

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 439 315**

51 Int. Cl.:

**C07C 237/42** (2006.01)

**A01N 37/46** (2006.01)

**A01P 7/00** (2006.01)

**C07C 231/02** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.02.2010 E 10738613 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **04.12.2013 EP 2394986**

54 Título: **Derivados de 3-aminoxalil-aminobenzamida y agentes insecticidas y acaricidas que contienen los mismos como ingrediente activo**

30 Prioridad:

**06.02.2009 WO PCT/JP2009/052084**

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

**22.01.2014**

73 Titular/es:

**AGRO-KANESHO CO., LTD. (100.0%)  
2-19, Akasaka 4-chome Minato-ku  
Tokyo 107-0052, JP**

72 Inventor/es:

**USUI, SHUICHI;  
FUKUCHI, TOSHIKI y  
KINOSHITA, SACHIKO**

74 Agente/Representante:

**DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto**

ES 2 439 315 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 3-aminoxalil-aminobenzamida y agentes insecticidas y acaricidas que contienen los mismos como ingrediente activo

**Campo técnico**

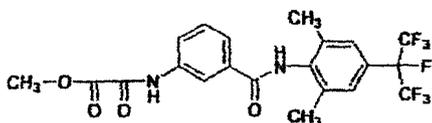
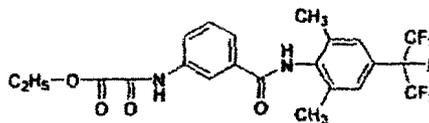
- 5 La presente invención se refiere a un nuevo derivado de 3-aminoxalilaminobenzamida y agentes insecticidas y acaricidas que contienen cada uno el derivado como ingrediente activo.

**Antecedentes de la técnica**

Se sabe ya que las 3-acilaminobenzamidas o similares son útiles como insecticidas (véanse, por ejemplo, los Documentos de Patente 1 a 24 especificados a continuación).

- 10 Además, se conocen también las 3-acilaminobenzamidas que incluyen, por ejemplo, los compuestos representados por las siguientes fórmulas A y B (véase, por ejemplo, el Documento de Patente 25).

Sin embargo, los compuestos descritos en el Documento de Patente 25 son aquellos en los que el resto 3-acilamino de los mismos tiene una estructura de alcioxalilamino, y este documento de patente no describe particularmente ningún compuesto que tiene una estructura de aminooxalilamino.

**Compuesto A****Compuesto B**

15

**Bibliografía de la técnica anterior**

Documento de Patente

Documento de Patente 1: WO 2005-021488;

Documento de Patente 2: WO 2005-073165;

- 20 Documento de Patente 3: WO 2006-137376;

Documento de Patente 4: WO 2006-137395;

Documento de Patente 5: JP-A-2006-225340;

Documento de Patente 6: WO 2007-013150;

Documento de Patente 7: WO 2007-013332;

- 25 Documento de Patente 8: WO 2007-017075;

Documento de Patente 9: JP-A-2007-099761;

Documento de Patente 10: WO 2007-128410;

Documento de Patente 11: JP-A-2007-119416;

Documento de Patente 12: JP-A-2007-302617;

- 30 Documento de Patente 13: WO 2008-000438;

Documento de Patente 14: WO 2008-012027;

Documento de Patente 15: WO 2008-074427;

Documento de Patente 16: WO 2008-075453;

Documento de Patente 17: WO 2008-075454;

- 35 Documento de Patente 18: WO 2008-075459;

Documento de Patente 19: WO 2008-075465;

Documento de Patente 20: WO 2008-107091;

Documento de Patente 21: WO 2009-049844;

Documento de Patente 22: WO 2009-049845;

Documento de Patente 23: WO 2009-080203;

5 Documento de Patente 24: JP-A-2009-209090;

Documento de Patente 25: JP-A-2006-306771.

### Compendio de la invención

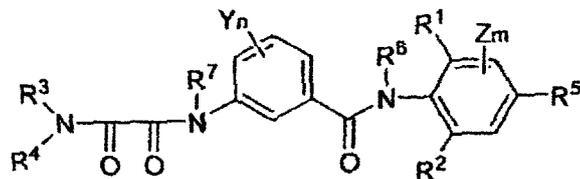
Problemas que ha de solucionar la invención

10 Es un objeto de la presente invención proporcionar un compuesto que tiene una estructura de aminoxalilamino, que muestra un alto efecto contra diversos tipos de plagas de insectos nocivos y ácaros.

Medios para la solución de los problemas

15 Los inventores de la presente invención han realizado estudios intensivos para solucionar los problemas anteriores, han encontrado que un compuesto que tiene una estructura de aminooxalilamino representada por la siguiente fórmula general es un compuesto útil que tiene las propiedades mencionadas anteriormente, y han completado así la presente invención.

Más específicamente, la presente invención se refiere a un derivado de 3-aminoxalilaminobenzamida (en lo sucesivo denominado simplemente "el compuesto de la presente invención") representado por la siguiente fórmula general [1], así como un agente insecticida o acaricida (en lo sucesivo denominado simplemente "el agente insecticida o acaricida de la presente invención") que comprende el derivado anterior como ingrediente activo.



[ 1 ]

20

en donde

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>, un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>;

25 R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>8</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>8</sub>, un grupo alilo, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub> o un grupo cicloalquil(C<sub>3</sub> a C<sub>6</sub>)-alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>, a condición de que R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> puedan estar unidos entre sí para formar un enlace alquilenos C<sub>3</sub> a C<sub>6</sub>;

R<sup>5</sup> representa un grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>;

30 R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>, un grupo alquenilo C<sub>2</sub> a C<sub>6</sub>, un grupo haloalquenilo C<sub>2</sub> a C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-carbonilo, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-carbonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-sulfonilo, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-sulfonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-carbonilo, o un grupo haloalcoxi(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-carbonilo.

35 Y representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-amino, un grupo dialquil(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-amino, un grupo alcoxi C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub> o un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>;

Z representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub> o un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>; y

n es un número entero que varía de 0 a 4 y m es un número entero que varía de 0 a 2.

## Efecto de la invención

El compuesto de la presente invención muestra un efecto excelente contra plagas de insectos nocivos y ácaros.

## Modo para llevar a cabo la invención

La presente invención será descrita ahora en más detalle a continuación.

- 5 En la fórmula general [1] anterior,  $R^1$  y  $R^2$  representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$ , un grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$ , un átomo de halógeno o un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$ .

En este caso, el grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$  puede tener una ramificación, y los ejemplos de tales grupos alcoxi  $C_1$  a  $C_3$  usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi y un grupo isopropiloxi. El grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$  puede tener una ramificación, y los ejemplos de tales grupos alcoxi  $C_1$  a  $C_3$  usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo trifluorometoxi y grupo 2,2,2-trifluoroetoxi. Los ejemplos de los átomos de halógeno anteriores usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo. El grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$  puede tener una ramificación, y los ejemplos de tales grupos alquilo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo 2-pentilo, un grupo 3-pentilo, un grupo neopentilo y un grupo t-pentilo. En particular, los ejemplos de  $R^1$  usados preferiblemente en la presente memoria son un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo metoxi y un grupo trifluorometoxi. Los ejemplos de  $R^2$  usados preferiblemente en la presente memoria son un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

- 20  $R^3$  y  $R^4$  representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_8$ , un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_8$ , un grupo alilo, un grupo cicloalquilo  $C_3$  a  $C_8$  o un grupo cicloalquil( $C_3$  a  $C_6$ )-alquilo  $C_1$  a  $C_4$ .

En este caso, el grupo alquilo  $C_1$  a  $C_8$  puede tener una ramificación, y los ejemplos de tales grupos alquilo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo 2-pentilo, un grupo 3-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo t-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo t-octilo y grupo n-octilo. El grupo alquilo  $C_1$  a  $C_8$  es preferiblemente un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_6$ .

Tal grupo alquilo  $C_1$  a  $C_6$  puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo 2-pentilo, un grupo 3-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo t-pentilo y un grupo n-hexilo.

El grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_6$  anterior puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos específicos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo monoclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo monobromometilo, un grupo dibromometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 1-cloroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2,2-dicloroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 1-bromoetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2,2-dibromoetilo, un grupo 2,2,2-tribromoetilo, un grupo 2-yodoetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-yodo-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 3-bromopropilo, un grupo 1,3-difluoro-2-propilo, un grupo 3,3-difluoropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 3,3,3-tricloropropilo, un grupo 1,3-dicloro-2-propilo, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propilo, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propilo, un grupo 2-bromo-1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo heptafluoro-n-propilo, un grupo 1-cloro-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 1-bromo-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 2-cloro-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-n-propilo, un grupo 2-bromo-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-n-propilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilo, un grupo nonafluoro-n-butilo, un grupo nonafluoro-2-butilo, un grupo 4,4,5,5,5-pentafluoropentilo, un grupo 3,3,4,4,5,5,5-heptafluoropentilo, un grupo undecafluoro-2-pentilo, un grupo undecafluoro-3-pentilo, un grupo undecafluoro-n-pentilo, un grupo 6,6,6-trifluorohexilo y un grupo 1H,1H-pentadecafluorooctilo. El grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_8$  anterior es preferiblemente un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_6$ .

50 El grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_6$  anterior puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo monoclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo monobromometilo, un grupo dibromometilo, un grupo tribromometilo, un grupo fluoroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 1-cloroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2,2-dicloroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 1-bromoetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2,2-dibromoetilo, un grupo 2,2,2-tribromoetilo, un grupo 2-yodoetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-yodo-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 3-

- bromopropilo, un grupo 1,3-difluoro-2-propilo, un grupo 3,3-difluoropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 3,3,3-tricloropropilo, un grupo 1,3-dicloro-2-propilo, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propilo, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propilo, un grupo 2-bromo-1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo heptafluoro-n-propilo, un grupo 1-cloro-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 1-bromo-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 2-cloro-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-n-propilo, un grupo 2-bromo-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-n-propilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilo, un grupo nonafluoro-n-butilo, un grupo nonafluoro-2-butilo, un grupo 4,4,5,5,5-pentafluoropentilo, un grupo 3,3,4,4,5,5,5-heptafluoropentilo, un grupo undecafluoro-2-pentilo, un grupo undecafluoro-3-pentilo, un grupo undecafluoro-n-pentilo y un grupo 6,6,6-trifluorohexilo.
- 5 El grupo cicloalquilo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub> anterior puede ser uno ramificado, y los ejemplos específicos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo y un grupo ciclohexilo. El grupo cicloalquilo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub> es preferiblemente un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub> a C<sub>6</sub>.
- 10 El grupo cicloalquil(C<sub>3</sub> a C<sub>6</sub>)-alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub> anterior puede ser uno ramificado, y los ejemplos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria son un grupo ciclopropilmetilo, un grupo 1-ciclopropiletilo y un grupo ciclobutilmetilo.
- 15 Además, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden estar unidos entre sí para formar un enlace alquileo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub>, y los ejemplos de tales enlaces alquileo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub> usados adecuadamente en la presente memoria incluyen (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub> y (CH<sub>2</sub>)<sub>6</sub>. El enlace alquileo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub> es preferiblemente un enlace alquileo C<sub>3</sub> a C<sub>6</sub>.
- 20 En particular, se usan preferiblemente grupos metilo y etilo como sustituyente R<sup>3</sup>. El sustituyente R<sup>4</sup> es preferiblemente un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo ciclopropilo, un grupo t-butilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo o un grupo 2,2,2-trifluoroetilo.
- R<sup>5</sup> representa un grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>.
- 25 En este caso, el grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub> puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos específicos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria son un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo monoclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo monobromometilo, un grupo dibromometilo, un grupo tribromometilo, un grupo fluoroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 1-cloroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2,2-dicloroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 1-bromoetilo, un grupo 2-yodoetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-yodo-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 3-bromopropilo, un grupo 1,3-difluoro-2-propilo, un grupo 3,3-difluoropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 3,3,3-tricloropropilo, un grupo 1,3-dicloro-2-propilo, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propilo, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propilo, un grupo 2-bromo-1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo heptafluoro-n-propilo, un grupo 1-cloro-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 1-bromo-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 2-cloro-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-n-propilo, un grupo 2-bromo-1,1,2,3,3,3-hexafluoro-n-propilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilo, un grupo nonafluoro-n-butilo, un grupo nonafluoro-2-butilo, un grupo 4,4,5,5,5-pentafluoropentilo, un grupo 3,3,4,4,5,5,5-heptafluoropentilo, un grupo undecafluoro-2-pentilo, un grupo undecafluoro-3-pentilo y un grupo undecafluoro-n-pentilo.
- 30 R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo cicloalquilo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub>, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>, un grupo alqueno C<sub>2</sub> a C<sub>6</sub>, un grupo haloalqueno C<sub>2</sub> a C<sub>6</sub>, un grupo alquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-carbonilo, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-carbonilo, un grupo alquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-sulfonilo, un grupo haloalquil(C<sub>1</sub> a C<sub>4</sub>)-sulfonilo, un grupo alcoxi(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-carbonilo o un grupo haloalcoxi(C<sub>1</sub> a C<sub>3</sub>)-carbonilo.
- 35 En este caso, el grupo alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub>, el grupo cicloalquilo C<sub>3</sub> a C<sub>8</sub> y el grupo haloalquilo C<sub>1</sub> a C<sub>5</sub> son los mismos que los definidos anteriormente.
- 40 El grupo alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) anterior puede ser un grupo alquiloalquilo lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo y un grupo 2-metoxietilo.
- 45 El grupo alqueno C<sub>2</sub> a C<sub>6</sub> mencionado anteriormente puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria son un grupo vinilo, un grupo alilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 2-butenilo y un grupo 3-butenilo.
- 55 El grupo haloalqueno C<sub>2</sub> a C<sub>6</sub> puede ser un grupo alquiloalquilo lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria son un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3-cloro-2-propenilo, un grupo 2-bromo-2-propenilo, un grupo 3-bromo-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo 3,3-dicloro-2-

propenilo, un grupo 3,3-dibromo-2-propenilo, un grupo 2,3-dibromo-2-propenilo, un grupo 4,4-difluoro-3-butenilo y un grupo 3,4,4-tribromo-3-butenilo.

5 El grupo alquil( $C_1$  a  $C_4$ )-carbonilo anterior puede ser uno lineal, cíclico o ramificado, y los ejemplos del mismo enumerados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo isopropil-carbonilo y un grupo ciclopropil-carbonilo.

El grupo haloalquil( $C_1$  a  $C_4$ )-carbonilo anterior puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo enumerados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo trifluoroacetilo, un grupo pentafluoropropionilo, un grupo tricloroacetilo, un grupo cloroacetilo, un grupo bromoacetilo y un grupo 3-cloropropionilo.

10 El grupo alquil( $C_1$  a  $C_4$ )-sulfonilo anterior puede ser uno lineal, cíclico o ramificado, y los ejemplos del mismo enumerados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo isobutilsulfonilo, un grupo s-butilsulfonilo y un grupo t-butilsulfonilo.

15 El grupo haloalquil( $C_1$  a  $C_4$ )-sulfonilo mencionado anteriormente puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo enumerados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo trifluorometilsulfonilo, un grupo pentafluoroetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, un grupo heptafluoro-n-propilsulfonilo, un grupo heptafluoroisopropilsulfonilo, un grupo nonafluoro-n-butilsulfonilo y un grupo nonafluoro-s-butilsulfonilo.

20 El grupo alcoxi( $C_1$  a  $C_3$ )-carbonilo mencionado anteriormente puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo usados adecuadamente en la presente memoria incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo y un grupo isopropiloxicarbonilo.

El grupo haloalcoxi( $C_1$  a  $C_3$ )-carbonilo puede ser uno lineal o ramificado, y los ejemplos del mismo enumerados adecuadamente en la presente memoria como tales grupos haloalcoxicarbonilo incluyen, por ejemplo, un grupo cloro-metoxi-carbonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxicarbonilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropiloxicarbonilo y un grupo 3,3,3-tricloropropiloxicarbonilo.

25 Particularmente preferidos como  $R^6$  son, por ejemplo, un átomo de hidrógeno y un grupo metilo. Se usan preferiblemente en la presente memoria como sustituyente  $R^7$ , por ejemplo, un átomo de hidrógeno y un grupo metilo.

30 Y en la fórmula general [1] representa independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$  (preferiblemente un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_3$ ), un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_5$  (preferiblemente un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_3$ ), un grupo alquil( $C_1$  a  $C_3$ )-amino, un grupo di-alquil( $C_1$  a  $C_3$ )-amino, un grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$  o un grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$ .

En este caso, el grupo alquilo  $C_1$  a  $C_3$  puede ser uno lineal o ramificado, y los enumerados adecuadamente en la presente memoria como tales grupo alquilo incluyen, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo y un grupo isopropilo.

35 El grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_3$  anterior puede ser uno lineal o ramificado, y los enumerados adecuadamente en la presente memoria como tales grupo haloalquilo son, por ejemplo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo y un grupo pentafluoroetilo.

40 El grupo alquil( $C_1$  a  $C_3$ )-amino mencionado anteriormente puede ser uno lineal, cíclico o ramificado, y los enumerados adecuadamente en la presente memoria como tales grupo alquilamino son, por ejemplo, un grupo metilamino, un grupo etilamino, un grupo n-propilamino, un grupo isopropilamino y un grupo ciclopropilamino.

El grupo dialquil( $C_1$  a  $C_3$ )-amino anterior puede ser uno lineal, cíclico o ramificado, y los enumerados adecuadamente en la presente memoria como tales grupo alquilamino son, por ejemplo, un grupo dimetilamino, un grupo metiletilamino, un grupo dietilamino, un grupo di-n-propilamino y un grupo diisopropilamino.

Los otros grupos son los mismos que los definidos anteriormente.

45 En particular, se usa preferiblemente en la presente memoria, por ejemplo, un átomo de hidrógeno y un átomo de halógeno.

Z en la fórmula general [1] representa independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$  (preferiblemente un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_3$ ), un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_5$ , un grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$  o un grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$ .

50 Los otros grupos son los mismos que los definidos anteriormente.

En particular, se usa preferiblemente en la presente memoria como Z, por ejemplo, un átomo de hidrógeno.

