

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 375 223**

51 Int. Cl.:

<b>C07D 231/14</b>	(2006.01)	<b>C07D 213/82</b>	(2006.01)
<b>C07D 213/81</b>	(2006.01)	<b>C07D 333/38</b>	(2006.01)
<b>C07D 285/06</b>	(2006.01)	<b>C07C 211/52</b>	(2006.01)
<b>C07D 239/28</b>	(2006.01)	<b>C07C 215/68</b>	(2006.01)
<b>C07D 307/68</b>	(2006.01)	<b>C07C 217/76</b>	(2006.01)
<b>C07D 277/56</b>	(2006.01)	<b>A01N 37/22</b>	(2006.01)
<b>C07D 261/18</b>	(2006.01)	<b>A01N 43/40</b>	(2006.01)
<b>C07D 275/02</b>	(2006.01)	<b>A01N 43/56</b>	(2006.01)
<b>C07D 333/40</b>	(2006.01)		
<b>C07D 207/416</b>	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **02730796 .6**
- 96 Fecha de presentación: **30.05.2002**
- 97 Número de publicación de la solicitud: **1400516**
- 97 Fecha de publicación de la solicitud: **24.03.2004**

54 Título: **DERIVADOS DE ANILIDA SUBSTITUIDOS, INTERMEDIARIOS DE LOS MISMOS, PRODUCTOS QUÍMICOS AGRÍCOLAS Y HORTÍCOLAS Y SU UTILIZACIÓN.**

30 Prioridad:  
**31.05.2001 JP 2001164787**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**27.02.2012**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**27.02.2012**

73 Titular/es:  
**NIHON NOHYAKU CO., LTD.  
2-5, NIHONBASHI 1-CHOME, CHUO-KU  
TOKYO 103-8236, JP**

72 Inventor/es:  
**FURUYA, Takashi;  
YAMAGUCHI, Minoru;  
TOHNISHI, Masanori;  
SEO, Akira;  
MORIMOTO, Masayuki;  
TAKEMOTO, Tsuyoshi y  
FUJIOKA, Shinsuke**

74 Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 375 223 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

Derivados de anilida substituidos, intermediarios de los mismos, productos químicos agrícolas y hortícolas y su utilización

5

**Campo técnico**

La presente invención se relaciona con derivados de anilida substituidos, intermediarios de los mismos, un producto químico agrícola y hortícola, en particular un insecticida o acaricida agrícola y hortícola, que contiene dicho compuesto como principio activo y la utilización del producto químico.

10

**Técnica anterior**

JP-A-5-221994 y JP-A-10-251240 describen la utilidad de compuestos análogos al derivado de anilida substituido de la presente invención como fungicidas agrícolas y hortícolas.

15

La producción de cultivos agrícolas y hortícolas y similares sufre aún un grave perjuicio debido a plagas de insectos y similares, y se desea desarrollar un nuevo producto químico agrícola y hortícola, en particular un insecticida agrícola y hortícola, a causa de, por ejemplo, la aparición de plagas de insectos resistentes a los productos químicos existentes. Además, debido a la mayor población de granjeros ancianos y similares, se desean diversos métodos de aplicación que ahorren trabajo y se desea el desarrollo de un producto químico agrícola y hortícola que tenga propiedades adecuadas para los métodos de aplicación.

20

**Descripción de la invención**

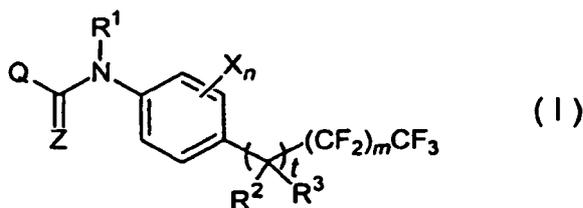
25

Los presentes inventores investigaron con gran seriedad con objeto de desarrollar un nuevo producto químico agrícola y hortícola y consiguientemente vieron que el derivado de anilina substituido representado por la fórmula general (II) de la presente invención es un nuevo compuesto no conocido en literatura alguna, el cual es un intermediario útil para la producción de diversos derivados que tienen actividad fisiológica como medicina, agroquímico o similares, y que un derivado de anilida substituido de fórmula general (I) derivado de dicho compuesto es un nuevo compuesto no conocido en literatura alguna y útil como producto químico agrícola y hortícola, en particular, un insecticida o acaricida agrícola y hortícola, habiéndose logrado así la presente invención.

30

Es decir, la presente invención se relaciona con un derivado de anilida substituido representado por la fórmula general (I):

35



(donde R<sup>1</sup> es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo fenilo o un grupo fenilo substituido que tiene uno o más substituyentes que pueden ser iguales o diferentes y son seleccionados entre átomos de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, grupos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquiltío (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquiltío (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos monoalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, grupos dialquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino cuyos grupos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) pueden ser iguales o diferentes y grupos alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo;

45

R<sup>2</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

R<sup>3</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

t es 1 y m es un número entero de 0 a 6;

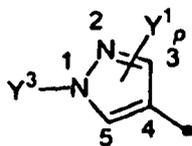
X es un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

50

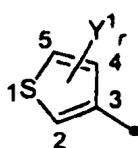
n es un número entero de 1 a 4;

Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, y

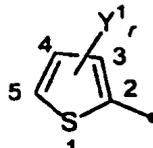
Q es un substituyente representado por cualquiera de las fórmulas Q9, Q14, Q15:



Q9

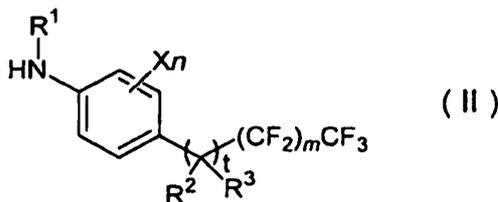


Q14



Q15

- 5 (donde cada uno de los  $Y^1$ , que pueden ser iguales o diferentes, es un átomo de halógeno o un grupo alquilo ( $C_1$ - $C_2$ );  
 $Y^3$  es un grupo alquilo ( $C_1$ - $C_3$ ) o un grupo fenilo, 3  
 p es un número entero de 0 a 2;  
 y r es un número entero de 0 a 3)), con un producto químico agrícola y hortícola y con su utilización. Más aún, la  
 10 presente invención se relaciona con el uso de un derivado de anilina substituido representado por la fórmula general (II):



- 15 (donde  $R^1$  es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo ( $C_1$ - $C_6$ ), un grupo haloalquilo ( $C_1$ - $C_6$ ), un grupo fenilo o un grupo fenilo substituido que tiene uno o más substituyentes que son iguales o diferentes y son seleccionados entre átomos de halógeno, grupo ciano, grupo nitro, grupos alquilo ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos haloalquilo ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos alcoxi ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos haloalcoxi ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos alquiltío ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos haloalquiltío ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos alquilsulfínilo ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos haloalquilsulfínilo ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos alquilsulfonilo ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos haloalquilsulfonilo ( $C_1$ - $C_6$ ), grupos monoalquil( $C_1$ - $C_6$ )amino, grupos dialquil( $C_1$ - $C_6$ )amino cuyos grupos alquilo ( $C_1$ - $C_6$ ) pueden ser iguales o diferentes y grupos alcoxi( $C_1$ - $C_6$ )carbonilo;  
 20  $R^2$  es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo ( $C_1$ - $C_6$ );  
 $R^3$  es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi ( $C_1$ - $C_2$ );  
 t es 1 y m es un número entero de 0 a 6;  
 25 X es un grupo alquilo ( $C_1$ - $C_8$ ),  
 y n es un número entero de 1 a 4),  
 como compuesto intermediario para la producción de un derivado de anilida substituido.

### Modo de realización de la invención

- 30 En la definición de la fórmula general (I) mostrada para el derivado de anilida substituido de la presente invención, el término "átomo de halógeno" significa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un átomo de flúor. En la definición, "n-" es un prefijo para "normal", "s-" es un prefijo para "secundario", "t-" es un prefijo para "terciario" e "i-" es un prefijo para "iso". El término "alquilo ( $C_1$ - $C_6$ )" significa un grupo alquilo lineal o ramificado de 1 a 6 átomos de carbono, tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, n-hexilo o similar. El término "haloalquilo ( $C_1$ - $C_6$ )" significa un grupo alquilo substituido y lineal o ramificado de 1 a 6 átomos de carbono que tiene como substituyente(s) uno o más átomos de halógeno, que pueden ser iguales o diferentes. El término "cicloalquilo ( $C_3$ - $C_6$ )" significa un grupo alquilo cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o similar.  
 35  
 40

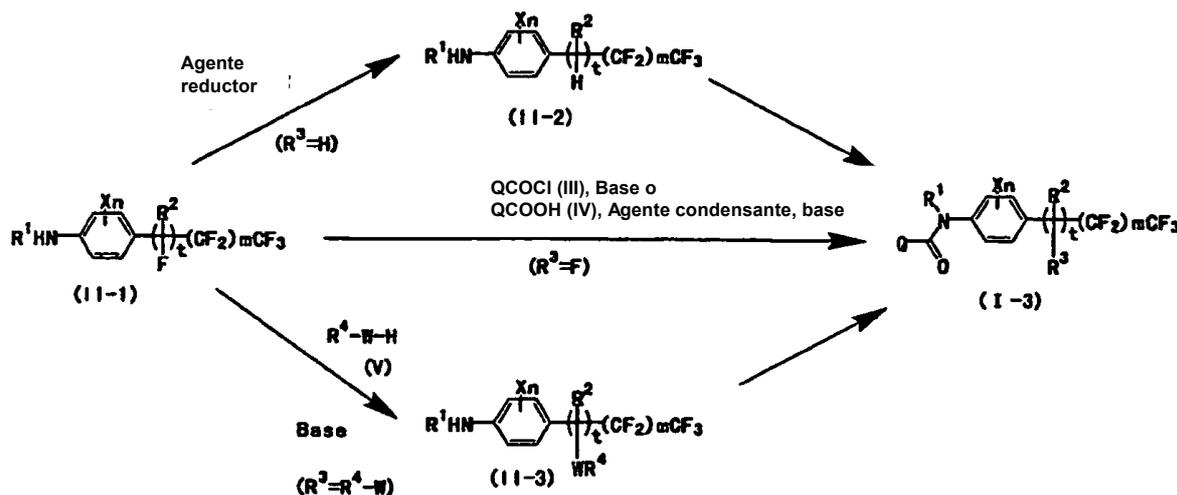
El término "grupo heterocíclico" significa un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que tiene uno o más heteroátomos seleccionados entre átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno. El grupo heterocíclico incluye, por ejemplo, un grupo piridilo, un grupo piridino-N-óxido, un grupo pirimidinilo, un grupo furilo, un grupo tetrahydrofurilo, un grupo tienilo, un grupo tetrahydrotienilo, un grupo tetrahydropiranilo, un grupo tetrahydrotiopiranilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo triazolilo y un grupo pirazolilo. El "anillo fusionado" incluye, por ejemplo, naftaleno, tetrahydronaftaleno, indeno, indano, quinolina, quinazolina, indol, indolina, cromano, isocromano, benzodioxano, benzodioxol, benzofurano, dihydrobenzofurano, benzotiofeno, dihydrobenzotiofeno, benzoxazol, benzotiazol, bencimidazol e indazol.

