sup>2</sup> de hoja					Relación residual (%)			
	Inmediatamente después de la pulverización	4 días después de la pulverización	7 días después de la pulverización	14 días después de la pulverización	Inmediatamente después de la pulverización	4 días después de la pulverización	7 días después de la pulverización	14 días después de la pulverización	
Formulación 1	7399	7191	5582	6655	100	97,2	75,4	89,9	
Formulación 2	6929	6731	6131	4443	100	97,1	88,5	64,1	
Formulación 3	6393	6532	5456	4732	100	102,2	85,3	74,0	
Formulación 4	7477	6007	4750	3613	100	80,3	63,5	48,3	

Se confirmó a partir de la comparación de los resultados de las formulaciones 1 y 3 con los de la formulación 4, que la presencia de trimetilolpropano contribuyó a la mejora de estabilidad del compuesto X.

5 Además, Se confirmó a partir de la comparación de los resultados de las formulaciones 2 y 3 con los de la formulación 4, que la presencia de poli(ácido carboxílico) contribuyó a la mejora de estabilidad del compuesto X.

Se confirmó particularmente a partir del resultado de la formulación 3 que los efectos de supresión de la degradación inicial del compuesto X se exhiben en gran medida con la coexistencia del trimetilolpropano y poli(ácido carboxílico).

#### 10 **Aplicabilidad industrial**

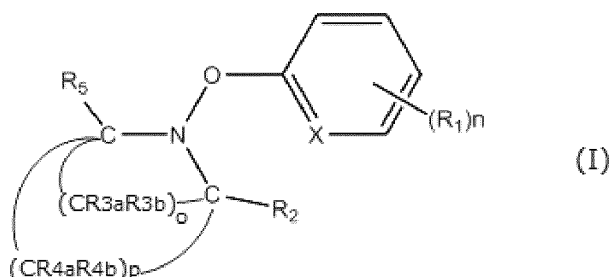
15 La composición agroquímica de acuerdo con la presente invención exhibe una relación residual elevada de un compuesto que tiene una estructura de azabicyclo como principio activo agroquímico después de la pulverización. El uso de la composición agroquímica de acuerdo con la presente invención hace posible exhibir un efecto acaricida durante un período a largo plazo para controlar los ácaros nocivos para los cultivos agrícolas.

## REIVINDICACIONES

1. Una composición agroquímica que comprende:

- 5 un componente (A): un compuesto representado por la fórmula (I) o una de sus sales; y  
 un componente (B): un compuesto representado por la fórmula (II); al menos uno seleccionado entre el grupo  
 que consiste en ácido oxálico, un ácido gálico, un ácido tartárico, un almidón, una celulosa, un sorbitol, una  
 poliglicerina, un poli(alcohol vinílico), una glucosa y un ácido cítrico; o una sal de sodio de un copolímero de  
 2,4,4-trimetilpenteno de ácido maleico,