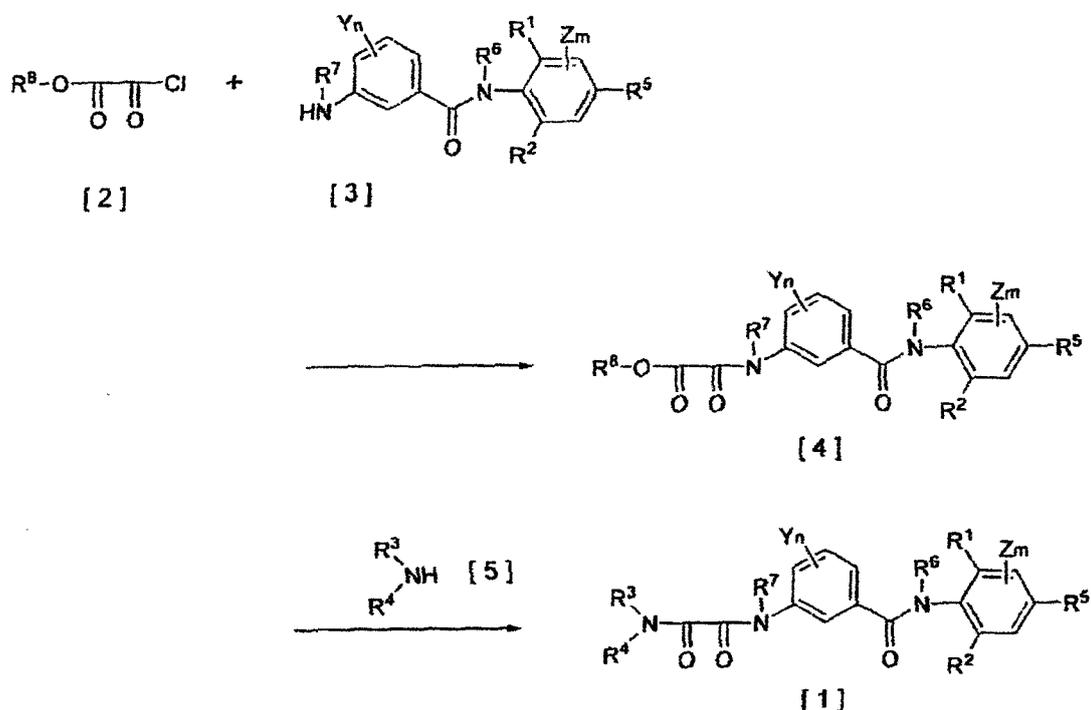
n es un número entero que varía de 0 a 4.

m es un número entero que varía de 0 a 2.

5 El compuesto de la presente invención puede estar opcionalmente en la forma de un isómero conformacional dependiendo de los tipos de sustituyentes, y por consiguiente, debe interpretarse que la presente invención incluye asimismo mezclas que comprenden cada una tales isómeros conformacionales en cualquier proporción de mezcla. Además, el compuesto de la presente invención puede estar asimismo en la forma de un isómero óptico dependiendo de o debido a la presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos, y, por esta razón, debe interpretarse asimismo que la presente invención también incluye mezclas que comprenden cada una tales isómeros ópticos en cualquier proporción de mezcla.

10 Los compuestos de la presente invención son nuevos, y se pueden preparar, por ejemplo, según los siguientes esquemas de reacción 1 a 3 para sintetizarlos:

Esquema de reacción 1:



15 (en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , n, m, Y y Z son los mismos que los definidos anteriormente en relación con la fórmula general [1] y  $R^8$  representa un grupo alquilo inferior. El grupo alquilo inferior puede ser, por ejemplo, un grupo alquilo que tiene un número de átomos de carbono del orden de aproximadamente 1 a 5).

(1) Preparación de compuestos representados por la Fórmula General [4] anterior:

20 Un compuesto de Fórmula [4] se puede preparar mediante la reacción de un compuesto de Fórmula [2] con un compuesto de Fórmula [3]. Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia o ausencia de un disolvente y una base.

25 El disolvente utilizable en la reacción no está restringido a ninguno específico, en tanto en cuanto no afecte directamente a la reacción, y los ejemplos del mismo incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; cetonas tales como acetona, metilacetona y metilisobutilcetona; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y cloruro de metileno; ésteres tales como acetato de metilo y acetato de etilo; éteres tales como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y 1,2-dimetoxietano; agua; disolventes polares tales como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona y dimetilsulfóxido; o una mezcla de los disolventes anteriores.

30 Los ejemplos de tales bases incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), y 4-dimetilaminopiridina; hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidróxidos de metales alcalinotérreos tales como hidróxido de calcio; carbonatos de metales alcalinos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; carbonatos de metales alcalinotérreos tales como carbonato de calcio; bicarbonatos de metales alcalinos tales como bicarbonato de sodio; y alcóxidos de metales alcalinos tales como metóxido de sodio y etóxido de potasio. La temperatura de reacción usada en la presente memoria, por

ejemplo, cae dentro del intervalo de -30 a 150°C y preferiblemente -5 a 80°C. Después de completarse la reacción, es suficiente aislar el producto diana del sistema de reacción según la técnica usada actualmente, y el producto de reacción puede ser purificado, si fuera necesario, por ejemplo, por la técnica de lavado con disolvente, la técnica de recristalización o la técnica de cromatografía en columna, para dar así el producto diana puro. Alternativamente, el producto bruto de una reacción puede ser usado asimismo en la etapa de reacción posterior, sin aislar el producto diana del sistema de reacción.

El compuesto de Fórmula [2] es uno conocido. El derivado de anilina representado por la fórmula general [3], que sirve como compuesto bruto de esta reacción, se puede preparar según el método descrito en la solicitud de patente internacional WO 2005-021488 o la solicitud de patente internacional WO 2005-073165.

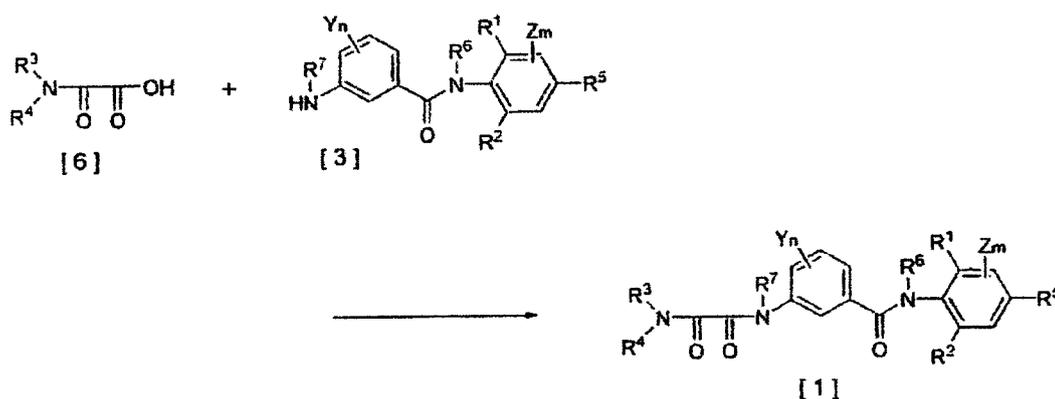
(2) Preparación del compuesto de Fórmula [1]

El compuesto de Fórmula [1] se puede obtener mediante la reacción del compuesto anterior de Fórmula [4] con un compuesto de Fórmula [5]. Esta reacción se puede llevar a cabo en presencia o ausencia de un disolvente y una base.

El disolvente utilizable en la reacción no está restringido a ninguno específico, en tanto en cuanto no afecte directamente a la reacción, y los ejemplos del mismo incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; cetonas tales como acetona, metiletilcetona y metilisobutilcetona; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y cloruro de metileno; ésteres tales como acetato de metilo y acetato de etilo; éteres tales como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y 1,2-dimetoxietano; agua; disolventes polares tales como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona y dimetilsulfóxido; alcoholes tales como metanol, etanol e isopropanol; o una mezcla de los disolventes anteriores.

Los ejemplos de tales bases utilizables en la reacción anterior incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), y 4-dimetilaminopiridina; hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidróxidos de metales alcalinotérreos tales como hidróxido de calcio; carbonatos de metales alcalinos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; carbonatos de metales alcalinotérreos tales como carbonato de calcio; bicarbonatos de metales alcalinos tales como bicarbonato de sodio; y alcóxidos de metales alcalinos tales como metóxido de sodio y etóxido de potasio. La temperatura de reacción usada en la presente memoria, por ejemplo, cae dentro del intervalo de -30 a 150°C y preferiblemente -5 a 80°C. Después de completarse la reacción, es suficiente aislar el producto diana del sistema de reacción según la técnica usada actualmente, y el producto de reacción puede ser purificado, si fuera necesario, por ejemplo, por la técnica de lavado con disolvente, la técnica de recristalización o la técnica de cromatografía en columna para dar así el producto diana.

Esquema de reacción 2:



(en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, n, m, Y y Z son los mismos que los definidos anteriormente en relación con la fórmula general [1] anterior).

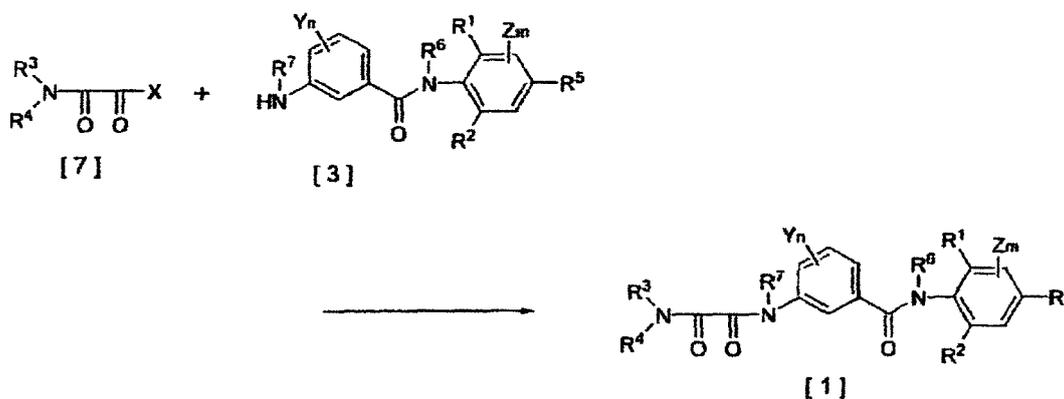
La reacción según el esquema de reacción 2 se puede llevar a cabo en presencia de un agente de condensación y en presencia o ausencia de un disolvente y una base. Los ejemplos de disolventes utilizables en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; cetonas tales como acetona, metiletilcetona y metilisobutilcetona; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y cloruro de metileno; ésteres tales como acetato de metilo y acetato de etilo; éteres tales como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y 1,2-dimetoxietano; agua; disolventes polares tales como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona y dimetilsulfóxido; alcoholes tales como metanol, etanol e isopropanol; o una mezcla de los disolventes anteriores.

Los ejemplos de tales bases utilizables en la reacción incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), y 4-dimetilaminopiridina; hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido

de sodio e hidróxido de potasio; hidróxidos de metales alcalinotérreos tales como hidróxido de calcio; carbonatos de metales alcalinos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; carbonatos de metales alcalinotérreos tales como carbonato de calcio; bicarbonatos de metales alcalinos tales como bicarbonato de sodio; y alcóxidos metálicos tales como metóxido de sodio y etóxido de potasio.

- 5 Los ejemplos de los agentes de condensación utilizables en la reacción incluyen 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, carbonildiimidazol (CDI) y ácido trifluoroacético anhidro. La temperatura de reacción usada en la presente memoria, por ejemplo, cae dentro del intervalo de -30 a 150°C y preferiblemente -5 a 80°C. Después de completarse la reacción, es suficiente aislar el producto diana del sistema de reacción según la técnica usada actualmente, y el producto de reacción puede ser purificado, si fuera necesario, por ejemplo, por la técnica de lavado con disolvente, la técnica de recristalización o la técnica de cromatografía en columna para dar así el producto diana.

Esquema de reacción 3:



- 15 (en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, n, m, Y y Z son los mismos que los definidos anteriormente en relación con la fórmula general [1] anterior y X representa un átomo de halógeno).

Esta reacción en el esquema de reacción 3 se puede llevar a cabo en presencia o ausencia de un disolvente y una base.

- 20 El disolvente utilizable en la reacción no está restringido a ninguno específico, en tanto en cuanto no afecte directamente a la reacción, y los ejemplos del mismo incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; cetonas tales como acetona, metiletilcetona y metilisobutilcetona; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y cloruro de metileno; ésteres tales como acetato de metilo y acetato de etilo; éteres tales como tetrahidrofurano, dioxano, éter dietílico y 1,2-dimetoxietano; agua; disolventes polares tales como acetonitrilo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona y dimetilsulfóxido; o una mezcla de los disolventes anteriores.

- 25 Los ejemplos de tales bases incluyen bases orgánicas tales como trietilamina, piridina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU), y 4-dimetilaminopiridina; hidróxidos de metales alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidróxidos de metales alcalinotérreos tales como hidróxido de calcio; carbonatos de metales alcalinos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; carbonatos de metales alcalinotérreos tales como carbonato de calcio; bicarbonatos de metales alcalinos tales como bicarbonato de sodio; y alcóxidos de metales alcalinos tales como metóxido de sodio y etóxido de potasio. La temperatura de reacción usada en la presente memoria, por ejemplo, cae dentro del intervalo de -30 a 150°C y preferiblemente -5 a 80°C. Después de completarse la reacción, es suficiente aislar el producto diana del sistema de reacción según la técnica usada actualmente, y el producto de reacción puede ser purificado, si fuera necesario, por ejemplo, por la técnica de lavado con disolvente, la técnica de recristalización o la técnica de cromatografía en columna para dar así el producto diana.

- 35 Los agentes insecticidas y acaricidas según la presente invención, cada uno de los cuales comprende, como ingrediente activo, el compuesto de la presente invención representado por la fórmula general [1], se pueden usar para la prevención y exterminación de organismos nocivos que son perjudiciales o causan perjuicio o daños en diversos lugares o campos tales como la agricultura, el interior de las casas, bosques, animales de granja o animales domésticos, e higiene. Los lugares en los que los agentes insecticidas y acaricidas se usan realmente, los organismos nocivos como dianas de estos agentes, y el método para usar los mismos, serán descritos en lo sucesivo más específicamente, pero el contenido de la presente invención no está restringido a estos organismos específicos en absoluto.

- 45 El compuesto de la presente invención se puede usar asimismo para la prevención de la reproducción y la exterminación de organismos nocivos tales como artrópodos, moluscos y nematodos, que causarían perjuicio en campos de cultivo, por ejemplo, cultivos de alimentos (por ejemplo, plantas de arroz, cereales tales como cebada, trigo, centeno y avena; maíz, patata, boniato, taro, legumbres tales como sojas, judías adzuki, habas, guisantes,

judías de riñón y cacahuete); vegetales (por ejemplo, col, col china, rábano japonés, nabo, brócoli, coliflor, plantas de cultivo que pertenecen al género Cruciferae tales como Brassica rapa var. pervidis; plantas cucurbitáceas tales como calabaza, pepino, sandía, Cucumis melon var. Makuwa y melón; berenjena, tomate, pimiento verde, okura (*Abelmoschus esculentus*); espinaca (*Spinacia oleracea*), lechuga, raíz de loto (rizoma), zanahoria, bardana, ajo, cebolla y *Allium fistulosum* tal como cebolla galesa); árboles frutales y frutas (por ejemplo, manzana (árboles), fruta cítrica (árboles), pera (árboles), uva (plantas), melocotón (árboles), albaricoque japonés (árboles), cereza (árboles), nuez (árboles), castaña japonesa (árboles), almendra (árboles): *Prunus amygdalus*, plátano (árboles), fresa (árboles)); plantas fragantes y decorativas (por ejemplo, lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta (*Piper nigrum*) y jengibre (*Zingiber officinale*)); cultivos para uso particular (por ejemplo, tabaco (plantas), té (plantas), remolacha azucarera (*Beta vulgaris*) (plantas), caña de azúcar (*Saccharum officinarum*) (plantas), lúpulo (*Humulus Lupulus L.*) (plantas), algodón (plantas), lino (plantas), aceituna (árboles), goma (árboles) y café (árboles)); plantas de pasto y pienso (por ejemplo, timotea (hierba), trébol holandés blanco, trébol carretilla (alfalfa), maíz (plantas), sorgo (plantas), hierba de huerto, pastos que pertenecen al género gramíneas, y pastos que pertenecen a la familia pulso); céspedes (por ejemplo, césped coreano (*Z. tenuifolia* salvaje) y hierba curvada (*Agrostis palustris* Huds.)); árboles forestales (por ejemplo, abetos (*Abies sachalinensis*), abeto blanco (*Picea jezoensis*), pinos (plantas pináceas), hiba arborvitae, cedro japonés (sugi) y hinoki (cedro blanco)); y plantas decorativas (por ejemplo, plantas herbáceas y plantas petalosas tales como crisantemo, rosas, clavel, orquídea, y plantas de jardín tales como ginkgo (árboles), cereza (árboles), y laurel japonés (*Aucuba japonica*)).