El derivado de anilida sustituido de fórmula general (I) de la presente invención contiene uno o más centros asimétricos en su fórmula estructural en algunos casos y tiene dos o más isómeros ópticos y diastereómeros en algunos casos. La presente invención incluye también todos los isómeros ópticos individuales y mezclas consistentes en estos isómeros en cualquier proporción. El derivado de anilida sustituido de fórmula general (I) de la presente invención tiene dos isómeros geométricos debido a un doble enlace carbono-carbono en su fórmula estructural en algunos casos. La presente invención incluye también todos los isómeros geométricos individuales y mezclas consistentes en estos isómeros en cualquier proporción.

En el derivado de anilida sustituido de fórmula general (I) de la presente invención, Q es preferiblemente Q9, Q14 y Q15, en particular preferiblemente Q9; Y<sup>1</sup> es preferiblemente un átomo de halógeno o un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>), en particular preferiblemente un grupo 3,5-dimetilo; Y<sup>3</sup> es preferiblemente un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o un grupo fenilo, en particular preferiblemente un grupo metilo; X<sub>n</sub> es preferiblemente un grupo alquilo (C<sub>5</sub>-C<sub>7</sub>) en la posición 2, en particular preferiblemente un grupo alquilo C<sub>6</sub> en la posición 2; Z es en particular preferiblemente un átomo de oxígeno; R<sup>1</sup> es en particular preferiblemente un átomo de hidrógeno; R<sup>2</sup> es en particular preferiblemente un grupo trifluorometilo; R<sup>3</sup> es preferiblemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>), en particular preferiblemente un átomo de hidrógeno; m es en particular preferiblemente 0; y t es en particular preferiblemente 1.

Se describen a continuación procedimientos típicos de producción del derivado de anilida sustituido representado por la fórmula general (I) de la presente invención, pero no están destinados en modo alguno a limitar el alcance de la presente invención.

Procedimiento de producción 1.



donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X, m, n, t y Q son como se ha definido anteriormente, R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido o un grupo fenilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), y W es -O-, -S- o -N(R<sup>4</sup>)-, donde R<sup>4</sup> es como se ha definido anteriormente.

Se puede producir un derivado de anilida sustituido (I-3), es decir, un derivado de anilida sustituido de fórmula general (I) en donde Z es O, dejando que un derivado de anilina de cualquiera de las fórmulas generales (II-1) a (II-3) reaccione con un cloruro de ácido carboxílico heterocíclico de fórmula general (III) en un solvente inerte en presencia o ausencia de una base, o dejando que un derivado de anilina de cualquiera de las fórmulas generales (II-

1) a (II-3) reaccione con un ácido carboxílico heterocíclico de fórmula general (IV) en un solvente inerte en presencia de un agente condensante y en presencia o ausencia de una base. Se puede llevar a cabo la producción por cualquier procedimiento convencional de producción de una amida.

5 El derivado de anilina de fórmula general (II-2) puede ser producido reduciendo el derivado de anilina de fórmula general (II-1) en un solvente inerte en presencia de un agente reductor.

10 El derivado de anilina de fórmula general (II-3) puede ser producido dejando que el derivado de anilina de fórmula general (II-1) reaccione con un derivado alcohólico, un derivado tiólico o un derivado amina de fórmula general (V) en un solvente inerte en presencia o ausencia de una base.

Fórmula general (II-1) → fórmula general (II-2)

15 El agente reductor utilizable en esta reacción incluye, por ejemplo, hidruros metálicos, tales como hidruro de litio y aluminio, hidruro de litio y boro, hidruro de sodio y boro, hidruro de diisobutilaluminio, hidruro de sodio y bis(2-metoxietoxi)aluminio, etc.; y metales o sales metálicas, tales como litio metálico, etc. En cuanto a la cantidad del agente reductor utilizado, el agente reductor puede ser utilizado en una cantidad apropiadamente seleccionada en el rango de 1 equivalente a equivalentes en exceso por equivalente del derivado de anilina de fórmula general (II-1).

20 Como solvente inerte utilizado en la reacción, se puede usar cualquier solvente inerte en la medida en que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción. Se pueden ejemplificar solventes inertes que incluyen, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, etc.; hidrocarburos halogenados, tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, etc.; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, etc.; y éteres acíclicos o cíclicos, tales como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, etc. Estos solventes inertes pueden ser usados solos o como una mezcla de los mismos.

25 En cuanto a la temperatura de reacción, la reacción puede ser llevada a cabo a una temperatura de desde la temperatura ambiente hasta el punto de ebullición del solvente inerte utilizado. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc., la reacción puede ser llevada a cabo durante un período de varios minutos a 50 horas.

30 Tras completarse la reacción, se aísla el compuesto deseado del sistema de reacción que contiene el compuesto deseado por un método convencional y, si es necesario, se purifica por recristalización, cromatografía en columna, etc., mediante lo cual se puede producir el compuesto deseado. Se puede someter el compuesto deseado a la etapa de reacción siguiente sin aislamiento del sistema de reacción.

Fórmula general (II-1) → fórmula general (II-3)

35 La base utilizable en esta reacción incluye hidruros metálicos, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, etc.; alcoholatos metálicos, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, t-butóxido de potasio, etc.; y alquil-metales, tales como n-butillitio, s-butillitio, t-butillitio, etc. En cuanto a la cantidad de la base utilizada, la base puede ser utilizada en una cantidad apropiadamente seleccionada en el rango de 1 equivalente a un exceso de equivalentes por equivalente del derivado de anilina de fórmula general (II-1).

40 Como solvente inerte utilizado en la reacción, se puede usar cualquier solvente inerte en la medida en que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción. Se pueden ejemplificar solventes inertes que incluyen, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, etc.; alcoholes, tales como metanol, etanol, etc.; y éteres acíclicos o cíclicos, tales como éter dietílico, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, etc. Estos solventes inertes pueden ser usados solos o como una mezcla de los mismos.

45 En cuanto a la temperatura de reacción, la reacción puede ser llevada a cabo a una temperatura de -70°C al punto de ebullición del solvente inerte empleado. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc., la reacción puede ser llevada a cabo durante un período de varios minutos a 50 horas.

50 Tras completarse la reacción, se aísla el compuesto deseado del sistema de reacción que contiene el compuesto deseado por un método convencional y, si es necesario, se purifica por recristalización, cromatografía en columna, etc., mediante lo cual se puede producir el compuesto deseado. Se puede someter el compuesto deseado a la siguiente etapa de reacción sin aislarlo del sistema de reacción.

55 Fórmula general (II-1), fórmula general (II-2) o fórmula general (II-3) → fórmula general (I-3)

60 El agente condensante utilizado en esta reacción incluye, por ejemplo, cianofosfonato de dietilo (DEPC),

carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), ésteres del ácido clorocarbónico y yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio.

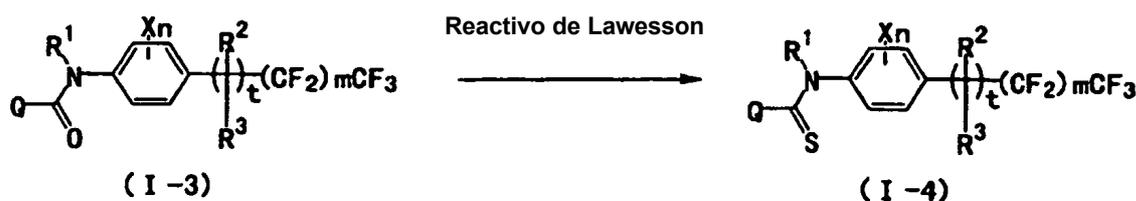
5 Como base utilizada en la reacción, se pueden poner como ejemplos bases inorgánicas o bases orgánicas. Las bases inorgánicas incluyen, por ejemplo, hidróxidos de átomos de metales alcalinos, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, etc.; hidruros de metales alcalinos, tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio, etc.; sales de metales alcalinos de alcoholes, tales como etóxido de sodio, t-butóxido de potasio, etc.; y carbonatos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno carbonato de sodio, etc. Las bases orgánicas incluyen, por ejemplo, trietilamina, piridina y DBU. En cuanto a la cantidad de base utilizada, se puede utilizar la base en una cantidad apropiadamente seleccionada en el rango de 1 mol a un exceso de moles por mol del derivado de ácido carboxílico heterocíclico de fórmula general (IV).

15 Como solvente inerte utilizado en la reacción, se puede usar cualquier solvente inerte en la medida en que no inhiba marcadamente el progreso de la reacción. Se pueden poner como ejemplos solventes inertes que incluyen hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, etc.; hidrocarburos halogenados, tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, etc.; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, etc.; éteres acíclicos o cíclicos, tales como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, etc.; ésteres, tales como acetato de etilo, etc.; amidas, tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, etc.; sulfóxido de dimetilo; 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; acetona; metil etil cetona; y similares. Estos solventes inertes pueden ser usados solos o como una mezcla de los mismos.

25 Como la reacción es una reacción equimolar, es suficiente con utilizar los reactivos en cantidades equimolares, aunque cualquiera de ellos puede ser utilizado en exceso. En cuanto a la temperatura de reacción, la reacción puede ser llevada a cabo a una temperatura de desde la temperatura ambiente hasta el punto de ebullición del solvente inerte utilizado. Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de reacción, la temperatura de reacción, etc., la reacción puede ser llevada a cabo durante un período que varía de varios minutos a 48 horas.

30 Tras completarse la reacción, se aísla el compuesto deseado del sistema de reacción que contiene el compuesto deseado por un método convencional y, si es necesario, se purifica por recristalización, cromatografía en columna, etc., mediante lo cual se puede producir el compuesto deseado.

35 El derivado de anilina de fórmula general (II-1), es decir, el material de partida de la reacción, puede ser producido según el procedimiento de producción descrito en JP-A-11-302233 o JP-A-2001-122836. Procedimiento de producción 2.



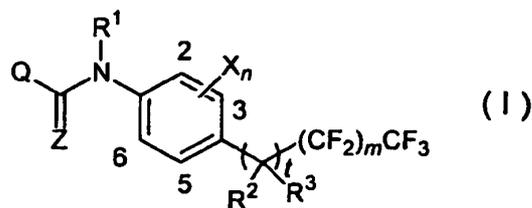
donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $n$ ,  $t$  y  $Q$  son como se ha definido anteriormente.

40 Se puede producir un derivado de anilida sustituido (I-4), es decir, un derivado de anilida sustituido de fórmula general (I) en donde  $Z$  es  $S$ , dejando que un derivado de anilida sustituido de fórmula general (I-3) reaccione con reactivo de Lawson según un método bien conocido (Tetrahedron Lett., 21(42), 4061 (1980)).