10



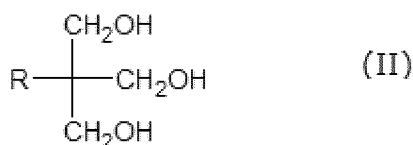
en la que

15

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3a</sub>, R<sub>3b</sub>, R<sub>4a</sub>, R<sub>4b</sub> y R<sub>5</sub> representan cada uno de forma independiente un átomo de hidrógeno, un grupo  
 alquilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno  
 C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquino C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo hidroxilo, un grupo  
 alcoxi C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalcoxi C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno  
 C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquino C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo carboxilo, un grupo  
 acilo C1-7 sustituido o no sustituido, un grupo alcoxycarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo  
 cicloalquiloalcoxycarbonilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alquenoalcoxycarbonilo C2-6 sustituido o no  
 sustituido, un grupo alquinoalcoxycarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo ariloalcoxycarbonilo C6-10 sustituido  
 o no sustituido, un grupo heterocicloalcoxycarbonilo sustituido o no sustituido, un grupo alcoxycarbonilo C1-7 sustituido o no  
 sustituido, un grupo alcoxycarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquiloalcoxycarbonilo C3-8  
 sustituido o no sustituido, un grupo alquenoalcoxycarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinoalcoxycarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo  
 alquilaminocarbonilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilaminocarbonilo C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo alquenoalquilaminocarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinoalquilaminocarbonilo C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo  
 arilaminocarbonilo C6-10 sustituido o no sustituido, un grupo heterocicloalquilaminocarbonilo sustituido o no  
 sustituido, un grupo alquilidenaminoxilo C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no  
 sustituido, un grupo heterocicloalquil sustituido o no sustituido, un grupo arilo C6-10 sustituido o no sustituido, un  
 grupo heterocicloalquilo sustituido o no sustituido, un grupo sulfonilo sustituido, un grupo aminocarbonilo sustituido  
 o no sustituido, un grupo ciano, un grupo nitro o un grupo halógeno,

35

n representa un número de R<sub>1</sub> y es un número entero de 0 a 4,  
 q representa un número de (CR<sub>3a</sub>R<sub>3b</sub>) y es un número entero de 2 a 4,  
 p representa un número de (CR<sub>4a</sub>R<sub>4b</sub>) y es un número entero de 2 a 4, y  
 X representa un átomo de carbono o un átomo de nitrógeno,

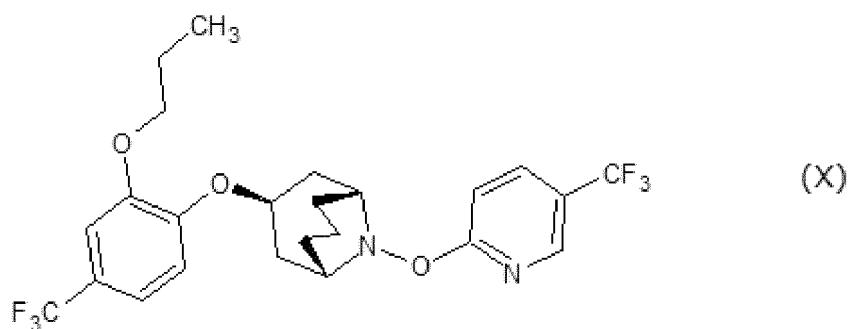


40

en la que R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-4, un grupo alqueno C2-4 o un grupo alquino C2-4.

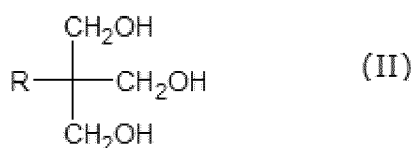
2. La composición agroquímica e acuerdo con la reivindicación 1, en la que el componente (A) es un compuesto representado por la fórmula (X):

45



3. La composición agroquímica de acuerdo con la reivindicación 1, en la que el componente (B) es un compuesto representado por la fórmula (II):

5



en la que R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-4, un grupo alqueno C2-4 o un grupo alquino C2-4.

10

4. La composición agroquímica de acuerdo con la reivindicación 1, en la que el componente (B) es al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en ácido oxálico, un ácido gálico, un ácido tartárico, un almidón, una celulosa, un sorbitol, una poliglicerina, un poli(alcohol vinílico), una glucosa y un ácido cítrico.

15

5. La composición agroquímica de acuerdo con las reivindicaciones 3 o 4, que comprende además una sal de sodio de copolímero de 2,4,4-trimetilpenteno-ácido maleico.

20

6. La composición agroquímica de acuerdo con las reivindicaciones 3 o 4, en donde, con respecto a una masa total de la composición agroquímica, una cantidad del componente (A) es de un 1 a un 50 % en masa, una cantidad del componente (B) es de un 1 a un 40 % en masa, y una relación en masa del componente (A)/el componente (B) es de 20/1 a 1/20.

7. Una composición agroquímica de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la composición agroquímica está en estado de suspensión acuosa.