Los ejemplos de los organismos nocivos anteriores son como sigue:

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, artrópodos que pertenecen a la orden de Lepidoptera como una clase de insectos en el filo de artrópodo, por ejemplo, polillas de la familia noctuidae (polilla búho) tales como *Helicoverpa armigera*, *Heliothis* spp., *Agrotis segetum*, *Autographa nigrisigna*, *Trichoplusia ni*, *Mamestra brassicae*, *Spodoptera exigua* y *Spodoptera litura*; polillas que pertenecen a la familia Yponomeutidae (polilla armiño) tales como *Plutella xylostella*; polillas que pertenecen a la familia Tortricidae (polilla enrolladora de hojas) tales como *Adoxophyes orana fasciata*, *Adoxophyes honmai*, *Archips fuscocupreanus*, *Homona magnanima*, *Caloptilia theivora* y *Grapholita molesta*; polillas que pertenecen a la familia Psychidae (polilla bagworm) tales como *Eumeta minuscule*; polillas que pertenecen a la familia de Lyonetidae (minadores de hojas) tales como *Lyonetia prunifoliella malinella* y *Lyonetia clerkella*; polillas que pertenecen a la familia de Phyllocnistidae (minador de hojas pequeñas) tales como *Phyllocnistis citrella*, polillas que pertenecen a la familia gracillariidae tales como *Phyllonorycter ringoniella*; polillas que pertenecen a la familia de Acrolepiidae tales como *Acrolepiopsis sapporensis*; polillas que pertenecen a la familia de polillas de alas transparentes tales como *Synanthedon quercus*; polillas que pertenecen a la familia stathmopoda tales como *Stathmopoda masinissa*; polillas que pertenecen a la familia de Gelechiidae tales como *Pectinophora gossypiella*; polillas que pertenecen a la polilla del manzano tales como *Carposina niponensis*; polillas que pertenecen a la familia de polillas orientales tales como *Monema flavescens*, *Parasa lepida* y *scopelodes contractus*; polillas que pertenecen a la familia Ancylomyia japonica Zeller tales como *Chilo suppressalis*, *Scirpophaga incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Hellulla undalis*, *Conogethes punctiferlis*, *Diaphania indica* y *Parapediasia teterrella*; mariposas que pertenecen a la familia Hesperidae (mariposa saltarina) tales como *Parnara guttata*; mariposas que pertenecen a la familia papilionidae (mariposa de cola de golondrina) tales como *Papilio xuthus*; mariposas que pertenecen a la familia de Pieridae tales como *Pieris rapae crucivora*; mariposas que pertenecen a la familia Lycaenidae (mariposa hairstreak) tales como *Lampides boeticus*; polillas que pertenecen a la familia Morpho, *Geometra* tales como *Ascotis selenaria*; polillas que pertenecen a la familia de Notodontidae (familia de la polilla esfinge) tales como *Agrius convolvuli*; polillas que pertenecen a la familia de Sphingidae tales como *Phalera flavescens*; polillas que pertenecen a la familia de Lymantridae (polilla tussock oriental) tales como *Euproctis pseudoconspersa*, *Orygia recens approximans*; polillas que pertenecen a la familia de Arctiidae (polilla tigre de jardín) tales como *Spilosoma imparilis* e *Hyphantria cunea*; *Endopiza viteana* y *Laspeyresia pomonella*.

Los adultos, larvas y huevos de organismos nocivos, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Coleoptera, por ejemplo, insectos que pertenecen a la familia de la chinche dorada tales como *Anomala cuprea*, *Popillia japonica*, *Oxycetonia jucunda* y *Anomala geniculata*; los que pertenecen a la familia de Buprestidae tales como *Agilus auriventris*; los que pertenecen a la familia de Elateridae tales como *Melanotus fortnumi*; los que pertenecen a la familia del escarabajo mariquita tales como *Epilachna virgintioctopunctata*; los que pertenecen a la familia de escarabajos longicornios tales como *Anoplophora malasiaca* y *Xylotrechus pyrrhoderus*; los que pertenecen a la familia de los piojos de los pájaros tales como *Aulacophora femoralis*, *Diabrotica* spp., *Phyllotreta striolata*, *Cassida nebulosa*, *Phaedon brassicae*, *Oulema oryzae*, *Epilachna varivestis* y *Leptinotarsea decemlineata*; los que pertenecen a la familia del gorgojo cortahojas del castaño (*Apoderus jekeli*) tales como *Rhynchites heros*; los que pertenecen a la familia de Brentidae tales como *Cylas formicarius*; los que pertenecen a la familia de Curculionidae tales como *Curculio sikkemensis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Anthonomus grandis grandis* y *sphenophrus venatus vestitus*; los que pertenecen a la familia de itidulidar tales como *Eपुरaea domina*;

Los adultos, larvas y huevos de organismos nocivos, por ejemplo, Heteroptera, que pertenecen al orden Hemiptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Pentatomidae (chinche de escudo) tales como *Eurydema rugosum*, *Eysarcodis lewisi*, *Eysarcodis parvus*, *Nezara viridula*, *Plautia stali* y *Halymorpha mista*; los que pertenecen a la familia de Urostylidae tales como *Urochela luteovoria*; los que pertenecen a la familia de Lygaeidae tales como *Togo hemipterus*; los que pertenecen a la familia de Coreidae tales como *Riptortus clavatus* y *Cletus punctiger*; los que pertenecen a la familia de Alydidae tales como *Leptorisa chinensis*; los que pertenecen a la familia de Riptortus

clavulus tales como *Dysdeercus cingulatus*; los que pertenecen a la familia de la chinche de encaje tales como *Stephanitis nashi* y *Stephanitis pyrioides*; los que pertenecen a la familia de Myridae tales como *Apolygus spinolai*, *Stenotus rubrovittatus*, y *Trigonotylus coelestialium*; los que pertenecen a la familia de la chinche hedionda de la judía tales como *Megacopta punctatissimum*;

- 5 Los adultos, larvas y huevos de organismos nocivos, por ejemplo, Homoptera, que pertenecen al orden Hemiptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Cicadidae tales como *Platypleura kaempferi*; los que pertenecen a la familia de los saltamontes tales como *Arboridia apicalis*, *Empoasca onukii*, *Nephotettix cincticeps* y *Nephotettix virescens*; los que pertenecen a la familia de insectos del arroz tales como *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens* y *Sogatella furcifera*; los que pertenecen a la familia del saltapuntas flárido verde (*Geisha distinctissima* Walker)
- 10 tales como *Geisha distinctissima*; los que pertenecen a la familia de Psyllidae tales como *Psylla pyrusiga* y *Diaphorina citri*; los que pertenecen a la familia de la mosca blanca tales como *Aleurocanthus spiniferus*, *Bemisia argentifolii*, diversos tipos de *Bemisia tabaci*, *Dialeurodes citri* y *Trialeurodes vaporariorum*;

- Organismos nocivos que pertenecen a la familia phylloxera tales como *Viteus vitifolii*; organismos nocivos que pertenecen a la familia de los piojos de las plantas tales como *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis gossypii*, *Aulacorthum solani*, *Brevicoryne brassicae*, *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Aulacorthum magnolia*, *Schizaphis piricola*, *Nippolachnus piri*, *Lipaphis erysimi*, *Hyalopterus pruni*, *Plectrochophorus chrysanthemi*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Megoura crassicauda*, *Sitobion ibarae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Myzus varians*, *Myzus persicae*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Eriosoma lanigerum*, *Icerya purchase*, *Pseudococcus comstocki*, *Phenacoccus viburnae* y *Phenacoccus kraunhiae*; organismos nocivos que
- 15 pertenecen a la familia de insectos de escamas tales como *Ceroplastes ceriferus*, *Ceroplastes rubens*, *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Pseudaulacaspis pentagona* y *Unaspis yanonensis*.

- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Thysanoptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia de los trips tales como *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*, *Thrips setosus*, *Frankliniella intonsa*, *Frankliniella occidentalis* y *Heliothrips haemorrhoidalis*; los que pertenecen a los
- 25 *Phlaeothripidae* tales como *Ponticulothrips diospyrosi* y *Haplothrips aculeatus*.

- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Hymenoptera, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen a la familia Tenthredinidae tales como *Athalia rosae ruficornis* y *Arge pagana*; los que pertenecen a la familia Argidae tales como *Arge mali*; los que pertenecen a la familia Cynipidae tales como *Dryocsmus kuriphilus*; los que pertenecen a la familia Megachilidae (abeja cortahojas) tales como
- 30 *Magachile nipponica nipponica*; los que pertenecen a la familia Formicidae tales como *Formica japonica*;

- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Diptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Cecidomyiidae tales como *Asphondylia yushimai*; la familia Tephritidae (*Trypetidae*) tales como *Rhacochlaena japonica* y *Bactrocera cucurbitae*; los que pertenecen a la familia Ephydriidae tales como *Hydrellia griseola*; los que pertenecen a la familia Drosophilidae tales como *Drosophila suzukii*; la familia
- 35 *Agromyzidae* tales como *Liriomyza trifolii*, *Chromatomyia horticola*, *Agromyza oryzae* y *Liriomyza bryoniae*; los que pertenecen a la familia Anthomyzidae tales como *Delia platura* y *Delia antique*;

- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Orthoptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Gampsocleis *buergeri* (saltamontes) tales como *Ruspolia lineosa*; los que pertenecen a la familia Grillidae (grillo) tales como *Trujalia hibinonis*; los que pertenecen a la familia Gryllotalpidae tales como
- 40 *Gryllotalpa orientalis*; los que pertenecen a la familia Locustidae tales como *Oxya yezoensis*;

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Isoptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Termitidae tales como *Odontotermes formosanus*.

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Dermaptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia de la tijereta gigante, tales como *Labidura riparia*;

- 45 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Collembola en el filo Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Sminthuridae tales como *Sminthurus viridis*; los que pertenecen a la familia Onychiurus tales como *Onychiurus matsumotoi*;

- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Isopoda de la clase Crustacea en el filo Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia de las cochinillas tales como
- 50 *Armadillidium vulgare*;

- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, organismos nocivos que pertenecen al orden Acari como una clase de los arácnidos en el filo Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Tarsonemidae tales como *Polyphagotarsonemus latus* y *Phytonemus pallidus*; los que pertenecen a la familia Eupodidae tales como *Penthaleus major*; la familia Tenuipalpidae tales como *Brevipalpus lewisi* y *Brevipalpus phoenicis*; los que pertenecen a la familia Tetranychidae tales como *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus viennensis*, *Oligonychus ununguis*, *Eotetranychus kankitus* y *Bryobia praetiosa*; los que pertenecen a la familia Eriophyidae tales como *Aculops pelekassi*, *Eriophyes chibaensis*, *Aceria tulipae*, *Colomerus*
- 55

vitis, *Aculus fockeui* y *Calacarus carinatus*; los que pertenecen a la familia Acaridae tales como *Tyrophagus putrescentiae* y *Rhizoglyphus robini*;

5 Organismos nocivos que pertenecen al orden Architaenioglossa como una clase de Gastropoda en el filo Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Pilidae tales como *Pomacea canaliculata*; los que pertenecen al orden Plumonata, por ejemplo, los que pertenecen a la familia del caracol africano gigante tales como *Achatina fulica*, los que pertenecen a la familia Phylomycidae tales como *Meghimatium bilineatum*; los que pertenecen a los Milacidae tales como *Lehmannina valentiana*; los que pertenecen a la familia *Bradybaena similaris* tales como *Acusta despecta sieboldiana*;

10 Organismos nocivos que pertenecen al orden Tylenchida como clase de Secernentea en el filo Nemethelminthes, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Anguinidae tales como *Ditylenchus destructor*; los que pertenecen a la familia Tylenchorhynchidae tales como *Tylenchorhynchida claytoni*; los que pertenecen a la familia *Pratylenchus* tales como *Pratylenchus penetrans* *Pratylenchus coffeae*; los que pertenecen a la familia Haplolaimidae tales como *Helicotylenchus dihystra*; los que pertenecen a la familia Heteroderidae tales como *Globodera rostochiensis*; los que pertenecen a la familia Meloidogyne tales como *Meloidogyne incognita*; los que pertenecen a la familia Criconema tales como *Criconema jaejuense*; los que pertenecen a la familia Anguinidae tales como *Nothotylenchus acris*; los que pertenecen a la familia Aphelecchoides tales como *Aphelecchoides fragariae*; y

Organismos nocivos que pertenecen al orden Dorylaimoidae como clase de los Adenophorea, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Longidorinae tales como *Xiphinema sp.*; y los que pertenecen a la familia *Trichodorus* tales como *Trichodorus sp.*

20 El compuesto de la presente invención se puede usar asimismo para la prevención de la reproducción y la exterminación de organismos nocivos que son activos en el interior de los edificios, incluyendo las casas normales, que por consiguiente causarían daños a, por ejemplo, la madera y muebles de madera, como los artículos procesados de la misma; alimentos almacenados; ropa; y libros o publicaciones, y que por tanto causarían en gran medida un daño a la vida humana. Los ejemplos de tales organismos nocivos incluyen los enumerados a

25 continuación:

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden Isoptera como una clase de los Insecta en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Rhinotermitidae tales como *Sitophilus zeamais* y *Sitophilus zeamais*; los que pertenecen a la familia Bruchidae (Mylabridae) tales como *Callosobruchus chinensis*, *Bruchus pisorium* y *Bruchus rufimanus*; los que pertenecen a la familia Tenebrionidae tales como *Tribolium castaneum* y *Tribolium confusum*; los que pertenecen a la familia Silvanidae tales como *Oryzaephilus surinamensis* y *Cryptolestes pusillus*; los que pertenecen a la familia Anobiidae tales como *Lasioderma serricorne* y *Stegobium paniceum*; los que pertenecen a la familia Dermestidae (escarabajo de piel) tales como *Attagenus unicolor japonicus*, *Anthrenus verbasci* y *Dermestes maculatus*; los que pertenecen a la familia Ptinidae (escarabajo araña) tales como *Gibbium aequinoctiale*; los que pertenecen a la familia Bostrichidae tales como *Dinoderus minutus* y *Rhizopertha dominica*; los que pertenecen a la familia Lyctidae tales como *Lyctus brunneus*;

30

35

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Arguloidea, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Pyralididae (Pyralidae) tales como *Cadra cautella*, *Ephestis kuehniella* y *Plodia interpunctella*; los que pertenecen a la familia Gelechiidae tales como *Sitotroga cerealella*; los que pertenecen a la familia Tineidae tales como *Tinea translucens* y *Tineola bisselliella*;

40 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Psocoptera (Copeognatha), por ejemplo, los que pertenecen a la familia Trogidae (Lepinotus) tales como *Lepinotus reticulatus*; los que pertenecen a la familia de los piojos de los libros tales como *Liposcelis bostrychophilus*;

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Roach (Cockroach), por ejemplo, los que pertenecen a la familia de la chinche Croton tales como *Blattella germanica*; los que pertenecen a la familia Blattidae tales como *Periplaneta fuliginosa* y *Periplaneta japonica*;

45

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Thysanura, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Lepismatidae tales como *Ctenolepisma villosa* y *Lepisma saccharina*;

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de la mosca, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Drosophilidae tales como *Drosophila melangogaster*; y la familia Piophilidae tales como *Piophilidae casei*; y

50

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Acarina en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Acarididae tales como *Tyrophagus putrescentiae* y *Lardoglyphus konoi*; y los que pertenecen a la familia Carpglyphidae tales como *Carpoglyphus lactis*.

55 El compuesto de la presente invención también se puede usar para la prevención de la reproducción y la exterminación de organismos nocivos que causarían daño o debilitarían el vigor y vitalidad de los árboles en los bosques naturales y artificiales, incluidos bosques y sotos, así como las zonas verdes de los pueblos y ciudades.

Los ejemplos específicos de tales organismos nocivos incluyen los enumerados a continuación:

5 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Arguloidea como una clase de Insecta en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Lymantriidae tales como *Calliteara argentata*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Orygia recens approximans*, *Euproctis subflava* y *Lymantria dispar*; los que pertenecen a la familia Lasiocampidae (orugas de librea) tales como *Malacosoma neustria testacea*, *Dendrolimus spectabilis* y *Dendrolimus superans*; la familia Pyralidae (Pyralidae) tales como *Crytoblabes loxiella*; la familia Noctuidae (Phalaenidae) tales como *Agrotis segetum*; los que pertenecen a la familia Tortricidae tales como *Ptycholoma lecheana circumclusana*, *Cydia kurokoi* y *Cydia cryptomeriae*; los que pertenecen a la familia Arctiidae tales como *Spilosoma imparilis* y *Hyphantria cunea*; los que pertenecen a la familia Nepticulidae tales como *Stigmella castanopsiella*; los que pertenecen a la familia Eucleidae tales como *Parasa lepida*, *Scopelodes contracrus* y *Microleon longipalpis*;

15 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Coleoptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Scarabaeidae tales como *Anomala rufocuprea* y *Heptophylla picea*; los que pertenecen a la familia Buprestidae tales como *Agrilus spinipennis*; los que pertenecen a la familia Cerambycidae tales como *Monochamus alternatus*; los que pertenecen a la familia Chrysomelidae tales como *Basilepta pallidula*; la familia Curculionidae tales como *Scepticus griseus* y *Shirahoshizo insidiosus*; los que pertenecen a la familia Rhynchophoridae tales como *Sipalinus gigas*; la familia Scolytidae (o Limnoriidae) tales como *Tomicus piniperda* e *Indocryphalus aceris*; y los que pertenecen a la familia Bostrichidae tales como *Rhizopertha dominica*;

20 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Hemiptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia de los áfidos tales como *Cinara todocola*; los que pertenecen a la familia Chermidae tales como *Adelges japonicus*; los que pertenecen a la familia a la familia Diaspididae (Plataspidae) tales como *Aspidiotus cryptomeriae*; y los que pertenecen a la familia de insectos de escamas duras tales como *Ceroplastes ceriferus*;

25 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Hymenoptera (abejas, o similares), por ejemplo, los que pertenecen a la familia Tenthredinidae tales como *Pachynematus itoi*; los que pertenecen a la familia Diprionidae tales como *Neodiprion sertifer*; y los que pertenecen a la familia Cynipidae tales como *Dryocosmus kuriohilus*;

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Dyptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Tipulidae tales como *Tipula aino*; los que pertenecen a la familia Anthomyzidae tales como *Strobilomyia laricicola*; la familia Cecydomyiidae tales como *Contarinia inouyei* y *Contarinia matsusintome*; y

30 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Acarina como una clase de las arañas en el filo de Arthropoda, por ejemplo, *Oligonichus hondoensis* y *Oligonichus uninguis*; y

Organismos nocivos que pertenecen al orden de Tylenchida en el filo de Secernentea, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Parasitaphelenchidae tales como *Bursaphelenchus xylophilus*.