45 En las Tablas 1 a 4 se enumeran compuestos típicos como derivado de anilida sustituido de fórmula general (I) y en la Tabla 6 se enumeran compuestos típicos como derivado de anilina sustituido de fórmula general (II), pero no se pretende limitar con ellos en modo alguno el alcance de la presente invención. En las Tablas 1 a 4 y en la Tabla 6, la propiedad física es el punto de fusión ( $^{\circ}C$ ) o el índice de refracción (el valor entre paréntesis es la temperatura ( $^{\circ}C$ )) y "Me" indica un grupo metilo, "Et" un grupo etilo, "Pr" un grupo propilo, "Bu" un grupo butilo y "Ph" un grupo fenilo.

50

## Fórmula general (I)

Tabla 1 (Q=Q9, R<sup>1</sup>=H, R<sup>2</sup>=CF<sub>3</sub>, Z=O, t=1)

Nº	Xn	Y <sub>p</sub> <sup>1</sup>	Y <sup>3</sup>	m	R <sup>3</sup>	Propiedad física
1-24	2-CH(Me)CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-25	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	1,5051 (20,1)
1-26	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHCH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	1,4921 (20,2)
1-34	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Me	Me	0	H	1,4970 (19,9)
1-35	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Et	Me	0	H	35-38
1-37	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-F	Me	0	H	
1-38	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Cl	Me	0	H	
1-39	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br	Me	0	H	1,5111 (22,2)
1-40	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I	Me	0	H	Amorfo
1-45	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Me	Me	0	H	1,4790 (25,2)
1-49	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-F	Me	0	H	
1-50	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Cl	Me	0	H	
1-51	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Cl	Et	0	H	1,5110 (21,7)
1-53	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Br	Me	0	H	
1-54	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-Br	Et	0	H	1,5061
1-56	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-I	Me	0	H	119-120
1-57	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-I	Et	0	H	132-133
1-59	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	5-I	Ph	0	H	127-128
1-106	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	81-82
1-107	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	1,4958 (15,7)
1-108	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	94-96
1-109	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OEt	1,4958 (20,1)
1-110	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	F	
1-111	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	H	
1-112	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	OMe	
1-113	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	1	OEt	
1-114	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	F	1,4950 (18,4)
1-115	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	H	
1-116	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	OMe	
1-117	2-CH(Me)CH <sub>y</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Et	0	OEt	
1-118	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me	n-Pr	0	F	1,4907 (19,2)
1-119	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	n-Pr	0	H	1,4970 (17,4)
1-120	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	n-Pr	0	OMe	
1-121	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	n-Pr	0	OEt	
1-122	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	F	
1-123	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	H	
1-124	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	OMe	
1-125	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Ph	0	OEt	
1-126	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-F <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-127	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-F <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-128	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub>	3,5-F <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-129	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	Me	0	H	73
1-130	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-131	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Cl <sub>2</sub>	Et	0	H	129-130
1-148	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	Amorfo
1-149	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-150	2-CH(Me)(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-151	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub> -3-Me	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	1,4904 (25,5)

1-152	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub> -3-Me	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	1,4863 (25,5)
1-154	2-C(Me)=CHCHMe <sub>2</sub> -3-Me	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	1,4950 (25,5)
1-155	2-C(Me)=CHCHMe <sub>2</sub> -3-Me	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	1,5052 (25,2)
1-156	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-157	2-CH(Me)Ph	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-158	2-CH(Me)Ph	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-159	2-CH(Me)Ph	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-160	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	
1-161	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	
1-162	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CMe <sub>3</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	OMe	
1-163	2,3-Me <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	132-136
1-164	2,3-Me <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	167-170

Tabla 2 (Q=Q9, R<sup>1</sup>=H, Z=O, t=1)

Nº	Xn	Y <sup>1</sup> <sub>p</sub>	Y <sup>3</sup>	m	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Propiedad física
2-1	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	F	F	
2-2	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	0	H	H	
2-3	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	2	F	F	
2-4	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	2	H	H	
2-5	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	4	F	F	
2-6	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	4	H	H	
2-7	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	6	F	F	
2-8	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3,5-Me <sub>2</sub>	Me	6	H	H	

5

Tabla 3 (R<sup>1</sup>=H, R<sup>2</sup>=CF<sub>3</sub>, Z=O, m=0, t=1)

Nº	Q	Xn	Y <sup>1</sup> <sub>p,q,r</sub> o Y <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Propiedad física
3-18	Q14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Br	H	
3-19	Q14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Br	OMe	
3-20	Q14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2-Br	OEt	
3-21	Q14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-Br	H	1,,5080 (20,,4)
3-22	Q14	2-CH (Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-Br	OMe	
3-23	Q14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4-Br	OEt	
3-24	Q14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	H	
3-25	Q14	2-CH (Me) CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	OMe	
3-26	Q14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2,4-Me <sub>2</sub>	OEt	
3-28	Q15	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Cl	H	
3-29	Q15	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-Br	H	
3-30	Q15	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I	H	1,,5365 (18,,4)
3-31	Q15	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	3-I	OMe	1,,5081 (18,,5)

Tabla 4 (R<sup>1</sup>=H, R<sup>2</sup>=CF<sub>3</sub>, Z=O, m=0, t=1)

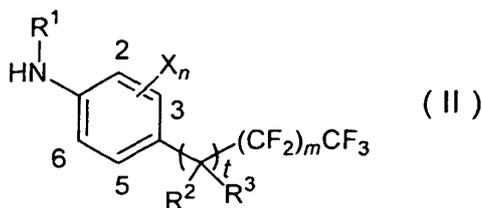
10 La Tabla 5 muestra los datos de <sup>1</sup>H-RMN de compuestos que tienen una propiedad física expresada mediante la palabra "amorfo" en las Tablas 1 a 4.

Tabla 5

Nº	<sup>1</sup> H-RMN[CDCI <sub>3</sub> /TMS, valor δ (ppm)]
1-40	8,20 (s,1H), 7,98 (s,1H), 7,90 (d,1H), 7,32-7,25 (m,2H), 4,05 (m,1H), 3,96 (s,3H), 3,20 (m,1H), 1,65-1,40 (m,3H), 1,24 (d,3H), 0,84 (m,6H)
	8,04 (d,1H), 7,87 (s,1H), 7,46-7,39 (m,2H), 1,69-1,40 (m,3H), 1,23 (d,3H), 0,84 (d,6H)
	8,01 (d,1H), 7,83 (s,1H), 7,47-7,39 (m,2H), 1,67-1,40 (m,3H), 1,30-1,20 (m,6H), 0,84 (d,6H)
	7,98 (d,1H), 7,83 (s,1H), 7,30-7,21 (m,2H), 4,04 (m,1H), 1,33-1,18 (m,6H), 0,84 (d,6H)
1-148	8,13 (d,1H), 7,50-7,40 (m,2H), 7,33 (s,1H), 3,77 (s,3H), 2,82 (m,1H), 2,54 (s,3H), 2,51 (s,3H), 1,72-1,52 (m,2H), 1,52-1,39 (m,1H), 1,27 (d,3H), 1,21-1,10 (m,1H), 1,10-0,91 (m,1H), 0,82 (d,6H)
	8,32 (s,1H), 8,20 (d,1H), 8,01 (d,1H), 7,35-7,20 (m,3H), 7,85 (d,1H), 7,31-7,20 (m,3H), 4,06 (m,1H), 2,92 (m,1H), 0,85 (m,6H)

15

## Fórmula general (II)

Tabla 6 (R<sup>1</sup>=H, t=1)

Nº	Xn	m	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	<sup>1</sup> H-RMN[CDCl <sub>3</sub> /TMS, valor δ (ppm)]
5-1	2-n-Pr	0	CF <sub>3</sub>	H	7,12-7,02 (m,2H), 6,69 (d,1H), 4,0-3,7 (m,3H), 2,52 (c, 2H), 1,27 (t,3H)
5-2	2-t-Bu	0	CF <sub>3</sub>	H	7,17 (s,1H), 7,06 (d,1H), 6,64 (d,1H), 4,1-3,9 (amplio,2H), 3,91 (m,1H), 1,41 (s,9H)
5-3	2-Ph	0	CF <sub>3</sub>	H	7,52-7,32 (m,5H), 7,19-7,10 (m,2H), 6,77 (d,1H), 4,08-3,85 (m,3H)
5-4	2-CH(Me)CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7,08-7,01 (m,2H), 6,71 (s,1H), 3,91 (m,1H), 2,50 (m,1H), 1,87 (m,1H), 1,21 (d,3H), 0,92 (d,3H), 0,87 (d,3H)
5-5	2-CH(Me)CHMe <sub>2</sub> -6-Et	0	CF <sub>3</sub>	H	6,96 (d,2H), 3,92 (m,1H), 3,85-3,70 (amplio,2H), 2,65 (m,1H), 2,53 (dd,2H), 1,80-1,50 (m,2H), 1,23 (d,3H), 0,90 (t,3H)
5-6	2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -3	0	CF <sub>3</sub>	H	7,24 (d,1H), 6,60 (d,1H), 4,41 (m,1H), 3,76 (amplio,2H), 2,70 (amplio,2H), 2,47 (amplio,2H), 1,84 (m,4H)
5-7	2-CH=CH-CH=CH-3	0	CF <sub>3</sub>	H	7,91-7,84 (m,2H), 7,68-7,47 (m,3H), 6,82 (d,1H), 4,96 (m,1H), 4,40-4,20 (amplio,2H)
5-8	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7,06-6,98 (m,2H), 6,67 (d,1H), 3,91 (m,1H), 3,85-3,70 (amplio,2H), 2,62 (m,1H), 1,78-1,50 (m,2H), 1,22 (d,3H), 0,89 (t,3H)
5-9	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7,08-7,00 (m,2H), 6,67 (d,1H), 3,91 (m,1H), 3,82-3,70 (amplio,2H), 2,71 (m,1H), 1,70-1,50 (m,2H), 1,40-1,20 (m,5H), 0,90 (t,3H)
5-10	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OMe	7,24 (s,1H), 7,16 (d,1H), 6,70 (d,1H), 4,00-3,82 (amplio,2H), 3,43 (s,3H), 2,73 (m,1H), 1,70-1,45 (m,2H), 1,40-1,20 (m,5H), 0,90 (t,3H)
5-11	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7,10-7,00 (m,2H), 6,69 (s,1H), 3,91 (m,1H), 2,80 (m,1H), 1,65-1,50 (m,2H), 1,43-1,32 (m,1H), 1,21 (d,3H), 0,89 (t,6H)
5-12	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OH	7,39 (s,1H), 7,30 (d,1H), 6,68 (d,1H), 3,90-3,60 (amplio,2H), 2,79 (m,1H), 1,61-1,50 (m,1H), 1,45-1,35 (m,1H), 1,21 (d,3H), 0,89 (c,6H)
5-13	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OMe	7,26 (s,1H), 7,15 (d,1H), 6,70 (d,1H), 4,00-3,65 (amplio,2H), 3,43 (s,1H), 2,79 (m,1H), 1,56 (m,2H), 1,37 (m,1H), 1,20 (d,3H), 0,91 (t,6H)
5-14	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	OEt	7,26 (s,1H), 7,16 (d,1H), 6,69 (d,1H), 3,98-3,67 (amplio,2H), 3,59 (c,2H), 2,80 (m,1H), 1,56 (m,2H), 1,38 (m,1H), 1,30