35 El compuesto de la presente invención se puede usar asimismo para la prevención de la reproducción y la exterminación de organismos nocivos tales como los que pertenecen a Arthropoda, Nematoda, Trematoda, Cestoda y Protozoa, que son interna o externamente parasitarios en los vertebrados, en particular, animales de sangre caliente (homeotermos), por ejemplo, animales domésticos y mascotas tales como bovinos, ovejas, cabras, equinos, porcinos, aves de corral, caninos, felinos y peces, y/o la prevención de estos animales contra el parasitismo con los mismos, y el tratamiento de los animales. Además de los anteriores, las especies animales como sujetos a tratar con el compuesto de la presente invención incluyen asimismo, por ejemplo, otras mascotas y animales usados en experimentos de laboratorio, por ejemplo, los que pertenecen al orden de Rodentia tales como ratones, ratas, hámsters y ardillas; los que pertenecen al orden de Carnivora tales como hurones; y aves tales como patos, y palomas y pichones. Los ejemplos específicos de tales organismos nocivos incluyen los enumerados a continuación:

45 Organismos nocivos que pertenecen al orden de Diptera como una clase de Insecta (Hexapoda) en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Tabanidae tales como *Tabanus rufidens* y *Tabanus chrysurus*; los que pertenecen a la familia Muscidae tales como *Musca bezii*, *Musca domestica* y *Stomoxys calcitrans*; la familia Gasterophilidae tales como *Gasterophilus intestinalis*; los que pertenecen a la familia Hypodermatidae tales como *Hypoderma bovis*; los que pertenecen a la familia Oestridae tales como *Oestrus ovis*;

50 los que pertenecen a la familia Calliphoridae tales como *Aldrichina graham*; y los que pertenecen a la familia Phoridae tales como *Megasera spiracularis*;

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen a la familia Sepsidae (moscas de patas espinosas) tales como *Sepsis punctum*; los que pertenecen a la familia Psychodidae (moscas polilla) tales como *Telmatoscopus albipunctatus* y *Psychoda alternate*; los que pertenecen a la familia Clididae (mosquitos) tales como *Culex pipiens molestus*, *Culex pipiens pallens*, *Anopheles sinensis*, *Culex pipiens triaeniorhynchus summorosus* y *Ades albopictus*; los que pertenecen a la familia Simuliidae (moscas negras) tales como *Simulium iwataense* y *Prosimulium yezoense*; la familia Heleidae (Ceratopogonidae) tales como *Culicoides schulzei* y *Culicoides arakawae*;

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Siphonaptera (Aphaniptera), por ejemplo, los que pertenecen a la familia Pulex (pulga humana) tales como *Pulex irritans* y *Ctenocephalides canis*;

5 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Anoplura (Siphunculata), por ejemplo, los que pertenecen a la familia Echinorhynchus tales como *Haematopinae suis* y *Haematopinae eurytenuis*; los que pertenecen a la familia Trypodyctidae tales como *Damalinea bovis*; los que pertenecen a la familia Linognathidae tales como *Linognathus vituli*; y los que pertenecen a la familia Menoponidae tales como *Menopon gallinae*;

10 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Acarina como una clase de los Arachnida en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Varroidae tales como *Varroa jacobsoni*; la familia Ixodidae tales como *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes ovatus*, *Boophilus microplus* y *Amblyomma testudinarium*; los que pertenecen a la familia Macronyssidae tales como *Ornithonyssus sylvialum*; los que pertenecen a la familia Dermanyssidae (*Dermanyssus gallinae*) tales como *Dermanyssus gallinae*; los que pertenecen a la familia Demodicidae tales como *Demodex phylloides*; los que pertenecen a la familia Sarcoptidae tales como *Sarcoptes scabiei bovis* y *Knemidocoptes mutans*; y los que pertenecen a la familia Psoroptes tales como *Otodectes cynotis* y *Psoroptes communis*;

Organismos nocivos que pertenecen al orden de Strongyloidea como una clase de los Secernentea en el filo de Nematelminthes, por ejemplo, *B. (Bunostomum) phlebotomum* (lombriz intestinal del ganado), *Stephanurus dentatus*, gusano pulmonar, gusano piloso y gusano nodular intestinal del cerdo;

20 Organismos nocivos que pertenecen al orden de Ascarididae, por ejemplo, *A. (Ascaris) suum* (gusano redondo grande del cerdo), y *A. (Ascaridia) galli* (gusano redondo grande del pollo).

Organismos nocivos que pertenecen a la clase de Trematoda en el filo de Platyhelminthes, por ejemplo, *Schistosoma japonicum*, *Fasciola hepatica*, *P. (Paramphistomum) cervi*, *P. (Paragonimus) westermani*, y *f. (lombriz) japonesa del oviducto de las aves de corral*;

25 Organismos nocivos que pertenecen a la clase de Cestoidea (Cestoda), por ejemplo, *A. (Anoplocephala) perfoliata*, *Moniezia expansa*, *Moniezia benedeni*, *R. (Raillietina) tetragona*, Strongyloidea (cavador) *taeniid (R. echinobothrida)* y *R. cesticillus*;

30 Organismos nocivos que pertenecen al orden de los Rhizomastigida como una clase de los Mastigophora (Flagellata) en el filo de Protozoa, por ejemplo, *Histomonas*; los que pertenecen al orden de protomastigida tales como *Leishmania* y *Trypanosoma*; los que pertenecen al orden de flagelados polimastigidos tales como *Giardia*; y los que pertenecen al orden de Trichomonadida tales como *Trichomonas*;

Organismos nocivos que pertenecen al orden de los Amoebida como una clase de los Sarcodina, por ejemplo, *Entamoeba*; y

35 Organismos nocivos que pertenecen a la subclase de los Piroplasma como una clase de Sporozoa, por ejemplo, *Theileria* y *Babesia*; y los que pertenecen a la subclase de Telosporia, por ejemplo, los que pertenecen a, por ejemplo, *Eimeria*, *Plasmodium* y *Toxoplasma*.

40 El compuesto de la presente invención también se puede usar para la exterminación de organismos nocivos que infligirían directamente una lesión en los cuerpos humanos o darían a los seres humanos una sensación desagradable, y para el mantenimiento de las condiciones requeridas para la salud pública contra los organismos nocivos que puedan llevar y/o mediar patógenos. Los ejemplos de tales organismos nocivos incluyen los enumerados a continuación:

45 Organismos nocivos que pertenecen al orden de Arguloidea como una clase de Insecta en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Lymantriidae tales como *Sphrageidus similis*; los que pertenecen a la familia Lasiocampidae tales como *Kunugia undans*; los que pertenecen a la familia Eucleidae tales como *Parasa consocia*; y los que pertenecen a la familia Zygaenidae tales como *Artona martini*;

Organismos nocivos que pertenecen al orden de Coleoptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Oedemeridae tales como *Xanthochroa waterhousei*; los que pertenecen a la familia Meloidae (escarabajos ácidos) tales como *Epicauta gorhani*; y los que pertenecen a la familia Staphylinidae (escarabajos vagabundos) tales como *Paederus fuscipes*;

50 Organismos nocivos que pertenecen al orden de Hymenoptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Vespidae tales como *Vespa similima xanthoptera*; los que pertenecen a la familia Formicidae tales como *Brachyponera chinensis*; y los que pertenecen a la familia Pompilidae tales como *Batozonellus anulatus*;

Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Diptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Culicidae tales como *Armigeres subalbatus*; los que pertenecen a la familia

- 5 Heleidae tales como *Culicoides nipponensis*; los que pertenecen a la familia Tendipedidae tales como *Chironomus voshimatsui*; los que pertenecen a la familia Simuliidae (moscas negras) tales como *Simulium nikkoense*; los que pertenecen a la familia Tabanidae tales como *Hirosia humilis*; los que pertenecen a la familia Muscidae tales como *Musca domestica*; los que pertenecen a la familia Fannia tales como *Fannia canicularis*; los que pertenecen a la familia Calliphoridae tales como *Phormia regina*; y los que pertenecen a la familia Sarcophagidae tales como *Sarcophaga peregrina*;
- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Siphonaptera (Aphaniptera), por ejemplo, los que pertenecen a la familia Pulicidae tales como *Pulex irritans*;
- 10 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Blataria, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Blattellidae tales como *Blattella germanica*; los que pertenecen a la familia Blattidae tales como *Periplaneta americana*, *Periplaneta fuliginosa* y *Periplaneta japonica*;
- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Orthoptera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Rhophidophoridae tales como *Diestrammena japonica* y *Diestrammena apicalis*;
- 15 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Anoplura (Siphunculata), por ejemplo, los que pertenecen a la familia de L. (piojo) Pediculidae (piojo humano) tales como *Pediculus humanus humanus*; y los que pertenecen a la familia del piojo cangrejo tales como *Phthirus pubis*;
- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Hemiptera [Pentatomorpha (Pentatomodea)], por ejemplo, los que pertenecen a la familia Cimicoidea tales como *Cimex lectularius*; los que pertenecen a la familia Reduviidae tales como *Isyndus obscurus*;
- 20 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden Collembola como una clase lateral de Insecta en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Hypogastruridae tales como *Hypogastrura communis*;
- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden Acarina como una clase de Arachnida en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Ixodidae tales como *Ixodes persulcatus*; los que pertenecen a la familia Macronyssidae tales como *Ornithonyssus bacoti*; los que pertenecen al género *Cheyletiella* tales como *Chelacaropsis moorei*; los que pertenecen al género *Pyemotes* tales como *Pyemotes ventricosus*; los que pertenecen al género *Demodex* tales como *Demodex folliculorum*; los que pertenecen a la familia Pyroglyphidae tales como *Dermotophagoides pteronyssinus*; los que pertenecen al género *Sarcoptes* tales como *Sarcoptes scabiei*; y los que pertenecen a la familia Trombiculidae tales como *Trombicula akamushi*;
- 30 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Araneida, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Clubionidae tales como *Chiracanthium japonicum*; los que pertenecen a la familia Sparassidae (Heteropoda) tales como *Heteropoda venatoria*; los que pertenecen a la familia Pholcidae (Spermophora) tales como *Spermophora senoculata* y *Pholcus phalangioides*; los que pertenecen a la familia Uroctea tales como *Uroctea compactilis*; y los que pertenecen a la familia Salticidae tales como *Plexippus paykulli* y *Plexippus adansoni*;
- 35 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden Scorpionida, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Buthidae (escorpión del lejano oriente) tales como *Isometrus europaeus*;
- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden Chilopoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Scolopendridae tales como *Scolopendra subspinipes* y *Scolopendra subspinipes japonica*;
- 40 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden Scutigera, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Scutigera tales como *Scutigera coleoptrata*;
- Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Polydesmidae como una clase de Dipropode en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la familia Paradoxosomatidae tales como *Oxidus gracilis*;
- 45 Los adultos, larvas y huevos de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen al orden de Isopoda como una clase de Crustacea en el filo de Arthropoda, por ejemplo, los que pertenecen a la subclase de Oniscoidea tales como *Porcellio scaber*; y
- 50 Organismos nocivos que pertenecen al género *Hirudo* como una clase de Hirudinea en el filo de Annelida, por ejemplo, los que pertenecen a la familia de la sanguijuela terrestre tales como *Haemadipsa zeylanica japonica*.
- El compuesto de la presente invención es de gran valor, en particular, en la prevención y exterminación de organismos nocivos que causarían daños en los productos agrícolas, árboles en los bosques naturales y artificiales, incluidos bosques y sotos, y las zonas verdes de pueblos y ciudades, así como plantas decorativas, tales como

5 artrópodos, gastrópodos y nematodos. En estas circunstancias, el compuesto de la presente invención puede estar en la forma de una forma industrialmente útil tal como una preparación, y también puede estar en la forma de una preparación mixta obtenida mezclando la preparación anterior o una forma usada en la práctica preparada a partir de aquélla con otros compuestos activos tales como un insecticida, un acaricida, un nematocida, un bactericida, un sinergista, un agente controlador de plantas, un cebo de veneno, y/o un herbicida.

10 Los ejemplos de las formas de dosificación del compuesto de la presente invención incluyen polvos dispersables en agua, gránulos dispersables en agua, soluciones acuosas, emulsiones, líquidos, preparaciones capaces de fluir tales como suspensiones acuosas y emulsiones acuosas, cápsulas, polvos, gránulos, cebos y aerosoles. En cada una de estas preparaciones, el compuesto de la presente invención se incorpora, en las mismas, en una cantidad total que varía usualmente de 0,001 a 95% en masa y preferiblemente 0,1 a 60% en masa.

15 Para impedir la reproducción de y exterminar los organismos nocivos anteriores tales como artrópodos, gastrópodos y nematodos, la preparación mencionada anteriormente que contiene el compuesto de la presente invención es normalmente pulverizada o distribuida sobre los lugares o áreas en los que los productos agrícolas o similares sufren daños debido al brote de la plaga y la reproducción de organismos nocivos, o aquellos que pueden ser altamente susceptibles de los daños por la acción de tales organismos nocivos. A este respecto, la preparación se pulveriza sobre las hojas y tallos de las plantas y, alternativamente, se puede usar asimismo mezclando la preparación con la capa entera de la tierra; aplicando la misma a los surcos; mezclando la misma con la tierra del lecho del vivero; tratando los plántones divididos celularmente con la misma; tratando los hoyos de plantación con la misma; aplicando la misma a los pies de la planta; tratando según la técnica de recebado (topdressing); tratando las cajas para acomodar las plantas de arroz; aplicando la misma a la superficie del agua; y dejando que la misma se absorba a través de las raíces de las plantas después de tratar la tierra con la misma. Además, el compuesto de la presente invención se puede usar también mediante la inmersión de las semillas en los productos químicos agrícolas; mediante el recubrimiento de las semillas con los mismos; mediante el tratamiento de las semillas mediante, por ejemplo, el revestimiento KARUPA; mediante la aplicación de los mismos a la solución nutriente usada para la nutricultura o hidropónicos; o mediante la aplicación de los mismos mediante la técnica de ahumado o cortina de humo o la técnica de inyección del tronco.

20 Cuando se usa en la práctica el compuesto de la presente invención o la preparación mencionada anteriormente, la cantidad del mismo a usar puede variar dependiendo de diversos factores, tales como los tipos de organismos nocivos a controlar, la cantidad de aparición de los mismos, los tipos de los cultivos destinados (productos de granja) y/o los árboles y arbustos a tratar, así como los métodos de cultivo y las condiciones de crecimiento y desarrollo de los mismos, pero el compuesto o la preparación se aplica en general en una cantidad que varía de 0,1 a 1.000 g por 10 áreas y preferiblemente 1 a 100 g por 10 áreas, expresado en términos de la cantidad del compuesto de la presente invención. En el caso de usar, por ejemplo, un polvo dispersable en agua, un gránulo dispersable en agua, una disolución acuosa, una emulsión acuosa, un líquido o una preparación capaz de fluir tal como una suspensión acuosa o una emulsión acuosa, o una cápsula, sería suficiente que tal preparación se diluyera primero con agua y que la dispersión acuosa resultante se rociara después sobre, por ejemplo, las plantas de cultivo destinadas o diana en una cantidad aplicada que varía de 10 a 1.000 L por 10 áreas, aunque la cantidad puede variar dependiendo de los tipos de plantas a tratar y los métodos de cultivo y las condiciones de crecimiento y desarrollo de las mismas. Por otro lado, en el caso de un polvo o un aerosol, se puede usar la preparación per se para el tratamiento de, por ejemplo, una planta de cultivo.

25 Si las plantas son dañadas por organismos nocivos a ser controlados principalmente dentro del suelo, o si el organismo nocivo diana es controlado dejando que las plantas absorban tal producto químico agrícola o preparación a través de las raíces de las mismas, la preparación se aplica a las plantas según, por ejemplo, uno de los siguientes métodos: un método comprende la etapa de aplicar la preparación a los pies de las plantas o al lecho usado para el cultivo de plántones con o sin la dilución de la misma con agua; un método comprende rociar una preparación granular sobre los pies de las plantas o el lecho del vivero usado para el cultivo de plántones; un método comprende la etapa de rociar la preparación, que puede estar en la forma de, por ejemplo, un polvo, un polvo dispersable en agua, un gránulo dispersable en agua o un gránulo, sobre la tierra antes de la siembra o el trasplante del plánton para mezclar así la preparación con la tierra entera; o un método comprende la etapa de rociar la preparación, que puede estar en la forma de, por ejemplo, un polvo, un polvo dispersable en agua, un gránulo dispersable en agua o un gránulo, sobre los hoyos de plantación, los surcos de plantación o similares, antes de la siembra o la plantación de las plantas.

30 Cuando se usa la preparación que está en la forma de, por ejemplo, un polvo dispersable en agua, un gránulo dispersable en agua, una solución acuosa, una emulsión, un líquido, una preparación capaz de fluir tal como una suspensión acuosa o una emulsión acuosa, o una cápsula, sería suficiente que la preparación se diluyera primero con agua y la dispersión acuosa resultante se aplicara después en una cantidad de aplicación que varía generalmente de 5 a 500 L por 10 áreas, de tal manera que la preparación fuera rociada uniformemente sobre la superficie del suelo en todo el área entera a tratar, o la preparación se inyectara en el suelo mediante impregnación, mientras que si se usa la preparación en la forma de, por ejemplo, un polvo, un gránulo o un cebo, la preparación per se se rocía uniformemente sobre la superficie del suelo en todo el área entera a tratar. A este respecto, el rociado o impregnación se puede llevar a cabo asimismo en la periferia o circunferencia de las semillas, plantas de cultivo o árboles o arbustos a proteger de ser dañados. Alternativamente, el ingrediente activo puede ser dispersado

mecánicamente en todo el terreno de cultivo arando el área a tratar durante y/o después del rociado de la preparación.

5 Cuando se aplica la preparación a las cajas usadas para cultivar plántones de arrozales, la forma de la preparación puede variar a veces dependiendo del tiempo o estación para aplicar la preparación, por ejemplo, el tiempo para llevar a cabo la siembra, el tiempo de reverdecimiento o forestación o el tiempo de trasplante, pero sería suficiente que la preparación se usara en la forma de, por ejemplo, un polvo, un gránulo dispersable en agua o un gránulo. Alternativamente, la preparación se puede aplicar asimismo mezclando la misma con la tierra para el cultivo, y más particularmente, la tierra para el cultivo se puede mezclar con, por ejemplo, un polvo, un gránulo dispersable en agua o un gránulo. Por ejemplo, se puede mezclar con la tierra tal como la tierra del lecho del vivero, la tierra de recubrimiento o la tierra para el cultivo. Además, la tierra para el cultivo y las diversas preparaciones pueden ser dispuestos simplemente de manera alterna en capas de la misma manera.

10 Como método para aplicar la preparación a los arrozales, la preparación se rocía usualmente sobre el arrozal en su estado de inundación, que está en la forma de, por ejemplo, una preparación sólida tal como una preparación jumbo, una preparación envasada, un gránulo o un gránulo dispersable en agua; o una preparación líquida tal como una preparación capaz de fluir o una emulsión. Además de lo anterior, también es posible rociar una preparación, en su forma de dosificación apropiada, sobre la tierra o inyectar tal preparación en la tierra sin ningún pretratamiento o después de mezclar la misma con, por ejemplo, fertilizante y abono, durante la estación para trasplantar el plánton de arroz. Además, la preparación en la forma de, por ejemplo, una emulsión o una preparación capaz de fluir se puede añadir o aplicar a la fuente de agua, tal como un dispositivo de irrigación, para suministrar agua a un arrozal en, por ejemplo, la toma de entrada. En este caso, la preparación se puede aplicar al arrozal mediante el suministro de agua al mismo de una manera que ahorra mucho trabajo.