5-15	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	(t,3H), 1,20 (d,3H), 0,89 (t,6H) 7,08-7,00 (m,2H), 6,68 (d,1H), 3,92 (m,1H), 3,99-3,70 (amplio,2H), 2,65 (m,1H), 1,78-1,42 (m,4H), 1,30-1,10 (m,5H), 0,86 (d,6H)
5-16	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	0	CF <sub>3</sub>	H	7,26 (s,1H), 7,20 (d,1H), 6,71 (d,1H), 3,95-3,78 (amplio,2H), 2,69 (m,1H), 1,72-1,42 (m,2H), 1,40-1,18 (m,7H), 0,88 (t,3H)
5-17	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	0	H	H	6,98 (s,1H), 6,92 (d,1H), 6,65 (d,1H), 3,85-3,60 (amplio,2H), 3,24 (dd,2H), 2,79 (m,1H), 1,65-1,48 (m,2H), 1,45-1,30 (m,1H), 1,19 (d,3H), 0,90 (t,6H)
5-18	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	2	H	H	6,97 (s,1H), 6,90 (d,1H), 6,65 (d,1H), 3,82-3,40 (amplio,2H), 3,23 (t,2H), 2,79 (m,1H), 1,70-1,50 (m,2H), 1,39 (m,1H), 1,20 (d,3H), 0,90 (t,6H)
5-19	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	4	H	H	6,97 (s,1H), 6,92 (d,1H), 6,65 (d,1H), 4,00-3,70 (amplio,2H), 3,24 (t,2H), 2,79 (m,1H), 1,68-1,48 (m,2H), 1,45-1,30 (m,1H), 1,22 (d,3H), 0,89 (m,6H)
5-20	2-CH(Me)CH <sub>2</sub> CHMe <sub>2</sub>	6	H	H	6,97 (s,1H), 6,90 (d,1H), 6,65 (d,1H), 3,24 (t,2H), 2,79 (m,1H), 1,67-1,45 (m,2H), 1,42-1,30 (m,1H), 1,22 (d,3H), 0,90 (t,6H)

Se describen a continuación ejemplos típicos, ejemplos de formulación y ejemplos de ensayo de la presente invención, pero no se han de considerar como limitantes del alcance de la invención.

#### 5 Ejemplo 1-1

Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (compuesto N° 5-11)

10 Se suspendió hidruro de litio y aluminio (2 g, 52,7 mmol) en tetrahidrofurano (60 ml), seguido de adición gota a gota de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (14 g, 40,5 mmol), y se agitó la mezcla resultante a la temperatura de reflujo durante 3 horas. Se añadió agua a la mezcla de reacción en pequeñas porciones enfriando con hielo, seguido de agitación durante 10 minutos. Se añadió sulfato de magnesio y se agitó después durante 10 minutos. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado a presión reducida, para obtener 13 g del compuesto deseado.

15

Rendimiento: 98%.

#### Ejemplo 1-2

20 Producción de N-12-(1,3-dimetilbutil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]-5-cloro-1-metil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (compuesto N° 1-103)

25 Se disolvió ácido 5-cloro-1-metil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxílico (230 mg, 1 mmol) en cloruro de tionilo (2 ml) y se agitó la solución a la temperatura de reflujo durante 2 horas. Tras concentración a presión reducida, se añadió el cloruro de ácido resultante a una solución de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (330 mg, 1 mmol) y trietilamina (150 mg, 1,5 mmol) en tetrahidrofurano (10 ml) enfriando con hielo y se agitó la mezcla resultante a temperatura ambiente durante 2 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo y se lavó después con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró luego a presión reducida, y se separó el residuo resultante y se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 3:1), para obtener 233 mg del compuesto deseado.

30

Propiedad física: punto de fusión 102-104°C. Rendimiento: 43%.

#### Ejemplo 2-1

35

Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (compuesto N° 5-13)

Se disolvió sodio (533 mg, 23 mmol) en metanol (40 ml), seguido de adición de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-[1,2,2,2-

tetrafluoro-*l*-(trifluorometil)etil]anilina (2 g, 5,8 mmol), y se agitó la mezcla resultante a la temperatura de reflujo durante 3 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida y se diluyó el residuo con acetato de etilo y se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio y se concentró después a presión reducida, y se separó el residuo resultante y se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 6:1), para obtener 1,8 g del compuesto deseado.

Rendimiento: 87%.

### Ejemplo 2-2

Producción de N-{2-(1,3-dimetilbutil)-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N° 1-108)

Se disolvió ácido 1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxílico (154 mg, 1 mmol) en cloruro de tionilo (5 ml) y se calentó la solución a reflujo durante 2 horas. Se concentró la solución de reacción a presión reducida y se añadió el cloruro de ácido resultante a una solución de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (345 mg, 1 mmol) y trietilamina (150 mg, 1,5 mmol) en tetrahidrofurano (10 ml) enfriando con hielo, después de lo cual se calentó la mezcla resultante a reflujo durante 2 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo y se lavó luego con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró después a presión reducida, y se separó el residuo resultante y se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:2), para obtener 200 mg del compuesto deseado.

Propiedad física: punto de fusión 94-96°C. Rendimiento: 41%.

### Ejemplo 3-1

Producción de 2-(1-hidroxi-1,4-dimetilpentil)anilina

Se añadieron magnesio (960 mg, 40 mmol) y luego una cantidad catalítica de yodo a éter dietílico (15 ml), seguido de adición lenta de bromuro de isoamilo (6,04 g, 40 mmol) con reflujo, y se agitó la mezcla resultante a la temperatura de reflujo durante 30 minutos y luego a temperatura ambiente durante 30 minutos. Se añadió a la solución resultante 2-aminoacetofenona (1,8 g, 13,3 mmol) enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3 horas. Se añadió cloruro de amonio y se diluyó la mezcla resultante con acetato de etilo y se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio y se concentró después a presión reducida, para obtener 2,7 g de 2-(1-hidroxi-1,4-dimetilpentil)anilina.

Propiedad física: <sup>1</sup>H-RMN [CDCl<sub>3</sub>/TMS, valores δ (ppm)]

7,10-7,00 (m, 2H), 6,72-6,60 (m, 2H), 4,00-3,70 (amplio, 2H), 2,03 (m, 2H), 1,61 (s, 3H), 1,50 (m, 2H), 1,20-1,00 (m, 1H), 0,90-0,83 (m, 6H).

Rendimiento: 99%.

### Ejemplo 3-2

Producción de 2-(1,4-dimetilpentil)anilina

Después de diluir 2,7 g (13,1 moles) de la 2-(1-hidroxi-1,4-dimetilpentil)anilina obtenida en el Ejemplo 3-1 con tolueno, se añadió ácido *p*-toluensulfónico monohidrato (225 mg) y se deshidrató la mezcla resultante a reflujo a lo largo de un período de 3 horas utilizando una trampa Dean-Stark. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo y se lavó después con una solución acuosa de hidrógeno carbonato de sodio y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio y se concentró luego a presión reducida. Se disolvió el residuo resultante en etanol, seguido de adición de paladio 5%-carbono (100 mg), y se agitó la mezcla resultante bajo una atmósfera de hidrógeno a temperatura ambiente durante 12 horas. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el residuo a presión reducida, para obtener 2,2 g de 2-(1,4-dimetilpentil)anilina.

Propiedad física: <sup>1</sup>H-RMN [CDCl<sub>3</sub>/TMS, valores δ (ppm)]

7,10 (dd, 2H), 7,02 (dt, 1H), 6,79 (dt, 1H), 6,69 (dd, 1H), 3,67 (s amplio, 2H), 2,68 (m, 1H), 1,80-1,42 (m, 4H), 1,30-1,10 (m, 5H), 0,87 (d, 6H).

Rendimiento: 87%.

**Ejemplo 3-3**

Producción de 2-(1,4-dimetilpentil)-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina

5 Se disolvió la 2-(1,4-dimetilpentil)anilina (1,8 g, 9,4 mmol) obtenida en el Ejemplo 3-2 en una solución (50 ml) consistente en t-butil metil éter y agua en proporción de 1:1. Se añadieron a la solución resultante yoduro de 1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo (2,78 g, 9,4 mmol), hidrógeno sulfato de tetra-n-butilamonio (318 mg, 0,94 mmol), hidrógeno carbonato de sodio (795 mg, 9,4 mmol) y luego ditionito de sodio (1,63 g, 9,4 mmol), y se agitó la mezcla  
10 resultante a temperatura ambiente durante 12 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con hexano y se lavó dos veces con ácido clorhídrico 3N y luego con una solución acuosa de hidrógeno carbonato de sodio y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio y se concentró después a presión reducida, para obtener 3,28 g del compuesto deseado.

Propiedad física: <sup>1</sup>H-RMN [CDCl<sub>3</sub>/TMS, valores δ (ppm)]

15 7,26 (s, 1H), 7,21 (d, 1H), 6,72 (d, 1H), 4,05-3,80 (amplio, 2H), 2,67 (m, 1H), 1,78-1,40 (m, 4H), 1,30-1,00 (m, 5H), 0,85 (d, 6H).

Rendimiento: 97%.

20

**Ejemplo 3-4**

Producción de 2-(1,4-dimetilpentil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (compuesto N° 5-15)

25 Se obtuvo el compuesto deseado llevando a cabo la reacción durante 4 horas del mismo modo que en el Ejemplo 1-1, excepto por la utilización de 2-(1,4-dimetilpentil)-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina en lugar de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina.

Rendimiento: 82%.

30

**Ejemplo 3-5**

Producción de N-{2-(1,4-dimetilpentil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-5-cloro-1,3-dimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N° 1-146)

35

Se disolvió ácido 5-cloro-1,3-dimetilpirazol-4-carboxílico (349 mg, 2 mmol) en cloruro de tionilo (10 ml) y se agitó la solución a la temperatura de reflujo durante 2 horas. Tras concentración a presión reducida, se añadió el cloruro de ácido resultante a una solución de 2-(1,4-dimetilpentil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (682 mg, 2 mmol) y trietilamina (300 mg, 3 mmol) en tetrahidrofurano (20 ml) enfriando con hielo y se agitó la mezcla resultante a la  
40 temperatura de reflujo durante 2 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo y se lavó luego con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró después a presión reducida, y se separó el residuo resultante y se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 2:3), para obtener 200 mg del compuesto deseado.

45 Propiedad física: índice de refracción 1,4905 (20,4°C). Rendimiento: 41%.

**Ejemplo 4-1**

Producción de 4-yodo-2-(1,3-dimetilbutil)anilina

50

Se disolvieron en metanol 2,53 g (10 mmol) de yodo y se añadió 2-(1,3-dimetilbutil)anilina (1,77 g, 10 mmol) enfriando con hielo, después de lo cual se añadió una solución acuosa de hidrógeno carbonato de sodio (1,26 g, 15 mmol), y se agitó la mezcla resultante a 0°C durante 4 horas. Se añadió tiosulfato de sodio a la mezcla de reacción y se concentró la mezcla resultante a presión reducida, se diluyó con acetato de etilo y se lavó luego con agua. Se  
55 secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio y se separó el residuo y se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 10:1), para obtener 2,71 g del compuesto deseado.

Rendimiento: 89%.

**Ejemplo 4-2**

Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-pentafluoroetilnilina

5 Se añadieron 4-yodo-2-(1,3-dimetilbutil)anilina (1,35 g, 4,45 mmol), polvo de cobre (0,85 g, 13,4 mmol) y yoduro de pentafluoroetilo (1,42 g, 5,77 mmol) a sulfóxido de dimetilo (10 ml), y se agitó la mezcla resultante a 130°C durante 4 horas. Se filtró la mezcla a través de Celite y se diluyó el filtrado con acetato de etilo y se lavó 4 veces con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio y se concentró después a presión reducida, para obtener 1,24 g del compuesto deseado.

10 Propiedad física: <sup>1</sup>H-RMN [CDCl<sub>3</sub>/TMS, valores δ (ppm)]  
7,26 (s, 1H), 7,20 (d, 1H), 6,70 (d, 1H), 4,00-3,85 (amplio, 2H), 3,00 (m, 1H), 1,68-1,50 (m, 2H), 1,48-1,30 (m, 1H), 1,22 (t, 3H), 0,94 (m, 6H).

15 Rendimiento: 95%.

**Ejemplo 4-3**

20 Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-(2,2,2-trifluoroetil)anilina (compuesto N° 5-17)

Se disolvió hidruro de litio y aluminio (1,62 g, 4,26 mmol) en tetrahidrofurano (20 ml), seguido de adición gota a gota de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-pentafluoroetilnilina (974 mg, 3,3 mmol), y se agitó la mezcla resultante a la temperatura de reflujo durante 3 horas. Se añadió agua a la mezcla de reacción en pequeñas porciones enfriando con hielo, seguido de agitación durante 10 minutos. Se añadió sulfato de magnesio y se agitó después durante 10 minutos. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado a presión reducida, después de lo cual se separó el residuo y se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 9:1), para obtener 260 mg del compuesto deseado.

30 Rendimiento: 30%.

**Ejemplo 5-1**

Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-nonafluorobutilnilina

35 Se obtuvo el compuesto deseado llevando a cabo la reacción durante 4 horas del mismo modo que en el Ejemplo 4-2, excepto por la utilización de yoduro de nonafluorobutilo en lugar de yoduro de pentafluoroetilo.

40 Propiedad física: <sup>1</sup>H-RMN [CDCl<sub>3</sub>/TMS, valores δ (ppm)]  
7,25 (s, 1H), 7,20 (d, 1H), 6,71 (d, 1H), 4,02-3,85 (m, 2H), 2,79 (m, 1H), 1,68-1,50 (m, 2H), 1,50-1,35 (m, 1H), 1,22 (d, 3H), 0,90 (t, 6H).

45 Rendimiento: 90%.

**Ejemplo 5-2**

Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-(2,2,3,3,4,4,4-heptafluorohexil)anilina (compuesto N° 5-18)

50 Se obtuvo el compuesto deseado agitando durante 3 horas del mismo modo que en el Ejemplo 4-3, excepto por la utilización de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-nonafluorobutilnilina en lugar de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-pentafluoroetilnilina.

Rendimiento: 92%.

**Ejemplo 6-1**

Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-tridecafluorohexilanilina

60 Se obtuvo el compuesto deseado llevando a cabo la reacción durante 4 horas del mismo modo que en el Ejemplo 4-2, excepto por la utilización de yoduro de tridecafluorohexilo en lugar de yoduro de pentafluoroetilo.

Propiedad física: <sup>1</sup>H-RMN [CDCl<sub>3</sub>/TMS, valores δ (ppm)]

7,25 (s, 1H), 7,20 (d, 1H), 6,71 (d, 1H), 4,05-3,87 (m, 2H), 2,79 (m, 1H), 1,68-1,50 (m, 2H), 1,48-1,30 (m, 1H), 1,22 (d, 3H), 0,90 (t, 6H).

5

Rendimiento: 87%.

### Ejemplo 6-2

10 Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,6-undecafluorohexil)anilina (compuesto N° 5-19)

Se obtuvo el compuesto deseado agitando durante 3 horas del mismo modo que en el Ejemplo 4-3, excepto por la utilización de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-tridecafluorohexilaniлина en lugar de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-pentafluoroetilaniлина.

15 Rendimiento: 85%.

### Ejemplo 7-1

20 Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-heptadecafluorooctilaniлина

Se obtuvo el compuesto deseado llevado a cabo la reacción durante 4 horas del mismo modo que en el Ejemplo 4-2, excepto por la utilización de yoduro de heptadecafluorooctilo en lugar de yoduro de pentafluoroetilo.

25 Propiedad física: <sup>1</sup>H-RMN [CDCl<sub>3</sub>/TMS, valores δ (ppm)]

7,24 (s, 1H), 7,19 (d, 1H), 6,70 (d, 1H), 4,05-3,85 (amplio, 2H), 2,78 (m, 1H), 1,67-1,50 (m, 3H), 1,50-1,32 (m, 1H), 1,21 (d, 3H), 0,89 (t, 6H).

30 Rendimiento: 40%.

### Ejemplo 7-2

35 Producción de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,6-pentadecafluorooctil)anilina (compuesto N° 5-20)

Se obtuvo el compuesto deseado agitando durante 3 horas del mismo modo que en el Ejemplo 4-3, excepto por la utilización de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-heptadecafluorooctilaniлина en lugar de 2-(1,3-dimetilbutil)-4-pentafluoroetilaniлина.

Rendimiento: 58%.

40 Los agentes agrohorticolas, en particular los insecticidas o acaricidas agrohorticolas, que contienen el derivado de anilida substituido representado por la fórmula (I) o una sal del mismo de la presente invención como principio activo son adecuados para controlar diversas plagas de insectos, tales como plagas de insectos agrohorticolas, plagas de insectos de cereales almacenados, plagas de insectos sanitarias, nemátodos, etc., que son perjudiciales para el arroz, los árboles frutales, las hortalizas, otros cultivos, las flores, las plantas ornamentales, etc. Tienen un marcado efecto insecticida, por ejemplo, sobre LEPIDOPTERA, incluyendo la capua de los frutos (*Adoxophyes orana fasciata*), el tórtrido menor del té (*Adoxophyes sp.*), la polilla de la fruta de Manchuria (*Grapholita inopinata*), la polilla oriental del melocotón (*Grapholita molesta*), el perforador de la vaina de soja (*Leguminovora glycinivorella*), el enrollador de la hoja de la morera (*Olethreutes mori*), el enrollador de la hoja del té (*Caloptilia thevivora*), *Caloptilia sp.* (*Caloptilia zachrysa*), el minador de las hojas del manzano (*Phyllonorycter ringoniella*), el minador de la corteza del peral (*Spulerrina astaurota*), la mariposa blanca de la col (*Pieris rapae crucivora*), la oruga del tabaco (*Heliothis sp.*), gusano del manzano (*Laspeyresia pomonella*), la polilla de la col (*Plutella xylostella*), el minador del manzano (*Argyresthia conjugella*), polilla del melocotón (*Carpocapsa niponensis*), barrenador del arroz (*Chilo suppressalis*), el enrollador de las hojas del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), polilla del tabaco (*Ephestia elutella*), el pirálido de la morera (*Glyphodes pyloalis*), el perforador del arroz amarillo (*Scirpophaga incertulas*), el saltador del arroz (*Parnara guttata*), la oruga del corte del arroz (*Pseudaleitia separata*), el perforador púrpura (*Sesamia inferens*), el gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*), la gardama (*Spodoptera exigua*), etc.; HEMIPTERA, incluyendo la chicharrita (*Macrostelus fascifrons*), saltahojas verde del arroz (*Nephotettix cincticeps*), el saltamontes marrón del arroz (*Nilaparvata lugens*), el saltahojas de dorso blanco (*Sogatella furcifera*), el psílido asiático de los cítricos (*Diaphorina citri*), la mosca blanca de la vid (*Aleurolobus taonabae*), la mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*), la mosca blanca de los invernaderos (*Trialeurodes vaporariorum*), el pulgón verde opaco de la col (*Lipaphis erysimi*), el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), la cochinilla cerosa (*Ceroplastes ceriferus*), la cochinilla algodonosa de los cítricos (*Pulvinaria aurantii*), cochinilla del alcanfor (*Pseudonidia duplex*), la cochinilla de San José (*Comstockaspis perniciosus*), la cochinilla punta de flecha (*Unaspis yanonensis*), etc.; TYLENCHIDA, incluyendo los nemátodos

lesionadores de la raíz (*Pratylenchus sp.*), el escarabajo de la soja (*Anomala rufocuprea*), el escarabajo japonés (*Popillia japonica*), el barrenillo del tabaco (*Lasioderma serricorne*), la carcoma (*Lyctus brunneus*), la mariquita de veintiocho puntos (*Epilachna vigintiotopunctata*), el gorgojo sureño del frijol (*Callosobruchus chinensis*), el gorgojo de las verduras (*Listroderes costirostris*), el gorgojo del maíz (*Sitophilus zeamais*), el picudo del algodónero (*Anthonomus grandis*), el gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), el escarabajo de las hojas de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*), el escarabajo de las hojas del arroz (*Oulema oryzae*), el escarabajo pulga rayado (*Phyllotreta striolata*), el escarabajo de los brotes del pino (*Tomicus piniperda*), el escarabajo de la patata de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), la conchuela del frijol Mejicana (*Epilachna varivestis*), los gusanos de las raíces del maíz (*Diabrotica sp.*), etc.; DIPTERA, incluyendo (*Dacus (Zeugodacus) cucurbitae*), la mosca oriental (*Dacus (Bactrocera) dorsalis*), el minador de la hoja del arroz (*Agnomyza oryzae*), la mosca de la cebolla (*Delia antiqua*), la mosca de la semilla (*Delia platura*), la mosca de las agallas de las vainas de soja (*Asphondylia sp.*), la mosca doméstica (*Musca domestica*), el mosquito común (*Culex pipiens pipiens*), etc.; TYLENCHIDA, incluyendo el nemátodo lesionador de la raíz (*Pratylenchus sp.*), el nemátodo lesionador de la raíz del café (*Pratylenchus coffeae*), el nemátodo formador de quistes en la patata (*Globodera rostochiensis*), el nemátodo formador de agallas (*Meloidogyne sp.*), el nemátodo de los cítricos (*Tylenchulus semipenetrans*), *Aphelenchus sp. (Aphelenchus avenae)*, el nemátodo del crisantemo (*Aphelenchoides ritzemabosi*), etc.; y ACARINA, incluyendo el ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), la araña roja de los frutales (*Panonychus ulmi*), la arañita roja (*Tetranychus cinnabarinus*), la araña Kanzawa (*Tetranychus Kanzawai* Kishida), la araña roja (*Tetranychus urticae* Koch), el ácaro rosa (*Acaphylla theae*), el ácaro rosa del pardeamiento de los cítricos (*Aculops pelekassi*), el ácaro púrpura (*Calacarus carinatus*), el ácaro blanco (*Epirimerus pyri*), etc.