15 Si las semillas se tratan con el compuesto de la presente invención o la preparación anterior que contiene el mismo, el tratamiento se puede llevar a cabo, por ejemplo, según uno cualquiera de los siguientes métodos: un método en el que una preparación líquida o sólida es adherida a o permeada en las semillas sumergiéndolas en una preparación líquida después de diluir, si fuera necesario, la preparación anterior; un método en el que una preparación líquida o sólida es mezclada con las semillas o estas últimas son aderezadas con aquella para hacer así que la preparación se adhiera a la superficie de las semillas; un método en el que las semillas son revestidas con una preparación después de que esta última se mezcle con un vehículo adhesivo tal como una resina o un polímero; o un método que comprende la etapa de rociar una preparación sobre el área cercana a las semillas simultáneamente con la siembra. A este respecto, el término "semilla(s)" usado en el tratamiento de semillas anterior en la presente memoria significa el cuerpo de la planta en la fase inicial de cultivo que se usa para la propagación o reproducción de una planta, y los ejemplos específicos del mismo incluyen, además de semillas, bulbos, tubérculo, tubérculo de semilla o patata de semilla, brotes de tocones, propágulos, (incluyendo brotes anchos y bulbillos), bulbos escamosos o cuerpos vegetales usados para plantar esquejes o propagación vegetativa. Además, el término "tierra" o "vehículo para crecimiento o cultivo" usado en la presente memoria tras la aplicación de la preparación significa un soporte o sustrato para cultivar plantas de cultivo, en particular, uno en el que las plantas de cultivo pueden echar raíces. En la presente invención, los materiales de la misma no están restringidos a ninguno particular, en tanto en cuanto permitan el crecimiento o propagación de las plantas, y pueden ser la llamada tierra, las esteras para cultivar plántones y el agua. Los ejemplos específicos de tal soporte incluyen arena, piedras pómez, vermiculita, tierra de diatomeas, agar, materiales similares a geles, sustancias de alto peso molecular, lana mineral, lana de vidrio, astillas de madera, y corteza de árbol.

20 Además de la aplicación directa de la preparación a las semillas, cuando se aplica la preparación durante el tiempo de siembra de una variedad cultivada que es sometida posteriormente a trasplante o durante el tiempo de cultivar plántones, los usos preferiblemente en la presente memoria incluyen, por ejemplo, la inundación del lecho usado para cultivar plántones con la preparación en su estado líquido o la pulverización del mismo con una preparación granular. Además, también se usa preferiblemente en la presente memoria, por ejemplo, el tratamiento de los hoyos de plantación con una preparación granular en el momento de la plantación y la mezcla de tal gránulo con el vehículo usado para cultivar plantas y presente en la proximidad del lugar para el trasplante.

25 El compuesto de la presente invención es también valioso en la protección de la madera (tal como árboles vivos, árboles caídos, madera procesada, madera almacenada o madera estructurada) de ser dañada por la acción de organismos nocivos tales como los que pertenecen al orden de Termitidae o la clase de Coleoptera. En tales circunstancias, la protección de la misma se puede conseguir cuando la madera y la tierra que rodea la misma son tratados con, por ejemplo una solución oleosa, una emulsión, un polvo dispersable en agua o una preparación similar a un sol mediante rociado, inyección, irrigación o recubrimiento, o se trata con, por ejemplo, un polvo o un gránulo mediante rociado. Además, la solución oleosa, emulsión, polvo dispersable en agua y polvo se pueden usar en la forma de una formulación mixta con otros compuestos activos tales como un agente insecticida, un agente acaricida, un agente nematocida, un agente bactericida, un repelente o un sinergista, y cada una de estas preparaciones puede comprender el compuesto de la presente invención en una cantidad total que varía de 0,0001 a 95% en masa y preferiblemente 0,005 a 10% en masa para la solución oleosa, polvo y gránulo, y 0,01 a 50% en masa para la emulsión, polvo dispersable en agua y preparación similar a un sol. Cuando se controlan los organismos nocivos que pertenecen a, por ejemplo, el orden de Termitidae o la clase de Coleoptera, la preparación se rocía sobre la superficie de la madera o la tierra en una cantidad que varía de 0,01 a 100 g/m<sup>2</sup> expresada en

términos de la cantidad del compuesto como ingrediente activo.

El compuesto de la presente invención se puede usar para la protección de productos tales como granos, frutas, nueces y bayas, especias y tabaco de ser dañados por organismos nocivos tales como los que pertenecen a, por ejemplo, el orden de Arguloidea, la clase de Coleoptera y la clase de Acarina, cuando los productos son almacenados sin ningún pretratamiento particular o en sus estados en polvo o en la forma de productos procesados con los que son mezclados. Alternativamente, el compuesto de la presente invención se puede usar asimismo para la protección de productos animales (tales como cuero, pieles, lana y plumas) y productos vegetales (tales como algodón y papel) del ataque de organismos nocivos tales como los que pertenecen al orden de Arguloidea, la clase de Coleoptera, la clase de Thysanura y la familia de Blattidae, cuando los productos son almacenados en sus condiciones naturales o en sus estados convertidos. Además, el compuesto de la presente invención también puede proteger alimentos tales como carnes y pescados del ataque de organismos nocivos tales como los que pertenecen al orden de Arguloidea, la clase de Coleoptera, la clase de Acarina y moscas, cuando se almacenan. Bajo tales circunstancias, los organismos nocivos anteriores pueden ser controlados rociando los productos con una preparación tal como una solución oleosa, una emulsión, un polvo dispersable en agua, o un polvo; mediante el establecimiento de, por ejemplo, una preparación que contiene resina para transpiración; mediante el tratamiento de los mismos con un agente de ahumado o un aerosol; mediante el establecimiento de un gránulo, un comprimido y un cebo de veneno; o rociando el mismo con un aerosol. A este respecto, cada una de estas preparaciones se puede usar en la forma de una formulación mixta con otros compuestos activos tales como un agente insecticida, un agente acaricida, un agente nematocida, un agente bactericida, un repelente o un sinergista, y cada una de estas preparaciones puede comprender el compuesto de la presente invención en una cantidad total que varía de 0,0001 a 95% en masa.

El compuesto de la presente invención también puede ser eficaz para el control de artrópodos que puede ser parasitarios en la superficie corporal del ser humano y los animales domésticos para infligir directamente así lesiones sobre los mismos, tales como la ingestión de la piel o el chupado de la sangre de los mismos; y/o los que pueden causar la propagación de enfermedades en el ser humano y los animales domésticos o que pueden servir como mediadores de tales enfermedades, tales como organismos nocivos que pertenecen a, por ejemplo, Arthropoda, Nematoda, Tremadoda, Cestoda y Protozoa; y/o los que pertenecen a Arthropod que pueden dar una sensación desagradable al hombre, tales como Arthropoda. Bajo tales circunstancias, el compuesto de la presente invención puede ser administrado a estos animales después de ser incorporado en las harinas o piensos en una pequeña cantidad; o se forma como una composición apropiada, ingerible por vía oral y compuesta, que contiene un vehículo farmacéuticamente aceptable y/o una sustancia de revestimiento, tal como un comprimido, una píldora o glóbulo, una cápsula, una pasta, un gel, una bebida, un pienso medicinal, un agua para beber medicinal, un pienso suplementario medicinal, una píldora gigante de liberación sostenida u otros dispositivos de liberación sostenida, cada uno de los cuales está diseñado para que pueda ser retenido dentro de los tractos gastrointestinales; o el compuesto de la presente invención se puede administrar asimismo después de ser incorporado en una composición administrable por vía percutánea que contiene el mismo, tal como un pulverizador, un polvo, una grasa, una crema, una pomada, una emulsión, una loción, una preparación para aplicación por moteado, una preparación para aplicación por vertido o un champú. Para conseguir tales efectos, el compuesto de la presente invención puede ser incorporado en la preparación anterior en una cantidad que varía corrientemente de 0,0001 a 0,1% en masa y preferiblemente 0,001 a 0,01% en masa. A este respecto, como medio para la administración percutánea o local del compuesto de la presente invención, también es posible usar un dispositivo (tal como una gargantilla o un collar, un medallón, o una etiqueta para la oreja), que puede ser fijado a los animales para controlar local o sistémicamente artrópodos.

Se describirán a continuación métodos específicos para administrar el compuesto de la presente invención, como antiparasitario, a animales tales como animales domésticos o el hombre, pero la presente invención no está restringida a estos métodos específicos en absoluto.

Cuando se administra por vía oral en la forma de un agua para beber medicinal, el agua para beber es en general una solución, una suspensión o una dispersión, en la que el compuesto de la presente invención está disuelto, suspendido o disperso en un disolvente no tóxico apropiado o agua junto con un agente de suspensión o un agente humectante tal como bentonita u otros excipientes. En general, la bebida también comprende un agente antiespumación. Tal preparación en la forma de una bebida puede comprender usualmente el compuesto de la presente invención en una cantidad que varía e 0,01 a 1,0% en masa y preferiblemente 0,01 a 0,1% en masa.

En el caso donde es deseable administrar por vía oral el compuesto de la presente invención en la forma de una forma de dosificación seca, sólida y unitaria, el compuesto se usa en general como una cápsula, una píldora o un comprimido, que comprende una cantidad deseada del ingrediente activo. Cada una de estas formas de dosificación se puede preparar mezclando uniformemente el ingrediente activo con un diluyente, una carga, un disgregante y/o un aglutinante, que han sido finamente divididos de antemano, tales como almidón, lactosa, talco, estearato de magnesio y/o gomas vegetales. En estas preparaciones para dosificación unitaria, la masa de tal antiparasitario y el contenido del ingrediente activo del mismo pueden ser cambiados ampliamente dependiendo de diversos factores tales como los tipos de animales huésped a tratar, el grado de la infección, los tipos de parásitos y el peso corporal del huésped a tratar.

Cuando se administra el compuesto de la presente invención en la forma de un pienso para animales, el compuesto

se puede usar dispersando uniformemente el mismo dentro de un pienso, mediante el uso del compuesto como capa de abono, o formándolo como un gránulo. Para conseguir un efecto antiparasitario deseado, es usual incorporar, en un pienso final, el compuesto de la presente invención en una cantidad de, por ejemplo, 0,0001 a 0,05% en masa y preferiblemente 0,0005 a 0,01% en masa.

- 5 Si el compuesto de la presente invención está disuelto o disperso en un vehículo o excipiente líquido, el líquido o dispersión resultante puede ser administrado por vía parenteral a animales mediante la inyección del mismo en el proventrículo o mediante la ruta intramuscular, intratraqueal o subcutánea. Para administrar por vía parenteral el compuesto de la presente invención a animales, el compuesto activo puede ser mezclado adecuadamente con un aceite vegetal apropiado tal como aceite de cacahuete o aceite de semilla de algodón. Tal formulación puede comprender en general el compuesto de la presente invención en una cantidad que varía de 0,05 a 50% en masa y preferiblemente 0,1 a 5,0% en masa.

Además, el compuesto de la presente invención se puede administrar localmente a animales si se mezcla con un vehículo apropiado, tal como dimetilsulfóxido o un disolvente hidrocarbonado. Esta preparación se aplica directamente sobre la superficie externa de un animal mediante rociado o vertido directo de la preparación.

- 15 El compuesto de la presente invención también se puede usar como antiparasitario para controlar los organismos nocivos tales como los que pertenecen a Arthropoda que pueden infligir directamente una lesión al ser humano y los animales o para controlar los organismos nocivos tales como los que pertenecen a Arthropoda que pueden servir como medio para diversas enfermedades, según, por ejemplo, uno de los siguientes métodos: un método en el que una solución oleosa, una emulsión, un polvo dispersable en agua o similar es, por ejemplo, rociado sobre, inyectado en, irrigado, revestido sobre el entorno circundante en el que estos organismos nocivos habitan; un método en el que un polvo o similar es rociado sobre tal región del entorno; un método en el que tal región del entorno es tratada con un fumigante, un incienso repelente de mosquitos, un fumigante autocombustible, un agente nebulizador de tipo calentamiento tal como uno de tipo reaccionante químicamente, un agente ahumante tal como nebulizante, o un agente ULV; un método en el que un gránulo, un comprimido o un cebo de veneno es distribuido dentro de tal región del entorno; o un método en el que un polvo flotante, un gránulo o similar es añadido gota a gota a agua corriente o agua no corriente tal como agua en, por ejemplo, vías de agua, pozos, reservorios o tanques de almacenamiento de agua. Además, también sería eficaz para controlar o exterminar los insectos que pertenecen a la familia de Lymantriidae, que son también dañinos para cultivos agrícolas y plantas en el bosque, según los mismos métodos discutidos anteriormente; para controlar o exterminar las moscas según un método que comprende la etapa de incorporar el ingrediente activo en piensos para animales domésticos para que los excrementos del mismo contenga el ingrediente activo; o para controlar o exterminar los insectos que pertenecen a, por ejemplo, la familia de Culicidae (mosquitos) según un método que comprende la etapa de, por ejemplo, evaporar el ingrediente activo en el aire mediante el uso de un dispositivo repelente de mosquitos eléctrico. A este respecto, las preparaciones de tales formas de dosificación se pueden usar asimismo en la forma de una formulación mixta que contiene simultáneamente otros compuestos activos tales como un agente insecticida, un agente acaricida, un agente nematocida, un agente bactericida, un repelente o un sinergista, y estas preparaciones comprenden deseablemente cada una el compuesto de la presente invención en una cantidad total que varía de 0,0001 a 95% en masa.

- El compuesto de la presente invención puede estar presente como una formulación mixta con otros compuestos activos. En particular, cuando se usa en combinación con un compuesto (matachinchas) que tiene una actividad insecticida, una actividad acaricida o una actividad nematocida, el espectro de la enfermedad y los organismos nocivos como diana del compuesto de la presente invención puede hacerse más amplio desde el punto de vista del control de, por ejemplo, los organismos nocivos que pertenecen a, por ejemplo, Arthropoda, Gastropod y Nematoda, que infligirían un daño a las plantas, y esto puede mostrar por consiguiente efectos sinérgicos tales como la reducción de la cantidad de productos químicos agrícolas a usar. Los ejemplos específicos de tales compuestos activos utilizables en la presente invención incluyen los enumerados a continuación:

- Compuestos orgánicos que contienen átomos de fósforo, tales como azinfos-metilo, acefato, clorpirifos, daizinin, diclorvos, dimeton-S-metilo, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotón, etián, enitrotión, fentión, isoxatión, malatión, metamidofos, metidatión, monocrotofos, naled, oxideprofos, paratión, fentoato, fosalona, pirimifos-metilo, piridafentión, profenofos, protiofos, propafos, piraclifos, salitión, sulprofos, tiometón, tetraclorvinfos, triclorfón y vamidotión;

Insecticidas de carbamato tales como alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, furatiocarb, isoprocarb, methomyl, metolcarb, pirimicarb, propoxur y tiodicarb;

Insecticidas orgánicos que contienen átomos de cloro, tales como aldrin, clordano, DDT (p,p'-DDT), endosulfan y lindano;

- 55 Productos químicos agrícolas de tipo piretrida tales como acrinatrina, aletrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, deltametrina, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenprox, fluvalinato, furametrina, halfenprox, imiprotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina y transflutrina;

Productos químicos agrícolas de tipo neonicotinoide tales como acetamiprida, clotianidina, dinjotefran, imidacloprid, pitempyram, tiacloprid y tiametoxam;

5 Reguladores del crecimiento de insectos, por ejemplo, agentes que contienen fenilbenzoil-urea tales como clorfluazuron, diflubenzuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron, buprofezina, cromafenozida, helofenozida, metoxifenozida, tebufenozida y ciromazina;

Hormonas juveniles tales como diofenolano, fenoxicarb, hidropreno, metopreno y piriproxifeno;

Sustancias insecticidas producidas por microorganismos tales como abamectina, emamectina-benzoato, ivermectina, lepimectina, milbemectina, nemadectina, Nikkomicina, espinetram, espinosad y preparación BT;

10 Sustancias insecticidas derivadas de sustancias existentes en la naturaleza tales como anabasina, azadiractina, deguelina, glicéridos de ácidos grasos tales como decanoil octanoil glicerol, almidón hidroxipropílico, lecitina de soja (lecitina), lepimectina, nicotina, nor nicotina, sal sódica del ácido oreico, aceite de petróleo, monolaurato de propilenglicol, aceite de colza y rotenona;

15 Otros insecticidas tales como acetoprol, bentsultap, cartap, chiociclam, clorantranilipirora, clorfenapir, diafentiuiron, etiprol, fipronil, flonicamid, flubenzamid, hidrametilnon, indoxacarb, metaflumizona, metaldehído, sulfato de nicotina, pimetrozina, piridalilo, pirfluquinqzon, espirotetramat, tolfenpirad y triazamato;

Acaricidas tales como acequinocilo, amitraz, azociclotina, benzoximato, bifenazato, binapacril, bromopropilato, chinometionato, clofentezina, cienopirafeno, ciflumetofeno, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaflor, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacipirim, hexitiazox, pirimidifeno, polinactinas, propargita, piridabeno, espirodiclofeno, espiromesifeno, tebufenpirad y tetradifon;

20 Nematocidas tales como fosfuro de aluminio, benclotiaz, cadusafos, etoprofos, ostiazato, imiciafos, hidrocloreto de levamisol, mesulfenfos, metam-amonio, isotiocianato de metilo, moranteltartarato y oxamil; y

Como cebos de veneno, por ejemplo, se enumeran clorfacinona, cumatetralilo, difacinona, fluoroacetato de sodio y warfarina.

25 El compuesto de la presente invención puede estar en la forma de una formulación mixta que comprende el mismo en combinación con otro compuesto activo además del compuesto anterior que tiene un efecto insecticida, acaricida o nematocida. Si el compuesto de la presente invención se usa en combinación con tal otro compuesto que tiene una actividad bactericida o herbicida o una actividad de controlar el crecimiento de las plantas para controlar cualquier enfermedad y/o para controlar el crecimiento de malas hierbas, que son generados simultáneamente en el momento de la aplicación del compuesto de la presente invención o una preparación que contiene el mismo, se  
30 esperaría que el trabajo requerido para su control pueda ser ciertamente reducido y que se pueden conseguir efectos sinérgicos tales como la reducción de la cantidad requerida de los productos químicos agrícolas. Además, si el compuesto de la presente invención se usa en combinación con un repelente y/o un sinergista, se esperaría conseguir un efecto de control más eficaz, tal como un efecto sinérgico.