Los agentes agrohortícolas que contienen derivados de anilida substituidos representados por la fórmula general (I) son también útiles como fungicidas agrohortícolas y exhiben un efecto fungicida muy elevado frente a diversas enfermedades. Como ejemplos específicos de las enfermedades frente a las que los compuestos de la presente invención exhiben un marcado efecto, se incluyen la espiga blanca del arroz (*Pyricularia oryzae*), el añublo de la vaina del arroz (*Rhizoctonia solani*), la helmintosporiosis del arroz (*Cochiobolus miyabeanus*), el oídio de diversas plantas hospedadoras, tales como el oídio de la cebada y del trigo (*Erysiphe graminis*), roya coronada de la avena (*Puccinia coronata*), la roya del tallo de otras plantas, el tizón tardío del tomate (*Phytophthora infestans*), el tizón tardío de otras plantas, el tizón tardío o las podredumbres por *Phytophthora* de diversas plantas, tales como el mildiú del pepino (*Pseudoperonospora cubensis*), el mildiú de la uva (*Plasmopara viticola*), etc., la sarna del manzano (*Venturia inaequalis*), el corazón mohoso de la manzana (*Alternaria mali*), la mancha negra de la pera (*Alternaria kikuchiana*), la melanosis de los cítricos (*Diaporthe citri*), enfermedades bacterianas debidas al género *Pseudomonas*, tales como el añublo bacteriano del pepino (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*) y el marchitamiento bacteriano del tomate (*Pseudomonas solanacearum*), enfermedades bacterianas debidas al género *Xanthomonas*, tales como la podredumbre negra de la col (*Xanthomonas campestris*), el añublo bacteriano de las hojas del arroz (*Xanthomonas oryzae*) y el chancro de los cítricos (*Xanthomonas citri*), y enfermedades bacterianas debidas al género *Erwinia*, tales como la podredumbre blanda bacteriana de la col (*Erwinia carotovora*), y enfermedades víricas, tales como el mosaico del tabaco (virus del mosaico del tabaco), etc.

El agente agrohortícola, en particular el insecticida agrohortícola, que contiene como principio activo el derivado de anilida substituido de fórmula general (I) o una sal del mismo de la presente invención tiene un marcado efecto insecticida sobre las plagas de insectos antes ejemplificadas perjudiciales para cultivos de arrozales, cultivos de tierras altas, árboles frutales, hortalizas, otros cultivos, flores y plantas ornamentales y similares. Por lo tanto, se puede obtener el efecto deseado del agente agrohortícola, en particular del insecticida agrohortícola, de la presente invención aplicando el presente agente agrohortícola al agua del arrozal, a los tallos y a las hojas de los árboles frutales, a las hortalizas, a otros cultivos, a las flores y a las plantas ornamentales, al suelo, etc., en una estación en la que se espera que aparezcan las plagas de insectos, antes de su aparición o en el momento en que se confirma su aparición.

El agente agrohortícola de la presente invención es generalmente preparado en formas convenientemente utilizables según un modo ordinario para la preparación de agroquímicos.

Es decir, se mezclan el derivado de anilida substituido de fórmula general (I) o una sal del mismo y eventualmente un adyuvante con un soporte inerte adecuado en una proporción apropiada y se prepara con ellos una forma de preparación adecuada, tal como una suspensión, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, un polvo humectable, gránulos, polvo, tabletas, paquete o similar por disolución, dispersión, suspensión, mezcla, impregnación, adsorción o adherencia.

El soporte inerte utilizable en la presente invención puede ser sólido o líquido. Como material utilizable como soporte sólido, se pueden poner como ejemplos harina de soja, harina de cereales, harina de madera, harina de cortezas, serrín, tallos de tabaco en polvo, cáscaras de nuez en polvo, salvado, celulosa en polvo, residuo de extracción de vegetales, polímeros o resinas sintéticos en polvo, arcillas (v.g., caolín, bentonita y arcilla ácida), talcos (v.g., talco y pirofilita), polvos o escamas de sílice (v.g., tierra de diatomeas, arena de sílice, mica y carbón blanco [ácido silícico

de alta dispersión sintético, también llamado sílice hidratada o ácido silícico hidratado finamente dividida/o; algunos productos comerciales contienen silicato de calcio como componente principal]), carbón activado, azufre en polvo, piedra pómez, tierra de diatomeas calcinada, ladrillo triturado, cenizas volantes, arena, carbonato de calcio, fosfato de calcio y otros polvos inorgánicos o minerales, fertilizantes químicos (v.g., sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio) y compost. Estos soportes pueden ser utilizados solos o como una mezcla de los mismos.

Un material utilizable como soporte líquido es seleccionado entre materiales que tienen solubilidad en sí mismos o que no tienen dicha solubilidad pero son capaces de dispersar un principio activo con ayuda de un adyuvante. Los siguientes son ejemplos típicos del soporte líquido y pueden ser usados solos o como una mezcla de los mismos: agua, alcoholes (v.g., metanol, etanol, isopropanol, butanol y etilenglicol), cetonas (v.g., acetona, metilacetona, metilisobutilcetona, diisobutilcetona y ciclohexanona), éteres (v.g., éter etílico, dioxano, Cellosolve, éter dipropílico y tetrahidrofurano), hidrocarburos alifáticos (v.g., queroseno y aceites minerales), hidrocarburos aromáticos (v.g., benceno, tolueno, xileno, nafta solvente y alquilnaftalenos), hidrocarburos halogenados (v.g., dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno), ésteres (v.g., acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo y ftalato de dioctilo), amidas (v.g., dimetilformamida, dietilformamida y dimetilacetamida), nitrilos (v.g., acetonitrilo) y sulfóxido de dimetilo.

Los siguientes son ejemplos típicos del adyuvante, que se utilizan dependiendo de los objetivos y se usan solos o en combinación en algunos casos, o que no necesitan ser utilizados en absoluto.

Para emulsionar, dispersar, disolver y/o humectar un compuesto como principio activo, se utiliza un surfactante. Como surfactante, se pueden poner como ejemplos éteres alquílicos de polioxietileno, éteres alquilarílicos de polioxietileno, ésteres de polioxietileno y de ácidos grasos superiores, resonatos de polioxietileno, monolaurato de polioxietilensorbitán, monooleato de polioxietilensorbitán, alquilarilsulfonatos, productos de condensación del ácido naftalensulfónico, ligninsulfonatos y ésteres sulfato de alcoholes superiores.

Además, para estabilizar la dispersión de un compuesto como principio activo, adherirlo y/o ligarlo, se pueden usar también los adyuvantes ejemplificados a continuación; a saber, se pueden usar también adyuvantes tales como caseína, gelatina, almidón, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, goma arábiga, poli(alcohol vinílico), turpentina, aceite de salvado, bentonita y ligninsulfonatos.

Para mejorar la fluidez de un producto sólido, se pueden usar también los siguientes adyuvantes; a saber, se pueden utilizar adyuvantes tales como ceras, estearatos, alquifosfatos, etc.

Se pueden usar adyuvantes tales como productos de condensación del ácido naftalensulfónico y policondensados de fosfatos como peptizador para productos dispersables.

También se pueden usar adyuvantes tales como aceites de silicona como agente desespumante.

También se pueden añadir adyuvantes tales como 1,2-benzisotiazolin-3-ona, 4-cloro-3,5-xilenol y p-hidroxibenzoato de butilo como conservante.

Además, si es necesario, también se pueden añadir agentes propagantes funcionales, potenciadores activos, tales como un inhibidor de la descomposición metabólica, como el butóxido de piperonilo, agentes anticongelantes, tales como el propilenglicol, antioxidantes tales como el BHT, absorbentes de ultravioleta y similares.

Se puede variar el contenido del compuesto como principio activo según sea necesario y se puede usar el compuesto como principio activo en una proporción apropiadamente seleccionada en el rango de 0,01 a 90 partes en peso por 100 partes del agente agrohortícola. Por ejemplo, en polvos o gránulos, el contenido adecuado del compuesto como principio activo es del 0,01 al 50 % en peso. En concentrados emulsionables o polvos humectables fluidos, es también del 0,01 al 50 % en peso.

El agente agrohortícola de la presente invención es utilizado para controlar una variedad de plagas de insectos del siguiente modo: se aplica a un cultivo sobre el que se espera que aparezcan las plagas de insectos, o a un sitio donde no es deseable la aparición o el crecimiento de las plagas de insectos, tal cual o después de diluirlo o suspenderlo apropiadamente en agua o similar, en una cantidad efectiva para el control de las plagas de insectos.

La dosificación de aplicación del insecticida agrohortícola de la presente invención varía dependiendo de diversos factores, tales como el propósito, las plagas de insectos que se han de controlar, el estado de crecimiento de una planta, la tendencia de la aparición de las plagas de insectos, el tiempo, las condiciones medioambientales, la forma de preparación, el método de aplicación, el sitio de aplicación y el tiempo de aplicación. Puede ser apropiadamente seleccionada en el rango de 0,001 g a 10 kg, preferiblemente de 0,01 g a 1 kg, (en términos del compuesto como

principio activo) por 10 áreas dependiendo de los propósitos.

El agente agrohortícola de la presente invención puede ser utilizado en mezcla con otros insecticidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, pesticidas bióticos o similares agrohortícolas para expandir tanto el espectro de especies de plagas de insectos controlables como el período de tiempo en que es posible una aplicación efectiva, o para reducir la dosificación. Más aún, el agente agrohortícola de la presente invención puede ser utilizado en mezcla con herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, fertilizantes o similares, dependiendo de las situaciones de aplicación.