Los ejemplos específicos de tales compuestos activos incluyen los enumerados a continuación:

35 Agentes bactericidas tales como D-D (1,3-dicloropropeno), acibenzolar-S-metilo, amisulbrom, triazina (anilazina), azoxistrobina, sulfato básico de cobre, benomil, bentiavalicarb-isopropilo, bentiazol, bitertanol, blasticidina S, boscalid, bromuconazol, carbonato de calcio, azufre de cal (polisulfuro de calcio), captan, carbendazim, carpropamid, chinometionato, cloroneb, cloropicrina, clorotalonilo, DBEDC (complejo de bis(etilendiamina)cobre-bis-  
40 (ácido dodecibencenosulfónico), hidróxido de cobre, nonilfenolsulfonato de cobre, cloruro básico de cobre (oxicloruro de cobre), ciazofamid, ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinilo, dazomet, diclofuanida, diclocimet, diclomezina, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetomorf, ditano-inoxidable, ditianon, dodina, eclomezol, edifenfos, extracto derivado de micelia de Cortinellus shiitake (seta) (extracto de setas), fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamid, fenoxanol, ferimzona, fluazinam, flumetover, fluopicolida, fluoroimida, fluquinconazol, flusulfamida, flutolanil, fosetil-Al, ftalida, fuldioxonil, furametpir, furconazol, hexaconazol, hidroxioxazol, himexazol,  
45 imibenconazol, iminocadina acetato, iminocadina-DBS, ipconazol, IBP (iprobenfos), iprodiona, iprovalicarb, isoprotilano, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, maneb, manzeb, mepanipirim, mepronil, metalaxilo, NCS (metam-amonio), metam-sodio, metconazol, metasulfocarb, bromuro de metilo, isotiocianato de metilo, metominostrobrina, mildiomicina, miclobutanilo, azufre orgánico-sal de níquel (dimetilditiocarbamato de níquel), orisastrobina, oxadixilo, organocobre (oxina-cobre), ácido oxolínico, fumarato de oxpoconazol, oxicarboxina,  
50 oxitetraciclina, pebulato, pefurazoato, pencicuron, pentiopirad, policarbamato, polioxina B, complejos de polioxina (polioxinas), hidrogenocarbonato de potasio, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, piraclostrobina, pirazofos, pirifenox, pirimetanil, piroquilon, quintozeno, plata, simeconazol, hidrogenocarbonato de sodio, hipoclorito de sodio, espiroxamina, estreptomocina, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tetraconazol, tiabendazol, tiadiazina, trifluzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclofos-metilo,  
55 tolilfluanida, triadimefon, triadimenol, tricloflazol, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, tritioconazol, validamicina (-A), vinclozolina, sulfato de cinc, zineb y ziram.

Los ejemplos de compuestos que muestran actividades herbicidas incluyen los enumerados a continuación:

5 Aclonifen, acifluofe n-sodio, alaclor, aloxidim, amicarbazona, amidosulfuron, anilofos, asulam, atrazina, azimsulfuron, benfuresato, bensulfuron-metilo, bentazona, bentiocarb, benzobiciclon, benzofenap, bialafos, bifenox, bromobutida, bromoxinilo, butamifos, cefenstrol, peróxido de calcio, carbetamida, cinosulfuron, clomeprop, ciclosulfamuron, cihalofop-butilo, daimuron, desmedifam, diclofop-metilo, diflufenican, dimefuron, dimetametrina, dinoterb, diquat, diuron, esprocarb, etiozina, etofumesato, etoxisulfuron, etobenzanida, fenoxaprop-P-etilo, fentrazamida, flucarbazona, flufenacet, flurtamona, flutiacet-metilo, foramsulfuron, glufosinato-amonio, glifosato-isopropilamina, glifosato-trimesio, imazapir, imazosulfuron, indanofan, iodosulfuron, ioxinil-octanoato, isoproturon, isoxadifeno, isoxaflutol, lactofeno, linuron, mefenacet, mesosulfuron, metamitron, metabenziazuron, metosulam, metribuzin, nanopropamida, neburon, oxadiargilo, oxadiazon, oxaziclomefona, paraquat, pendimetalina, pentoxazona, fenmedifam, pretilaclor, propoxicarbazona, prosulfocarb, piraclonilo, piraflufe n-etilo, pirazolato, pirazosulfuro n-etilo, piributicarb, pirifalida, piriminobac-metilo, quizalofop-etilo, setoxidim, simazina, sulcotrion, sulfentrazona, tenilclor, triaziflam y tribufos.

15 Además, el compuesto de la presente invención también se puede usar en combinación con compuestos que muestran cada uno una acción inhibitoria del crecimiento de las plantas, por ejemplo, ácido 1-naftilacético, 4-CPA (4-CPA), bencilaminopurina (6-bencilamino-purina), butralina, cloruro de calcio, forniato de calcio, peróxido de calcio, sulfato de calcio, cloruro de cloromequat, colina, cianamida, ciclanilida, daminozida, alcohol decílico, dichjoprop, etefon, etilclozato, flurprimidol, forclorfenuron, ácido giberélico, ácido indolbutírico, hidrazida maleica sal de potasio, mefenpir, cloruro de mepiquat, sulfato de oxina (sulfato de 8-hidroxiquinolina), paclobutrazol, parafina, prohexidiona calcio, prohidrojasmon, tidiazuron, trinexapac etilo, uniconazol-P y/o cera.

20 Los ejemplos de repelentes utilizables en la presente memoria incluyen capsaicina, carano-3,4-diol, citronelal, deet, ftalato de dimetilo, hinokitiol, limoneno, linalool, mentol, mentona, naftaleno y thiram;

25 Los ejemplos de sinergistas utilizables en la presente memoria incluyen metilendioxi-naftaleno, éter naftilpropilínico, tiocianato de nitrobenilo, éter octaclorodipropílico, pentinilftalimida, fenilsalioxon, butóxido de piperonilo, safrol, sésamo, sesamina, sulfóxido, fosfato de trifenilo y verbutina.

30 Los compuestos de la presente invención se pueden usar en combinación con un producto químico agrícola biológico, los ejemplos específicos de los cuales se enumerarán a continuación, para conseguir así los efectos de control de organismos nocivos similares a los especificados anteriormente: preparaciones que contienen virus, tales como virus de polihedrosis citoplásmica (CPV), virus entomopox (CPV), virus de la granulosis (GV) y virus de polihedrosis nuclear (NPV); productos químicos agrícolas microbiológicos, que se usan como insecticidas o nematocidas, tales como Beauveria bassiana, Beauveria brongniartii, Monacrosporium phymatophagum, Paecilomyces fumosoroseus, Pasteuria penetrans, Steinernema carpocapsae, Steinernema glaseri, Steinernema kushidai y Verticilliumlecanii; y Agrobacterium radiobactor;

35 Productos agrícolas biológicos usados como bactericidas contra, por ejemplo, Bacillus subtilis, Erwinia carotovora no patógena, Fusarium oxysporum no patógeno, Pseudomonas CAB-02, Pseudomonas fluorescens, Talaromyces, Trichoderma atroviride y Trichoderma lignorum; y productos químicos agrícolas usados como herbicidas, tales como Xanthomonas campestris.

40 Además, también es posible usar el compuesto de la presente invención en combinación con organismos capaces de servir como enemigos naturales, tales como Amblyseius californicus, Amblyseius cucumeris, Amblyseius degenerans, Aphidius colemani, Aphidoletes aphidimyza, Chrysoperia carnea, Dacnusa sibirica, Diglyphus isaea, Encarsia Formosa, Eretmocerus eremicus, Franklinothrips vespiformis, Harmonia axyridis, Hemiptarsenus varicornis, Neochrysocharis Formosa, Orius sauteri, Orius strigicollis, Phytoseiulus persimilis, Pilophorus typicus y Plocoris varius; y agentes que contienen feromonas tales como codlure, cuelure, geraniol, giptol, liblure, looplure, metileugenol, orflalure, peachflure, phycilure, pyrimalure y turpentina.

#### 45 Ejemplos

Ahora, la presente invención será descrita a continuación con más detalle con referencia a los siguientes Ejemplos, Ejemplos de Preparación-Producción Agrícola y Ejemplos de Ensayo, pero el alcance de la presente invención no está restringido en absoluto por estos Ejemplos, Ejemplos de Preparación-Producción Agrícola y Ejemplos de Ensayo específicos.

50 Ejemplo de referencia 1: Preparación de compuestos correspondientes al Compuesto [4] que aparece en el Esquema de reacción 1:

Síntesis de 3-metoxioxalilamino-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida

55 Se disolvieron, en 80 ml de tetrahidrofurano, 8,45 g de 3-amino-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida, después se añadieron, a la disolución resultante, 3,4 ml de trietilamina y 0,3 g de 4-dimetilaminopiridina y después se añadieron gota a gota, a la mezcla resultante, 2,45 g de metoxicloro-oxalato diluido con 10 ml de tetrahidrofurano, a una temperatura no más alta que 10°C, con enfriamiento en hielo. Después,

la disolución de reacción se vertió en una disolución de ácido clorhídrico diluido, los cristales resultantes se separaron por filtración, se lavaron con agua y después se secaron para dar así un producto bruto. Además, el producto bruto se lavó con un sistema disolvente mixto de hexano-etanol (5:1) para obtener así 8,53 g de un compuesto intermedio para el compuesto de la presente invención. P.F.: 160 a 163°C.

5 Ejemplo 1: (Preparación del compuesto correspondiente al compuesto [1] del Esquema de reacción 1)

Síntesis de 3-(N,N-dimetilaminoxalilamino)-N-2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-37):

10 Se suspendieron, en 7 ml de metanol, 0,76 g de 3-metoxioxalilamino-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida y 0,25 g de hidrocloreto de dimetilamina, después se añadió gota a gota una disolución metanólica al 28% de metóxido de sodio a la suspensión resultante y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. Se añadió agua al líquido de reacción y los cristales precipitados se obtuvieron mediante filtración, se lavaron con agua y después se secaron para dar 0,78 g del compuesto (N° 1-37) (amorfo) descrito en la Tabla 1 dada más adelante.

15 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>), δ (ppm): 1,23 (3H, t), 2,36 (3H, s), 2,70 (2H, q), 3,12 (3H, s), 3,53 (3H, s), 7,37 (2H, s), 7,48-7,55 (2H, m), 7,70-7,79 (2H, m), 8,28 (1H, s), 9,49 (1H, s).

Ejemplo 2: (Esquema de reacción 1)

Síntesis de 3-(N-ciclopropilaminoxalilamino)-N-(2,6-dimetil-4-heptafluoroisopropil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-6):

20 Se suspendieron, en 6 ml de metanol, 0,99 g de 3-metoxioxalilamino-N-2,6-dimetil-4-heptafluoroisopropil)fenilbenzamida, después se añadieron gota a gota 0,25 g de ciclopropilamina, que había sido diluida con 2 ml de metanol, a la suspensión resultante, y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una noche. Se añadió agua al líquido de reacción y los precipitados separados del líquido mixto se obtuvieron mediante filtración, se lavaron con agua y después se secaron para dar así 1,01 g del compuesto (N° 1-6) descrito en la Tabla 1 dada más adelante. P.F.: 204 a 206°C.

25 Ejemplo 3: (Esquema de reacción 2)

Síntesis de 3-(N,N-dietilaminoxalilamino)-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-49):

30 Se suspendieron, en 7 ml de tetrahidrofurano, 0,63 g de 3-amino-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida, 0,22 g de ácido N,N-dietilaminoxámico y 0,38 g de yoduro de 2-cloro-1-metil-piridinio, después se añadieron 0,63 ml de trietilamina a la suspensión resultante, la mezcla resultante se llevó a reflujo con calentamiento durante 2 horas y después se añadió agua al líquido de reacción, seguido de la extracción del mismo con acetato de etilo, lavado del extracto con agua y después con una disolución acuosa de cloruro de sodio y secado de la misma sobre sulfato de magnesio. El disolvente del extracto se evaporó usando un evaporador a presión reducida para obtener así 0,81 g del compuesto (N° 1-49) (amorfo) descrito en la Tabla 1 dada más adelante.

35 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>), δ (ppm): 1,18-1,26 (6H, m), 1,31 (3H, t), 2,33 (3H, s), 2,69 (2H, q), 3,47 (2H, q), 3,83 (2H, q), 7,36 (2H, s), 7,46 (1H, t), 7,68-7,79 (3H, m), 8,23 (1H, s), 9,63 (1H, s).

Ejemplo 4: (Esquema de reacción 1)

Síntesis de 3-(N-etilaminoxalilamino)-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-35):

40 Se suspendieron, en 7 ml de metanol, 0,76 g de 3-metoxioxalilamino-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida, después se añadieron gota a gota 0,16 g de una disolución acuosa al 70% de etilamina a la suspensión resultante y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. Se añadió después agua al líquido de reacción, los precipitados separados de la mezcla se obtuvieron mediante filtración, se lavaron con agua y después se secaron para dar así 0,78 g del compuesto (N° 1-35) descrito en la Tabla 1 dada más adelante. P.F.: 220 a 222°C.

45 Ejemplo 5: (Esquema de reacción 3)

Síntesis de 3-(N-metil-N-ciclohexilaminoxalilamino)-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-48):

50 Se suspendieron, en 7 ml de tetrahidrofurano, 0,63 g de 3-amino-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida y 0,24 g de piridina, y después se añadieron gota a gota, a la suspensión resultante, 0,35 g de cloruro de N-metil-N-ciclohexilaminoxalilo, que había sido diluido con 2 ml de tetrahidrofurano, con enfriamiento en hielo. Después, la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una noche, se añadió una disolución de ácido clorhídrico diluido al líquido de reacción, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo y el extracto

resultante se lavó con agua y después con una disolución acuosa de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio y finalmente el disolvente se evaporó del extracto a presión reducida usando un evaporador para dar así 0,87 g del compuesto (N° 1-48) (amorfo) descrito en la Tabla 1 más adelante.

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,02-1,90 (13H, m), 2,36 (3H, s), 2,70 (2H, q), (2,95+3,28) (3H, s), ((4,31-4,43)+(4,64-4,76)) (1H, m), 7,37 (2H, s), 7,49 (1H, t), 7,62 (1H, s), 7,69-7,79 (2H, m), 8,24 (1H, s), (9,44+9,51) (1H, s).

Ejemplo 6: (Esquema de reacción 1)

Síntesis de 3-(pirrolidin-1-il-oxalilamino)-N-(2,6-dimetil-4-heptafluoroisopropil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-33):

10 Se suspendieron, en 8 ml de metanol, 0,99 g de 3-metoxioxalilamino-N-(2,6-dimetil-4-heptafluoroisopropil)fenilbenzamida, después se añadieron gota a gota 0,21 g de pirrolidina a la suspensión resultante, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. Se añadió agua al líquido de reacción y los precipitados separados del líquido de reacción se obtuvieron mediante filtración, se lavaron con agua y después se secaron para dar así 1,04 g del compuesto (N° 1-33) descrito en la siguiente Tabla 1, como un producto amorfo.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,85-2,07 (4H, m), 2,36 (6H, s), 3,36 (2H, t), 4,07 (2H, t), 7,36 (2H, s), 7,51 (1H, t), 7,65 (1H, s), 7,71-7,78 (2H, m), 8,32 (1H, s), 9,68 (1H, s).

15 Ejemplo 7:

Síntesis de 3-(N-(t-butil)-N-metilamino-oxalilamino)-N-(2-cloro-4-heptafluoro-isopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto 1-61):

Ejemplo 7-(1):

Síntesis de N-(t-butil)-N-metiletoxioxalilamida:

20 Se diluyeron 15,08 g de t-butilmetilamina con 200 ml de éter t-butilmetílico, seguido de la adición de 27,4 ml de trietilamina a la disolución diluida así preparada, y la posterior adición gota a gota de 24,85 g de cloruro de etiloxalilo, que había sido diluido con 40 ml de éter t-butilmetílico, con enfriamiento en hielo. Después de completarse la adición gota a gota, se añadió una disolución de ácido clorhídrico diluido al líquido de reacción, la fase orgánica separada se lavó con una disolución acuosa de bicarbonato de sodio y después con una disolución acuosa de sal común, la fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, el éter t-butilmetílico se retiró por destilación para obtener así, como producto diana, 30,25 g (rendimiento: 93,4%, un producto oleoso) de N-(t-butil)-N-metiletoxioxalilamida.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,36 (3H, t), 1,46 (9H, s), 2,88 (3H, s), 4,31 (2H, q).

Ejemplo 7-(2):

30 Síntesis de ácido N-(t-butil)-N-metilaminooxámico:

35 Se suspendieron 20,0 g de N-(t-butil)-N-metiletoxioxalilamida en un disolvente mixto que comprendía 30 ml de metanol y 50 ml de agua, se añadieron gota a gota 9,42 g de una disolución acuosa de hidróxido de sodio al 50% a la suspensión resultante con enfriamiento en hielo y después la mezcla resultante se agitó durante una hora. Se añadió ácido clorhídrico concentrado al sistema de reacción para hacer así ácido al sistema, después se añadió éter t-butilmetílico al sistema, la fase orgánica así separada se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio, el éter t-butilmetílico se retiró por destilación para obtener así, como producto diana, 12,37 g (rendimiento: 73%, un producto sólido) de ácido N-(t-butil)-N-metilaminooxámico.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,47 (9H, s), 3,13 (3H, s), 7,23 (1H, s a).

Ejemplo 7-(3) (Esquema de reacción 2):

40 Síntesis de 3-(N-(t-butil)-N-metilaminooxalilamino)-N-(2-cloro-4-heptafluoro-isopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto 1-61):

45 Se suspendieron, en 6 ml de tetrahidrofurano, 0,43 g de 3-amino-N-(2-cloro-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida, 0,18 g de ácido N-(t-butil)-N-metiloxámico y 0,28 g de yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, después se añadieron 0,46 ml de trietilamina a la suspensión resultante y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. Después de que el disolvente y similares se separaran por destilación del líquido de reacción a presión reducida, el residuo así obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1,5:1) para dar así 0,53 g del compuesto (N° 1-61) (amorfo) descrito en la Tabla 1 dada más adelante.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,49 (9H, s), 2,42 (3H, s), 3,24 (3H, s), 7,44 (1H, s), 7,51 (1H, t), 7,57 (1H, s), 7,71-7,79 (2H, m), 7,85 (1H, s), 8,26 (1H, s), 9,22 (1H, s).

50

Ejemplo 8:

Síntesis de 3-(N-(2-fluoroetil)-N-metilaminoxalilamino)-N-(2-etil-4-heptafluoro-isopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-103):

Ejemplo 8-(1): Síntesis de N-(2-fluoroetil)-metoxioxalilamida:

5 Se disolvieron, en 130 ml de metanol, 14,17 g de oxalato de dimetilo y 10,00 g de hidrocloreto de 2-fluoroetilamina, y después se añadieron gota a gota, a la disolución resultante, 19,30 g de una disolución metanólica al 28% de metóxido de sodio, que había sido diluido con 30 ml de metanol, con enfriamiento en hielo. Después de completarse la adición gota a gota, la temperatura del líquido de reacción fue devuelta a la temperatura ambiente y los cristales así precipitados del líquido de reacción se recogieron mediante filtración. El filtrado se concentró a presión reducida, se añadió éter dietílico al residuo resultante, los cristales precipitados de nuevo del mismo se recuperaron mediante filtración y el éter dietílico se retiró por destilación del filtrado así obtenido, como producto diana, 10,63 g (rendimiento 79,3%, un producto oleoso) de N-(2-fluoroetil)-metoxioxalilamida.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 3,62-3,74 (2H, m), 3,93 (3H, s), 4,54 (1H, t), 4,61 (1H, t), 7,47 (1H, s a).

Ejemplo 8-(2): Síntesis de N-(2-fluoroetil)-N-metilmtoxioxalilamida:

15 A 3,00 g de N-(2-fluoroetil)-metoxioxalilamida, se añadieron 25 ml de N,N-dimetilformamida, 5 ml de dimetoxietano y 4 ml de yoduro de metilo. A la mezcla, se añadieron 0,96 g (60% en aceite) de hidruro de sodio con enfriamiento en hielo. La temperatura del líquido de reacción fue devuelta a la temperatura ambiente, se añadieron una disolución de ácido clorhídrico diluido y acetato de etilo al mismo, la fase orgánica resultante así separada se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y después el acetato de etilo se retiró por destilación para dar así un producto bruto. Finalmente, el producto bruto se lavó con hexano para dar así, como producto diana, 1,66 g (rendimiento: 50,9%, un producto oleoso) de N-(2-fluoroetil)-N-metilmtoxioxalilamida.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): (3,09+3,14) (3H, s), (3,61-3,77) (2H, m), 3,87+3,90 (3H, s), 4,52-4,71 (2H, m).

Ejemplo 8-(3): Síntesis de ácido N-(2-fluoroetil)-N-metiloxámico

25 En un disolvente mixto que comprendía 6 ml de metanol y 5 ml de agua, se suspendieron 1,56 g de N-(2-fluoroetil)-N-metilmtoxioxalilamida, después se añadieron gota a gota a la suspensión 3,2 g de una disolución acuosa al 15% de hidróxido de sodio, con enfriamiento en hielo, y después la mezcla se agitó durante una hora. Se añadió ácido clorhídrico concentrado al sistema de reacción, después la mezcla se extrajo con acetato de etilo, la fase orgánica así separada se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y después el acetato de etilo se retiró por destilación de la fase orgánica para dar así, como producto diana, 0,94 g (rendimiento: 66%, un producto sólido) de ácido N-(2-fluoroetil)-N-metiloxámico.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): (3,19+3,48) (3H, s), ((3,723,82)+(4,08-4,18)) (2H, m), 4,48-4,76 (2H, m).

Ejemplo 8-(4): (Esquema de reacción 2)

Síntesis de 3-(N-(2-fluoroetil)-N-metilaminoxalilamino)-N-(2-etil-4-heptafluoro-isopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-103)

35 Se suspendieron, en 7 ml de tetrahidrofurano, 0,42 g de 3-amino-N-(2-etil-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida, 0,18 g de ácido N-(2-fluoroetil)-N-metiloxámico y 0,31 g de yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, después se añadieron 0,51 ml de trietilamina a la suspensión resultante y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 5 horas. Después, el disolvente y similares se retiraron por destilación del líquido de reacción y el residuo resultante se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:1) para dar así 0,47 g del compuesto (amorfo) (N° 1-103) descrito en la Tabla 1 dada más adelante.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,24 (3H, t), 2,36 (3H, s), 2,71 (2H, q), (3,20+3,61) (3H, s), (3,77+3,84+4,22+4,28) (2H, t), (4,63+4,69+4,74+4,81) (2H, t), 7,38 (2H, s), 7,49-7,58 (2, m), 7,71-7,79 (2H, m), (8,26+8,28) (1H, s), (9,42+9,49) (1H, s).

45 Ejemplo 9: Síntesis de 3-(N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metilaminoxalilamino)-N-(2-bromo-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-90)

Ejemplo 9-(1): Síntesis de N-(2,2,2-trifluoroetil)etoxioxalilamida

50 Se diluyeron 25 g de 2,2,2-trifluoroetilamina con 150 ml de éter t-butilmetílico y después 200 ml de agua y se añadieron 33,6 g de bicarbonato de sodio a la mezcla resultante. Después, se diluyeron 24,85 g de cloruro de etiloxalilo con 40 ml de éter t-butilmetílico y el líquido resultante se añadió gota a gota a la mezcla anterior con enfriamiento en hielo y agitación. Después de completarse la adición gota a gota, el líquido de reacción se separó en fases, la fase orgánica resultante se lavó con una disolución de ácido clorhídrico diluido y una disolución saturada de sal común, después se secó sobre sulfato de magnesio y el éter t-butilmetílico se retiró por destilación para dar así,

como producto diana, 40,28 g (rendimiento: 80%, cristales) de N-(2,2,2-trifluoroetil)etoxi-oxalilamida.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,41 (3H, t), 3,95-4,05 (2H, m), 4,40 (2H, q), 7,42 (1H, a).

Ejemplo 9-(2): Síntesis de N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metiletoxialilamida

5 Se lavaron 4,48 g de hidruro de sodio al 60% con hexano, el hidruro de sodio lavado se suspendió en 80 ml de N,N-dimetilformamida y después se añadieron 20,26 g de N-(2,2,2-trifluoroetil)etoxialilamida a la suspensión resultante con enfriamiento en hielo. Después de completarse la espumación, se diluyeron 17,0 g de yoduro de metilo con 20 ml de N,N-dimetilformamida y la disolución resultante se añadió al líquido de reacción anterior. Después de agitar el líquido de reacción a 50°C durante aproximadamente 2 horas, se añadieron una disolución de ácido clorhídrico diluido y éter t-butilmetílico al líquido de reacción para hacer así que el líquido se separase en fases, la fase orgánica resultante se lavó con agua y una disolución acuosa saturada de sal común, se secó sobre sulfato de magnesio y después el éter t-butilmetílico se retiró por destilación de la fase orgánica para dar así, como producto diana, 16,9 g (rendimiento: 78%, un producto oleoso) de N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metiletoxialilamida.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 1,35-1,42 (3H, m), (3,13+3,16) (3H, s), (4,05+4,13) (2H, q), 4,33-4,41 (2H, m).

Ejemplo 9-(3): Síntesis de ácido N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metilaminooxámico:

15 Se suspendieron 16,92 g de N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metiletoxialilamida en un disolvente mixto que comprendía 20 ml de metanol y 30 ml de agua, se añadieron gota a gota 7,00 g de una disolución acuosa al 50% de hidróxido de sodio a la suspensión resultante con enfriamiento en hielo y después la mezcla se agitó durante una hora. Se añadió ácido clorhídrico concentrado a la mezcla para hacer así ácida a la misma, después se añadió éter t-butilmetílico a la mezcla para hacer que la mezcla se separara en fases. La fase orgánica resultante se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y después el éter t-butilmetílico se retiró por destilación de la fase orgánica para dar así, como producto diana, 11,16 g (rendimiento: 80%, un producto sólido) de ácido N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metilaminooxámico.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): (3,22+3,50) (3H, s), (4,11+4,68) (2H, q).

Ejemplo 9-(4): (Esquema de reacción 2):

25 Síntesis de 3-(N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metilaminooxalilamino)-N-(2-bromo-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida (Compuesto N° 1-90)

30 Se suspendieron, en 6 ml de tetrahidrofurano, 0,57 g de 3-amino-N-(2-bromo-4-heptafluoroisopropil-6-metil)fenilbenzamida, 0,26 g de ácido N-(2,2,2-trifluoroetil)-N-metiloxámico y 0,34 g de yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, después se añadieron 0,55 ml de trietilamina a la suspensión resultante y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. Después de la retirada del disolvente o similares mediante destilación a presión reducida, el residuo resultante se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 2:1) para dar así, como producto diana, 0,61 g del compuesto (amorfo) (N° 1-90) descrito en la Tabla 1 dada más adelante.

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ),  $\delta$  (ppm): 2,43 (3H, s), (3,21+3,63) (3H, s), (4,14+4,87) (2H, q), 7,49 (1H, s), 7,53 (1H, t), 7,71-7,84 (4H, m), (8,26+8,29) (1H, s), (9,38+9,49) (1H, s).

35 Ejemplo 10:

Se prepararon compuestos de la presente invención repitiendo los mismos procedimientos usados en los Ejemplos 1 a 9. Los compuestos típicos de la presente invención, preparados en los Ejemplos anteriores, serán descritos en la siguiente Tabla 1, pero la presente invención no está restringida a estos compuestos específicos en absoluto.

40 En la siguiente tabla 1, "Me" representa un grupo metilo; "Et" representa un grupo etilo; "Pr" representa un grupo propilo; "Bu" representa un grupo butilo; "n-" significa normal; "t-" significa terciario; "s-" significa secundario; "i-" representa "iso-"; y "c-" representa "ciclo", respectivamente.

ES 2 439 315 T3

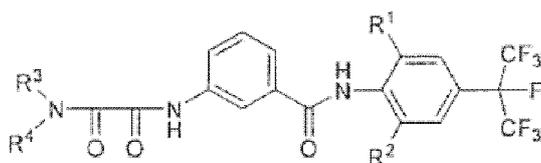


Tabla 1

Comp. N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Punto de fusión (°C)
1-1	Me	Me	H	H	amorfo
1-2	Me	Me	H	Me	amorfo
1-3	Me	Me	H	Et	208~211
1-4	Me	Me	H	n-Pr	194~196
1-5	Me	Me	H	i-Pr	amorfo
1-6	Me	Me	H	c-Pr	204~206
1-7	Me	Me	H	alilo	185~186
1-8	Me	Me	H	n-Bu	139~141
1-9	Me	Me	H	i-Bu	amorfo
1-10	Me	Me	H	s-Bu	amorfo
1-11	Me	Me	H	t-Bu	amorfo
1-12	Me	Me	H	c-Bu	209~211
1-13	Me	Me	H	CH <sub>2</sub> -c-Pr	amorfo
1-14	Me	Me	H	CH <sub>2</sub> -c-Bu	amorfo
1-15	Me	Me	H	CH(Me)-n-Pr	amorfo
1-16	Me	Me	H	CH(Et) <sub>2</sub>	amorfo
1-17	Me	Me	H	C(Me) <sub>2</sub> Et	amorfo
1-18	Me	Me	H	CH <sub>2</sub> CMe <sub>3</sub>	amorfo
1-19	Me	Me	H	c-pentilo	190~192
1-20	Me	Me	H	c-hexilo	amorfo
1-21	Me	Me	Me	Me	amorfo
1-22	Me	Me	Me	Et	amorfo
1-23	Me	Me	Me	n-Pr	amorfo
1-24	Me	Me	Me	i-Pr	amorfo
1-25	Me	Me	Me	c-Pr	amorfo
1-26	Me	Me	Me	alilo	amorfo
1-27	Me	Me	Me	n-Bu	amorfo
1-28	Me	Me	Me	t-Bu	amorfo
1-29	Me	Me	Me	c-hexilo	amorfo

ES 2 439 315 T3

1-30	Me	Me	Et	Et	amorfo
1-31	Me	Me	i-Pr	i-Pr	amorfo
1-32	Me	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		205~208
1-33	Me	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		amorfo
1-34	Me	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		208~211
1-35	Me	Et	H	Et	220~222
1-36	Me	Et	H	t-Bu	92~96
1-37	Me	Et	Me	Me	amorfo
1-38	Me	Et	Me	Et	amorfo
1-39	Me	Et	Me	n-Pr	amorfo
1-40	Me	Et	Me	i-Pr	amorfo
1-41	Me	Et	Me	c-Pr	amorfo
1-42	Me	Et	Me	alilo	amorfo
1-43	Me	Et	Me	n-Bu	amorfo
1-44	Me	Et	Me	t-Bu	amorfo
1-45	Me	Et	Me	c-Bu	amorfo
1-46	Me	Et	Me	C(Me) <sub>2</sub> Et	amorfo
1-47	Me	Et	Me	c-pentilo	amorfo
1-48	Me	Et	Me	c-hexilo	amorfo
1-49	Me	Et	Et	Et	amorfo
1-50	Me	Et	Et	t-Bu	amorfo
1-51	Me	Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		amorfo
1-52	H	H	Me	Me	171~172
1-53	H	Me	Me	Me	138~140
1-54	H	Et	Me	Me	185~186
1-55	H	Et	Me	Et	114~117
1-56	Et	Et	Me	Me	amorfo
1-57	Et	Et	Me	Et	amorfo
1-58	Et	Et	Me	t-Bu	amorfo
1-59	Me	Cl	Me	Me	amorfo
1-60	Me	Cl	Me	Et	amorfo
1-61	Me	Cl	Me	t-Bu	amorfo
1-62	Me	Br	Me	Et	amorfo
1-63	Me	Br	Me	t-Bu	amorfo
1-64	Me	I	Me	Et	amorfo

ES 2 439 315 T3

1-65	Me	I	Me	t-Bu	amorfo
1-66	Et	Cl	Me	Me	amorfo
1-67	Et	Cl	Me	Et	amorfo
1-68	Et	Cl	Me	t-Bu	amorfo
1-69	Et	Br	Me	Et	amorfo
1-70	Et	Br	Me	t-Bu	amorfo
1-71	Et	I	Me	Et	amorfo
1-72	Et	I	Me	t-Bu	amorfo
1-73	i-Pr	Cl	Me	Et	amorfo
1-74	i-Pr	Br	Me	Et	amorfo
1-75	Me	Me	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	171~173
1-76	Me	Et	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	amorfo
1-77	Et	Et	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	amorfo
1-78	Me	Et	Me	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	amorfo
1-79	Et	Br	Me	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	amorfo
1-80	Me	Me	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br	amorfo
1-81	Me	Et	Me	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br	amorfo
1-82	Et	Br	Me	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Br	amorfo
1-83	Me	Me	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Cl	135~139
1-84	Me	Me	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Br	amorfo
1-85	Me	Et	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-86	Me	Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-87	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-88	Et	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-89	Me	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-90	Me	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-91	Me	I	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-92	Et	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-93	Et	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-94	Et	I	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-95	i-Pr	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-96	i-Pr	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-97	Me	Et	Et	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-98	Me	Et	alilo	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-99	Me	Et	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo

ES 2 439 315 T3

1-100	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	amorfo
1-101	Me	Et	Et	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	amorfo
1-102	Me	Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	amorfo
1-103	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	amorfo
1-104	Me	Et	Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	amorfo
1-105	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-106	Me	Et	Me	CHMeCF <sub>3</sub>	amorfo
1-107	Me	I	Me	CHMeCF <sub>3</sub>	amorfo
1-108	Et	Br	Me	CHMeCF <sub>3</sub>	amorfo
1-109	Et	Br	Me	CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	amorfo
1-110	Et	Br	Me	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	amorfo
1-111	OMe	Cl	Me	Et	amorfo
1-112	OMe	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-113	OMe	Br	Me	Et	amorfo
1-114	OMe	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
1-115	OCF <sub>3</sub>	Cl	Me	Et	amorfo
1-116	OCF <sub>3</sub>	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo

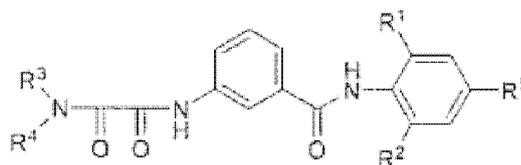


Tabla 2

Comp. N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	P.F. (°C)
2-1	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-2	Me	Et	Me	t-Bu	CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-3	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-4	Me	Et	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-5	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-6	Et	Cl	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-7	Et	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-8	Et	Br	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-9	Et	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	amorfo
2-10	Me	Et	Me	t-Bu	CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-11	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Br	amorfo

ES 2 439 315 T3

2-12	Et	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-13	Me	Me	Me	Et	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-14	Me	Me	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-15	Me	Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-16	Me	Et	Me	Et	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-17	Me	Et	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-18	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-19	Me	Cl	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-20	Me	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-21	Me	Br	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-22	Me	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-23	Me	I	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-24	Me	I	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-25	Et	Cl	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-26	Et	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-27	Et	Br	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-28	Et	Br	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-29	Et	I	Me	t-Bu	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo
2-30	Et	I	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF(CF <sub>3</sub> )CF <sub>2</sub> Br	amorfo

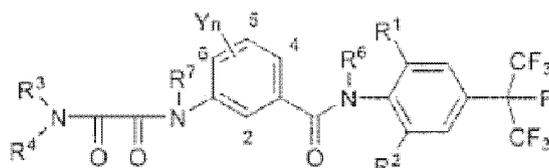


Tabla 3

Comp. N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>7</sup>	Yn	P.F. (°C)
3-1	Me	Et	Me	t-Bu	Me	H	H	amorfo
3-2	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	H	H	amorfo
3-3	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	Me	H	amorfo
3-4	Me	Et	Me	Et	H	H	6-F	amorfo
3-5	Me	Et	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	6-F	amorfo

5 La siguiente Tabla 4 muestra datos espectroscópicos de <sup>1</sup>H-NMR observados para los compuestos enumerados en las Tablas 1 a 3 anteriores, que se encontró que eran amorfos en sus propiedades morfológicas.