Como otros insecticidas, acaricidas y nematocidas agrohortícolas utilizados para el propósito anterior, se pueden poner como ejemplos insecticidas, acaricidas y nematocidas agrohortícolas tales como Etión, Triclorfón, Metamidofós, Acefato, Diclorvós, Mevinfós, Monocrotofós, Malatión, Dimetoato, Formotión, Mecarbam, Vamidotión, Tiometón, Disulfotón, Oxideprofós, Naled, Metilparatión, Fenitrotión, Cianofós, Propafós, Fentiión, Protiofós, Profenofós, Isofenfós, Temefós, Fentoato, Dimetilvinfós, Clorfenvinfós, Tetraclorvinfós, Foxim, Isoxatiión, Piraclófós, Metidatiión, Clorpirifós, Clorpirifós-metilo, Piridafentiión, Diazinón, Pirimifós-metilo, Fosadona, Fosmet, Dioxabenzofós, Quinalfós, Terbufós, Etoprofós, Cadusafós, Mesulfenfós, DPS (NK-0795), Fosfocarb, Fenamifós, Isoamidofós, Fostiazato, Isazofós, Etoprofós, Fentiión, Fostietano, Diclofentiión, Tionazina, Sulprofós, Fensulfotiión, Diamidafós, Piretrina, Aletrina, Praletrina, Resmetrina, Permetrina, Teflutrina, Bifentrina, Fenpropatrina, Cipermetrina,  $\alpha$ -Cipermetrina, Cihalotrina,  $\lambda$ -Cihalotrina, Deltametrina, Acrinatrina, Fenvalerato, Esfenvalerato, Flucitrinato, Fluvalinato, Cicloprotrina, Etofenprox, Halfenprox, Silafluofeno, Fluvalinato, Metomilo, Oxamilo, Tiodicarb, Aldicarb, Alanicarb, Cartap, Metolcarb, Xililcarb, Propoxur, Fenoxicarb, Fenobucarb, Etiofencarb, Fenotiocarb, Bifenazato, BPMC, Carbarilo, Pirimicarb, Carbofurano, Carbosulfano, Furatiocarb, Benfuracarb, Aldoxicarb, Diafentiurón, Diflubenzurón, Teflubenzurón, Hexaflumurón, Novalurón, Lufenurón, Flufenoxurón, Clorfluazurón, óxido de Fenbutatina, hidróxido de triciclohexilestaño, oleato de sodio, oleato de potasio, Metopreno, Hidropreno, Binapacril, Amitraz, Dicofol, Querseno, Crorobencilato, Bromopropilato, Tetradifón, Bensultap, Benzoximato, Tebufenozida, Metoxifenozida, Cromafenozida, Propargita, Acequinosilo, Endosulfano, Diofenolano, Clorfenapir, Fenpiroximato, Tolfenpirad, Fipronilo, Tebufenpirad, Triazamato, Etoxazol, Hexitiazox, sulfato de nicotina, Nitenpiram, Acetamiprid, Tiacloprid, Imidacloprid, Tiametoxam, Clotianidina, Nidinetofurano, Fluazinam, Piriproxifeno, Hidrametilón, Pirimidifeno, Piridabeno, Ciromazina, TPIC (isocianurato de tripropilo), Pimetrozina, Clofentezina, Buprofedina, Tiociclam, Fenazaquina, Quinometionato, Indoxacarb, complejos de Polinactina, Milbemectina, Abamectina, benzoato de Emamectina, Espinosad, BT (*Bacillus thuringiensis*), Azadiractina, Rotenona, hidroxipropilamidón, clorhidrato de Levamisol, Metam-sodio, tartrato de Morantel, Dazomet, Triclamida, *Pasteuria penetrans*, *Monacrosporium phymatophagum*, etc. Como fungicidas agrohortícolas utilizados con el mismo propósito que antes, se pueden poner como ejemplos fungicidas agrohortícolas tales como azufre, cal de azufre, sulfato básico de cobre, Iprobenfós, Edifenfós, Tolclofós-metilo, Tiram, Policarbamato, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Tiofanato, Tiofanato metilo, Benomilo, acetato de Iminocadina, albecilato de Iminocadina, Mepronilo, Flutolanilo, Pencicorín, Furametpilo, Tifluzaquina, Metalaxilo, Oxadixilo, Carpropamid, Diclofluanida, Clorotolanilo, Kresoxim-metilo, Fenoxanilo (NNF-9425), Himexazol, Etridiazol, Fluoroimida, Procimidona, Vinclozolina, Iprodiona, Triadimefón, Triflumizol, Bitertanol, Ipconazol, Fluconazol, Propiconazol, Difenconazol, Miclobutanilo, Tetraconazol, Hexaconazol, Tebuconazol, Imibenconazol, Procloraz, Pefurazoato, Ciproconazol, Isoprotilano, Fenarimol, Pirimetanilo, Mepanipirim, Pirifenox, Fluazinam, Triforina, Diclomezina, Azoxistrobina, Tiadiazina, Captano, Probenazol, Acibenzolar-S-metilo (CGA-245704), Ftalida, Triciclazol, Piroquilón, Quinometionato, ácido Oxolínico, Ditiánón, Kasugamicina, Validamicina, Polioxina, Blastidicina, Estreptomocina, etc. De forma similar, como herbicidas, se pueden poner como ejemplo herbicidas tales como Glifosato, Sulfosato, Glifosinato, Bialfós, Butamifós, Esprocarb, Prosulcarb, Bentiocarb, Piributicarb, Asulam, Linurón, Dimrón, Bensulfurón metilo, Ciclosulfamurón, Cinosulfurón, Pirazosulfurón etilo, Azimsulfurón, Imazosulfurón, Tenilclor, Alaclor, Pretilaclor, Clomeprop, Etobenzanid, Mefenacet, Pendimetalina, Bifenox, Acifluorfen, Lactfeno, Cihalofop-butilo, Loxinilo, Bromobutida, Aloxidim, Setoxidim, Napropamida, Indanofán, Pirazolato, Benzofenap, Piraflufén-etilo, Imazapir, Sulfentrazona, Cafenstrol, Bentoxazón, Oxadiazón, Paraquat, Diquat, Piriminobac, Simazina, Atrazina, Dimetametrina, Triaziflam, Benflesato, Flutiacetmetilo, Quizalofop-etilo, Bentazona, peróxido de calcio, etc.

En cuanto a los pesticidas bióticos, se puede esperar el mismo efecto que antes utilizando el agente agrohortícola de la presente invención en mezcla con, por ejemplo, formulaciones víricas obtenidas del virus de la polihedrosis nuclear (VPN), del virus de la granulosis (VG), del virus de la polihedrosis citoplásmica (VPC), del virus entomopox (VEP), etc.; pesticidas microbianos utilizados como insecticidas o nematocidas, tales como *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai*, *Pasteuria penetrans*, etc.; pesticidas microbianos utilizados como fungicidas, tales como *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, *Erwinia carotovora* no patógena, *Bacillus subtilis*, etc.; y pesticidas bióticos utilizados como herbicidas, tales como *Xanthomonas campestris*, etc.

Además, se puede utilizar el agente agrohortícola de la presente invención en combinación con pesticidas bióticos, incluyendo enemigos naturales tales como la avispa parásita (*Encarsia formosa*), la avispa parásita (*Aphidius colemani*), el mosquito cecidómido (*Aphidoletes aphidimyza*), la avispa parásita (*Diglyphus isaea*), el ácaro parásito

5 (*Dacnusa sibirica*), el ácaro depredador (*Phytoseiulus persimilis*), el ácaro depredador (*Amblyseius cucumeris*), la chinche depredadora (*Orius sauteri*), etc.; pesticidas microbianos, tales como *Beauveria brongniartii*, etc.; y feromonas, tales como (Z)-10-tetradecenil=acetato, (E,Z)-4,10-tetradecadienil=acetato, (Z)-8-dodecenilacetato, (Z)-11-tetradecenil=acetato, (Z)-13-icosen-10-ona, (Z)-8-dodecenil=acetato, (Z)-11-tetradecenil=acetato, (Z)-13-icosen-10-ona, 14-metil-1-octadeceno, etc.

Se describen a continuación ejemplos típicos de la presente invención, pero no han de ser considerados como limitantes del alcance de la invención.

10 Tal como se emplean en los ejemplos, los términos "parte" y "partes" son en peso.

**Ejemplo de formulación 1**

15	Cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4	10 partes
	Xileno	70 partes
	N-Metilpirrolidona	10 partes
	Mezcla de polioxietilén nonilfenil éter y alquilbencenosulfonato de calcio	10 partes

20 Se preparó un concentrado emulsionable mezclando uniformemente los ingredientes anteriores para efectuar la disolución.

**Ejemplo de formulación 2**

25	Cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4	3 partes
	Polvo de arcilla	82 partes
	Polvo de tierra de diatomeas	15 partes

Se preparó un polvo mezclando uniformemente y triturando los ingredientes anteriores.

30 **Ejemplo de formulación 3**

35	Cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4	5 partes
	Polvo mixto de bentonita y arcilla	90 partes
	Ligninsulfonato de calcio	5 partes

Se prepararon gránulos mezclando los ingredientes anteriores uniformemente y amasando la mezcla resultante junto con una cantidad adecuada de agua, seguido de granulación y secado.

40 **Ejemplo de formulación 4**

40	Cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4	20 partes
	Mezcla de caolín y caolín sintético y ácido silícico de alta dispersión	75 partes
	Mezcla de polioxietilén nonilfenil éter y alquilbencenosulfonato de calcio	5 partes

45 Se preparó un polvo humectable mezclando uniformemente y triturando los ingredientes anteriores.

**Ejemplo de ensayo 1: Efecto insecticida sobre la polilla de la col (*Plutella xylostella*)**

50 Se liberaron polillas de la col adultas y se dejó que depositaran huevos sobre una planta de semillero de col china. Dos días después de la liberación, se sumergió la planta de semillero sobre la que se habían depositado los huevos durante aproximadamente 30 segundos en un producto químico líquido preparado diluyendo una preparación que contenía cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4 como principio activo para ajustar la concentración a 500 ppm. Después de secar al aire, se dejó reposar en una habitación termostatzada a 25°C. A los seis días de la inmersión, se contaron los insectos eclosionados. Se calculó la mortalidad según la siguiente ecuación y se juzgó el efecto insecticida según el criterio mostrado a continuación. Se realizó la prueba con grupos por triplicado de 10 insectos.

60 Mortalidad corregida (%) = 
$$\frac{\text{Número de insectos eclosionados en el grupo no tratado} - \text{Número de insectos eclosionados en el grupo tratado}}{\text{Número de insectos eclosionados en el grupo no tratado}} \times 100$$

Criterio:

- A --- Mortalidad 100%
- B --- Mortalidad 99-90%
- C --- Mortalidad 89-80%
- D --- Mortalidad 79-50%

Como resultado, se valoraron los siguientes compuestos como B o superior: compuestos N° 1-2, 1-4, 1-10, 1-14, 1-17, 1-20, 1-21, 1-26, 1-28, 1-33, 1-35, 1-41, 1-48, 1-52, 1-56, 1-57, 1-58, 1-65, 1-70, 1-73, 1-82, 1-103, 1-107, 1-108, 1-132, 1-133, 1-143, 1-145, 1-146, 1-163, 1-164, 3-2, 3-3, 3-4, 3-10, 3-12, 4-1, 4-4 y 4-5.

**Ejemplo de ensayo 2:** Efecto insecticida sobre el tórtrido menor del té (*Adoxophyes sp.*)

Se sumergieron hojas de té durante aproximadamente 30 segundos en un producto químico líquido preparado diluyendo una preparación que contenía cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4 como principio activo para ajustar la concentración a 500 ppm. Después de secar al aire, se pusieron las hojas de té en una placa de Petri de plástico de un diámetro de 9 cm y se inocularon con larvas de tórtrido menor del té, después de lo cual se dejó que la placa reposara en una habitación termostaticada a 25°C y que tenía una humedad del 70%. A los ocho días de la inoculación, se contaron los muertos y los vivos. Se calculó la mortalidad según la siguiente ecuación y se juzgó el efecto insecticida según el criterio mostrado en el Ejemplo de ensayo 1. Se realizó la prueba con grupos por triplicado de 10 insectos.

$$\text{Mortalidad corregida (\%)} = \frac{\text{Número de larvas vivas en el grupo no tratado} - \text{Número de larvas vivas en el grupo tratado}}{\text{Número de larvas vivas en el grupo no tratado}} \times 100$$

Como resultado, se valoraron los siguientes compuestos como B o superior: compuestos N° 1-52, 1-60, 1-103, 3-12, 3-28, 3-30 y 3-31.

**Ejemplo de ensayo 3**

Efecto acaricida sobre la araña roja (*Tetranychus urticae*)

Se preparó un disco de hoja de un diámetro de 2 cm de una hoja de frijol rojo, se puso sobre papel de filtro húmedo, se inoculó con arañas rojas hembras adultas y se pulverizó luego uniformemente, sobre una placa giratoria, con 50 ml de un producto químico líquido preparado diluyendo una preparación que contenía cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4 como principio activo para ajustar la concentración a 500 ppm. Después de la pulverización, se dejó que el disco de hoja reposara en una habitación termostaticada a 25°C. A los dos días del tratamiento con la preparación, se contaron los insectos muertos y se juzgó el efecto acaricida según el criterio mostrado en el Ejemplo de ensayo 1. Se realizó la prueba con dos réplicas de 10 insectos.

Como resultado de la prueba anterior, se vio que los siguientes compuestos tenían una actividad valorada como B o superior: 1-22, 1-23, 1-25, 1-26, 1-34, 1-39, 1-40, 1-51, 1-52, 1-54, 1-60 a 1-62, 1-65, 1-70 a 1-73, 1-78, 1-81, 1-82, 1-103, 1-104, 1-106 a 1-109, 1-119, 1-132, 1-143, 1-146, 3-13, 3-21, 3-30 a 3-32 y 4-3.

**Ejemplo de ensayo 4**

Efecto insecticida sobre el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*)

Se plantó una planta de col china en macetas de plástico de un diámetro de 8 cm y una altura de 8 cm cada una y se propagaron pulgones verdes del melocotonero sobre la planta. Se pulverizaron entonces los tallos y las hojas suficientemente con un producto químico líquido preparado diluyendo una preparación que contenía cada compuesto citado en las Tablas 1 a 4 como principio activo para ajustar la concentración a 500 ppm. Después de secar al aire, se dejó que las macetas reposaran en un invernadero. A los seis días de la pulverización, se contaron los pulgones verdes del melocotonero parásitos sobre cada planta de col china y se calculó la eficacia de control, mediante lo cual se juzgó el efecto acaricida según el criterio mostrado a continuación.

$$\text{Eficacia de control (\%)} = 100 - [(T \times Ca)/(Ta \times C)] \times 100$$

Ta: número de parásitos antes de la pulverización en el grupo tratado,  
T: número de parásitos tras la pulverización en el grupo tratado,  
Ca: número de parásitos antes de la pulverización en el grupo no tratado,  
T: número de parásitos tras la pulverización en el grupo no tratado.

5

Criterio de juicio:

A: eficacia de control del 100%  
B: eficacia de control del 99 al 90%  
C: eficacia de control del 89 al 80%  
D: eficacia de control del 79 al 50%

10

Como resultado de la prueba anterior, se vio que los siguientes compuestos tenían una actividad valorada como B o superior: 1-4, 1-8, 1-25, 1-35, 1-41, 1-52, 1-65, 1-81, 1-87, 1-106 a 1-108, 1-146, 3-27, 3-13, 3-34 y 4-1.

15

### **Ejemplo de ensayo 5**

Efecto controlador sobre el oídio de la cebada

20

Se inocularon plantas de cebada en macetas en el estadio de 1 hoja con esporas de hongo del oídio (*Erysiphe graminis hordei*) por espolvoreado. Al cabo de un día, se pulverizaron con un producto químico líquido preparado diluyendo una preparación que contenía cada compuesto citado en la Tabla 1, la Tabla 3 o la Tabla 4 como principio activo para ajustar la concentración a 200 ppm. Se dejó entonces que reposaran en una habitación termostaticada a 25°C. Una semana después de la inoculación, se midió el área de lesión de cada hoja y se comparó después con la de la no tratada, mediante lo cual se juzgó el efecto controlador según el siguiente criterio.

25

Criterio de juicio:

A: eficacia de control del 100 al 95%  
B: eficacia de control del 94 al 80%  
C: eficacia de control del 79 al 60%  
D: eficacia de control del 59 al 0%

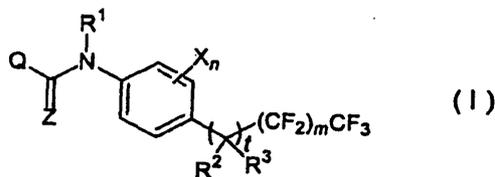
30

Como resultado de la prueba anterior, se vio que los siguientes compuestos tenían una actividad valorada como B o superior: 1-5, 1-12, 1-23, 1-30, 1-45, 1-47, 1-52, 1-54, 1-83, 1-133, 3-30, 3-31 y 4-3.

35

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de anilida sustituido representado por la fórmula general (I):



5

donde R<sup>1</sup> es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, un grupo fenilo o un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y son seleccionados entre átomos de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, grupos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquiltio (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos monoalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, grupos dialquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino cuyos grupos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) pueden ser iguales o diferentes y grupos alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo;

10

R<sup>2</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

15

R<sup>3</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

t es 1; m es un número entero de 0 a 6;

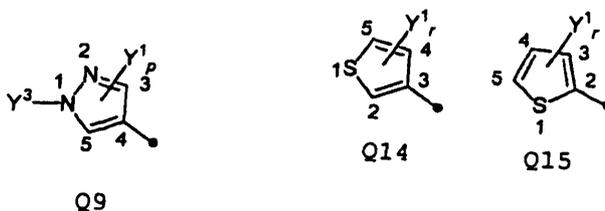
X es un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>); y

n es un número entero de 1 a 4;

Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; y

20

Q es un sustituyente representado por cualquiera de las fórmulas Q9, Q14 y Q15:



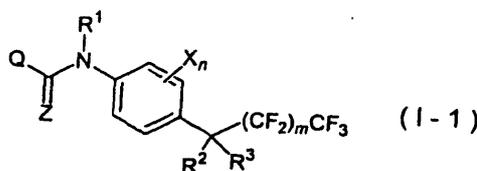
25

donde cada uno de los Y<sup>1</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, es un átomo de halógeno o un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

Y<sup>3</sup> es un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o un grupo fenilo;

p es un número entero de 0 a 2; y r es un número entero de 0 a 3.

2. Un derivado de anilida sustituido representado por la fórmula general (I-1):



30

donde R<sup>1</sup> es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo o un grupo haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo;

35

R<sup>2</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);

R<sup>3</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);

m es un número entero de 0 a 6;

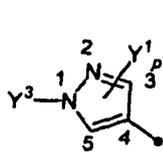
X es un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

n es un número entero de 1 a 4;

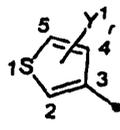
Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; y

40

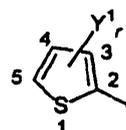
Q es un sustituyente representado por cualquiera de las fórmulas Q9, Q14, Q15:



Q9



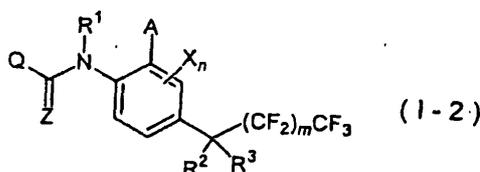
Q14



Q15

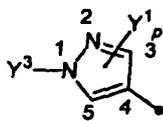
donde cada uno de los  $Y^1$ , que pueden ser iguales o diferentes, es un átomo de halógeno o un grupo alquilo ( $C_1-C_2$ );  $Y^3$  es un grupo alquilo ( $C_1-C_3$ ) o un grupo fenilo;  
 5 p es un número entero de 0 a 2; y r es un número entero de 0 a 3.

3. Un derivado de anilida sustituido representado por la fórmula general (1-2):

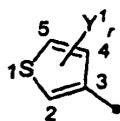


(1-2)

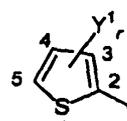
- 10 donde  $R^1$  es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo ( $C_1-C_6$ ) o un grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ );  
 $R^2$  es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo ( $C_1-C_6$ );  
 $R^3$  es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi ( $C_1-C_2$ );  
 m es un número entero de 0 a 6;
- 15 A es un grupo alquilo ( $C_3-C_8$ ), un grupo haloalquilo ( $C_3-C_8$ ), un grupo alqueno ( $C_3-C_8$ ), un grupo haloalqueno ( $C_3-C_8$ ), un grupo alquino ( $C_3-C_8$ ), un grupo haloalquino ( $C_3-C_8$ ), un grupo cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), un grupo cicloalquil( $C_3-C_6$ )alquilo( $C_1-C_6$ ), un grupo fenilo o un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y son seleccionados entre átomos de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, grupos alquilo ( $C_1-C_6$ ), grupos haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), grupos alcoxi ( $C_1-C_6$ ), grupos haloalcoxi ( $C_1-C_6$ ), grupos alquiltío ( $C_1-C_6$ ), grupos haloalquiltío ( $C_1-C_6$ ), grupos alquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), grupos haloalquilsulfino ( $C_1-C_6$ ), grupos alquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ), grupos haloalquilsulfonilo ( $C_1-C_6$ ), grupos monoalquil( $C_1-C_6$ )amino, grupos dialquil( $C_1-C_6$ )amino cuyos grupos alquilo ( $C_1-C_6$ ) pueden ser iguales o diferentes y grupos alcoxi( $C_1-C_6$ )carbonilo;
- 20 X es un grupo alquilo ( $C_1-C_8$ );  
 n es un número entero de 0 a 3;
- 25 Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre; y  
 Q es un sustituyente representado por cualquiera de las fórmulas Q9, Q14, Q15:



Q9



Q14



Q15

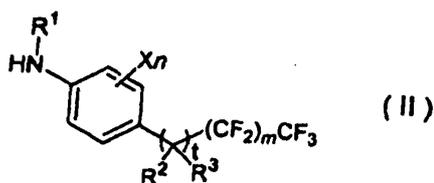
- 30 donde cada uno de los  $Y^1$ , que pueden ser iguales o diferentes, es un átomo de halógeno o un grupo alquilo ( $C_1-C_2$ );  
 $Y^3$  es un grupo alquilo ( $C_1-C_3$ ) o un grupo fenilo;  
 p es un número entero de 0 a 2; y r es un número entero de 0 a 3.

4. Un producto químico agrícola y hortícola **caracterizado por** contener un derivado de anilida sustituido según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 como principio activo.

5. Un producto químico agrícola y hortícola según la reivindicación 4 que es un insecticida o acaricida agrícola y hortícola.

6. Un método para aplicar un producto químico agrícola y hortícola, **caracterizado por** aplicar un producto químico agrícola y hortícola según cualquiera de la reivindicación 4 o la reivindicación 5 a una planta que se ha de proteger o al suelo en una dosificación efectiva para proteger plantas útiles frente a plagas.

5 7. Uso de un derivado de anilina sustituido representado por la fórmula general (II):



10 donde R<sup>1</sup> es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), un grupo fenilo o un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y son seleccionados entre átomos de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, grupos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquiltío (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquiltío (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilsulfinilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos alquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos haloalquilsulfonilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), grupos monoalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino, grupos dialquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino cuyos grupos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) pueden ser iguales o diferentes y

15 grupos alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo;  
 R<sup>2</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>);  
 R<sup>3</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>);  
 t es 1; m es un número entero de 0 a 6;  
 X es un grupo alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>);

20 y n es un número entero de 1 a 4,  
 como intermediario en la producción de compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.