# ES 2 439 315 T3

Tabla 4

Comp. N°	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ), δ ppm
1-1	2,36(6H,s), 5,79(1H,s), 7,37(2H,s), 7,40(1H,s), 7,54(1H,t), 7,61(1H,s), 7,76(1H,d), 7,82(1H,d), 8,32(1H,s), 9,44(1H,s)
1-2	2,36(6H,s), 3,00(3H,d), 7,37(2H,s), 7,48-7,61(3H,m), 7,75(1H,d), 7,80(1H,d), 8,30(1H,s), 9,43(1H,s)
1-5	1,27(6H,d), 2,35(6H,s), 4,06-4,18(1H,m), 7,34-7,43(3H,m), 7,53(1H,t), 7,63(1H,s), 7,74(1H,d), 7,80(1H,d), 8,30(1H,s), 9,50(1H,s)
1-9	0,98(6H,d), 1,82-1,97(1H,m), 2,36(6H,s), 3,23(2H,t), 7,36(2H,s), 7,50-7,62(3H,m), 7,78(2H,t), 8,32(1H,s), 9,47(1H,s)
1-10	0,96(3H,t), 1,23(3H,d), 1,53-1,65(2H,m), 2,35(6H,s), 3,86-4,02(1H,m), 7,33(1H,s), 7,36(2H,s), 7,53(1H,t), 7,61(1H,s), 7,74(1H,d), 7,80(1H,d), 8,30(1H,s), 9,50(1H,s)
1-11	1,44(9H,s), 2,33(6H,s), 7,35(2H,s), 7,43(1H,s), 7,50(1H,t), 7,70-7,78(3H,m), 8,28(1H,s), 9,51(1H,s)
1-13	0,26-0,32(2H,m), 0,56-0,63(2H,m), 0,97-1,11(1H,m), 2,36(6H,s), 3,25(2H,t), 7,36(2H,s), 7,54(1H,t), 7,58-7,68(2H,m), 7,75(1H,d), 7,81(1H,d), 8,31(1H,s), 9,48(1H,s)
1-14	1,67-1,81(2H,m), 1,85-2,00(2H,m), 2,04-2,18(2H,m), 2,35(6H,s), 2,48-2,65(1H,m), 3,42(2H,t), 7,36(2H,s), 7,53(2H,t), 7,63(1H,s), 7,75(1H,d), 7,79(1H,d), 8,31(1H,s), 9,49(1H,s)
1-15	0,94(3H,t), 1,24(3H,d), 1,31-1,46(2H,m), 1,48-1,58(2H,m), 2,35(6H,s), 3,95-4,08(1H,m), 7,30-7,38(3H,m), 7,53(2H,t), 7,74(1H,d), 7,81(1H,d), 8,29(1H,s), 9,48(1H,s)
1-16	0,94(6H,t), 1,42-1,75(4H,m), 2,36(6H,s), 3,74-3,87(1H,m), 7,28(1H,t), 7,36(2H,s), 7,54(2H,t), 7,75(1H,d), 7,81(1H,d), 8,32(1H,s), 9,49(1H,s)
1-17	0,90(3H,t), 1,38(6H,s), 1,77(2H,q), 2,31(6H,s), 7,30-7,42(3H,m), 7,47(1H,t), 7,66-7,82(3H,m), 8,28(1H,s), 9,50(1H,s)
1-18	0,98(9H,s), 2,35(6H,s), 3,19(2H,d), 7,36(2H,s), 7,50-7,63(3H,m), 7,75(1H,d), 7,81(1H,d), 8,32(1H,s), 9,47(1H,s)
1-20	1,14-1,48(4H,m), 1,60-1,86(4H,m), 1,91-2,00(2H,m), 2,34(6H,s), 3,73-3,87(1H,m), 7,35(2H,s), 7,41-7,55(2H,m), 7,71-7,81(3H,m), 8,31(1H,s), 9,53(1H,s)
1-21	2,35(6H,s), 3,10(3H,s), 3,51(3H,s), 7,36(2H,s), 7,50(1H,t), 7,60(1H,s), 7,74(2H,t), 8,28(1H,s), 9,52(1H,s)
1-22	(1,22+1,32) (3H,t), 2,34(6H,s), (3,06+3,46) (3H,s), (3,53+3,90) (2H,q), 7,35(2H,s), 7,46(1H,t), 7,67-7,77(3H,m), 8,26(1H,s), 9,56(1H,s)
1-23	0,90-0,98(3H,m), 1,58-1,80(2H,m), 2,34(6H,s), (3,06+3,44) (3H,s), (3,43+3,83) (2H,t), 7,35(2H,s), 7,47(1H,t), 7,63(1H,s), 7,68-7,80(2H,m), 8,24(1H,s), 9,58(1H,s)
1-24	1,19(3H,d), 1,26(3H,d), 2,32(6H,s), (2,89+3,22)(3H,s), 4,70-5,08(1H,m), 7,34(2H,s), 7,37(1H,m), 7,64-7,82(3H,m), 8,18(1H,s), 9,65(1H,s)
1-25	0,65-0,93(4H,m), 2,30(6H,s), ((2,79-2,89)+(3,09-3,19)) (1H,m), (3,00+3,34)(3H,s), 7,34(2H,s), 7,47-7,56(2H,m), 7,74(2H,t), 8,27(1H,s), 9,50(1H,s)
1-26	2,35(6H,s), (3,06+3,46) (3H,s), (4,10+4,53) (2H,d), 5,20-5,31(2H,m), 5,74-6,01(1H,m), 7,36(2H,s), 7,47-7,56(2H,m), 7,74(2H,t), 8,27(1H,s), 9,50(1H,s)
1-27	0,94(3H, dt), 1,25-1,43(2H,m), 1,53-1,74(2H,m), 2,32(6H,s), (3,04+3,41) (3H,s), (3,45+3,82) (2H,t), 7,34(2H,s), 7,43(1H,t), 7,66-7,83(3H,m), 8,28(1H,s), 9,50(1H,s)
1-28	1,48(9H,s), 2,33(6H,s), 3,18(3H,s), 7,34(2H,s), 7,41(1H,t), 7,63-7,84(3H,m), 8,12(1H,s), 9,52(1H,s)
1-29	1,06-1,20(1H,m), 1,32-1,90(9H,m), 2,36(6H,s), (2,96+3,29) (3H,s), ((4,32-4,44)+(4,68-4,79)) (1H,m), 7,36(2H,s), 7,50(1H,t), 7,59(1H,s), 7,74(2H,t), 8,27(1H,s), (9,40+9,48) (1H,s)

ES 2 439 315 T3

1-30	1,21(3H,t), 1,31(3H,t), 2,32(6H,s), 3,46(2H,q), 3,81(2H,q), 7,34(2H,s), 7,45(1H,t), 7,67-7,78(2H,m), 7,83(1H,s), 8,23(1H,s), 9,65(1H,s)
1-31	1,26(6H,t), 1,46(6H,t), 2,34(6H,s), 3,51-3,67(1H,m), 4,66-4,80(1H,m), 7,35(2H,s), 7,41(1H,t), 7,68(1H,d), 7,76-7,83(2H,m), 8,09(1H,s), 9,70(1H,s)
1-33	1,85-2,07(4H,m), 2,36(6H,s), 3,36(2H,t), 4,07(2H,t), 7,36(2H,s), 7,51(1H,t), 7,65(1H,s), 7,71-7,78(2H,m), 8,32(1H,s), 9,68(1H,s)
1-37	1,23(3H,t), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), 3,12(3H,s), 3,53(3H,s), 7,37(2H,s), 7,48-7,55(2H,m), 7,70-7,79(2H,m), 8,28(1H,s), 9,49(1H,s)
1-38	1,18-1,35(6H,m), 2,33(3H,s), 2,69(2H,q), (3,05+3,45) (3H,s), (3,52+3,88)(2H,q), 7,37(2H,s), 7,47(1H,t), 7,68-7,79(3H,m), 8,25(1H,s), (9,58+9,60) (1H,s)
1-39	0,95(3H,dt), 1,22(3H,t), 1,59-1,80(2H,m), 2,34(6H,s), 2,70(2H,q), (3,06+3,45) (3H, s), (3,43+3,83) (2H,t), 7,37(2H,s), 7,48(1H,t), 7,64(1H,s), 7,71(1H,d), 7,76(1H,d), 8,25(1H,s), 9,57(1H,s)
1-40	1,16-1,28(9H,m), 2,32(3H,s), 2,68(2H,q), (2,92+3,23) (3H,s), ((4,714,85)+(4,94-5,08)) (1H,m), 7,36(2H,s), 7,39-7,47(1H,m), 7,69(1H,d), 7,74-7,83(2H,m), 8,19(1H,d), 9,64(1H,s)
1-41	0,67-0,93(4H,m), 1,21(3H,t), 2,32(3H,s), 2,68(2H,q), ((2,81-2,90)+(3,14-3,24)) (1H,m), (3,03+3,37) (3H,s), 7,36(2H,s), 7,45-7,49(1H,m), 7,67-7,85(3H,m), (8,18+8,24) (1H,s), (9,25+9,59) (1H,s)
1-42	1,20(3H,t), 2,32(3H,s), 2,68(2H,q), (3,03+3,42)(3H,s), (4,08+4,49) (2H,d), 5,17-5,30(2H,m), 5,70-6,00(1H,m), 7,36(2H,s), 7,47(1H,t), 7,64-7,79(3H,m), 8,25(1H,s), 9,56(1H,s)
1-43	0,95(3H,dt), 1,22(3H,t), 1,28-1,43(2H,m), 1,54-1,74(2H,m), 2,34(3H,s), 2,69(2H,q), (3,06+3,44)(3H,s), (3,47+3,86)(2H,t), 7,37(2H,s), 7,48(1H,t), 7,62-7,80(3H,m), 8,24(1H,s), 9,59(1H,s)
1-44	1,22(3H,t), 1,48(9H,s), 2,34(3H,s), 2,70(2H,q), 3,20(3H,s), 7,36(2H,s), 7,44(1H,t), 7,66-7,80(3H,m), 8,15(1H,s), 9,42(1H,s)
1-45	1,23(3H,t), 1,65-1,81(2H,m), 2,17-2,32(4H,m), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), (3,06+3,40) (3H,s), ((4,78-4,88)+(5,31-5,41)) (1H,m), 7,38(2H,s), 7,51(1H,t), 7,57(1H,s), 7,71-7,79(2H,m), (8,25+8,27) (1H,s), (9,28+9,44) (1H,s)
1-46	0,88(3H,t), 1,23(3H,t), 1,44(6H,s), 1,95(2H,q), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), 3,21(3H,s), 7,37(2H,s), 7,46(1H,t), 7,64-7,72(2H,m), 7,76(1H,d), 8,18(1H,s), 9,33(1H,s)
1-47	1,23(3H,t), 1,54-2,02(8H,m), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), (2,94+3,30) (3H,s), ((4,85-4,95)+(5,23-5,32)) (1H,m), 7,37(2H,s), 7,50(1H,dt), 7,58(1H,s), 7,70-7,79(2H,m), (8,24+8,26) (1H,s), (9,36+9,48) (1H,s)
1-48	1,02-1,90(13H,m), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), (2,95+3,28) (3H,s), ((4,31-4,43)+(4,64-4,76)) (1H,m), 7,37(2H,s), 7,49(1H,t), 7,62(1H,s), 7,69-7,79(2H,m), 8,24(1H,s), (9,44+9,51) (1H,s)
1-49	1,18-1,26(6H,m), 1,31(3H,t), 2,33(3H,s), 2,69(2H,q), 3,47(2H,q), 3,83(2H,q), 7,36(2H,s), 7,46(1H,t), 7,68-7,79(3H,m), 8,23(1H,s), 9,63(1H,s)
1-50	1,22(3H,t), 1,30(3H,t), 1,52(9H,s), 2,35(3H,s), 2,71(2H,q), 3,70(2H,q), 7,37(2H,s), 7,41(1H,t), 7,67(1H,d), 7,81(1H,d), 7,85(1H,s), 8,03(1H,s), 9,61(1H,s)
1-51	1,23(3H,t), 1,85-2,07(4H,m), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), 3,63(2H,t), 4,07(2H,t), 7,34(2H,s), 7,51(1H,t), 7,62(1H,s), 7,75(2H,t), 8,31(1H,s), 9,68(1H,s)
1-56	1,21(6H,t), 2,68(4H,q), 3,08(3H,s), 3,48(3H,s), 7,38(2H,s), 7,46(1H,t), 7,66-7,73(2H,d), 7,79(1H,d), 8,24(1H,s), 9,61(1H,s)
1-57	1,19-1,36(9H,m), 2,70(4H,q), (3,07+3,47) (3H,s), (3,52+3,91) (2H,q), 7,39(2H,s), 7,46-7,54(2H,m), 7,71(1H,d), 7,67-7,83(1H,m), 8,25(1H,s), 9,53(1H,d)
1-58	1,24(6H,t), 1,49(9H,s), 2,70(4H,q), 3,23(3H,s), 7,39(2H,s), 7,49(1H,t), 7,60(1H,s), 7,71(1H,d), 7,76(1H,d), 8,21(1H,s), 9,24(1H,s)
1-59	2,42(3H,s), 3,12(3H,s), 3,53(3H,s), 7,45(1H,s), 7,49-7,59(2H,m), 7,77(2H,t), 7,84(1H,s), 8,30(1H,s), 9,49(1H,s)

ES 2 439 315 T3

	8,30(1H,s), 9,49(1H,s)
1-60	(1,23+1,33)(3H,t), 2,42(3H,s), (3,08+3,48) (3H,s), (3,53+3,93) (2H,q), 7,45(1H,s), 7,52(1H,t), 7,57(1H, s), 7,72-7,81(2H,m), 7,84(1H,s), 8,29(1H,s), (9,50+9,53) (1H,s)
1-61	1,49(9H,s), 2,42(3H,s), 3,24(3H,s), 7,44(1H,s), 7,51(1H,t), 7,57(1H,s), 7,71-7,79(2H,m), 7,85(1H,s), 8,26(1H,s), 9,22(1H,s)
1-62	(1,23+1,34) (3H,t), 2,43(3H,s), (3,08+3,49) (3H,s), (3,53+3,93) (2H,q), 7,47-7,56(2H,m), 7,70-7,83(4H,m), 8,30(1H,s), (9,50+9,53) (1H,s)
1-63	1,49(9H,s), 2,43(3H,s), 3,24(3H,s), 7,46-7,53(2H,m), 7,71-7,80(3H,m), 7,84(1H,s), 8,26(1H,s), 9,25(1H,s)
1-64	(1,23+1,34) (3H,t), 2,44(3H,s), (3,08+3,49) (3H,s), (3,54+3,93) (2H,q), 7,49-7,55(2H,m), 7,71-7,83(3H,m), 7,94(1H,s), 8,31(1H,s), (9,49+9,53) (1H,s)
1-65	1,49(9H,s), 2,43(3H,s), 3,24(3H,s), 7,47-7,53(2H,m), 7,72-7,81(3H,m), 7,94(1H,s), 8,27(1H,s), 9,26(1H,s)
1-66	1,25(3H,t), 2,77(2H,q), 3,11(3H,s), 3,52(3H,s), 7,46-7,54(2H,m), 7,59(1H,s), 7,72-7,82(3H,m), 8,28(1H,s), 9,53(1H,s)
1-67	1,18-1,36(6H,m), 2,77(2H,q), (3,07+3,47) (3H,s), (3,53+3,91) (2H,q), 7,45-7,55(2H,m), 7,58(1H,s), 7,71-7,83(3H,m), 8,28(1H,s), (9,52+9,55) (1H,s)
1-68	1,26(3H,t), 1,49(9H,s), 2,77(2H,q), 3,23(3H,s), 7,45-7,52(2H,m), 7,58(1H,s), 7,73(1H,d), 7,78(1H,d), 7,82(1H,s), 8,23(1H,s), 9,28(1H,s)
1-69	1,20-1,36(6H,m), 2,78(2H,q), (3,08+3,49) (3H,s), (3,54+3,94) (2H,q), 7,49-7,56(2H,m), 7,67(1H,s), 7,73-7,84(3H,m), 8,28(1H,s), (9,47+9,51) (1H,s)
1-70	1,25(3H,t), 1,49(9H,s), 2,77(2H,q), 3,22(3H,s), 7,47(1H,t), 7,51(1H,s), 7,70-7,81(3H,m), 7,91(1H,s), 8,21(1H,s), 9,38(1H,s)
1-71	1,20-1,36(6H,m), 2,78(2H,q), (3,08+3,48) (3H,s), (3,53+3,92) (2H,q), 7,49-7,55(2H,m), 7,72(1H,s), 7,75-7,84(2H,m), 7,96(1H,s), (8,29+8,30) (1H,s), (9,52+9,55) (1H,s)
1-72	1,24(3H,t), 1,49(9H,s), 2,78(2H,q), 3,24(3H,s), 7,47-7,55(2H,m), 7,73-7,81(3H,m), 7,96(1H,s), 8,25(1H,s), 9,27(1H,s)
1-73	1,19-1,36(9H,m), (3,07+3,47) (3H,s), 3,15-3,31(1H,m), (3,53+3,91) (2H,q), 7,47-7,54(2H,m), 7,58(1H,s), 7,68(1H,s), 7,75(1H,d), 7,81(1H,d), 8,26(1H,s), (9,52+9,55) (1H,s)
1-74	1,18-1,35(9H,m), (3,07+3,47) (3H,s), 3,16-3,31(1H,m), (3,52+3,91) (2H,q), 7,46-7,57(2H,m), 7,70-7,84(4H,m), 8,27(1H,s), (9,53+9,56) (1H,s)
1-76	1,23(3H,t), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), 3,66-3,80(4H,m), 7,38(2H,s), 7,50-7,58(2H,m), 7,75(1H,d), 7,81-7,94(2H,m), 8,30(1H,s), 9,39(1H,s)
1-77	1,24(6H,t), 2,71(4H,q), 3,66-3,80(4H,m), 7,70(2H,s), 7,48(1H,s), 7,55(1H,t), 7,75(1H,d), 7,81-7,93(2H,m), 8,29(1H,s), 9,39(1H,s)
1-78	1,24(3H,t), 2,36(3H,s), 2,71(2H,q), (3,22+3,61) (3H,s), ((3,74-3,84)+(4,25-4,30) (4H,m)), 7,38(2H,s), 7,49-7,57(2H,m), 7,72-7,80(2H,m), 8,27(1H,s), (9,45+9,47) (1H,s)
1-79	1,25(3H,t), 2,78(2H,q), (3,17+3,61) (3H,s), ((3,73-3,85)+(4,25-4,30) (4H,m)), 7,49-7,55(2H,m), 7,68-7,84(4H,m), 8,27(1H,s), (9,47+9,50)(1H,s)
1-80	2,33(6H,s), 3,53(2H,t), 3,82(2H,q), 7,35(2H,s), 7,48-7,59(2H,m), 7,73(1H,d), 7,84(1H,d), 7,94(1H,t), 8,30(1H,s), 9,43(1H,s)
1-81	1,24(3H,t), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), (3,16+3,61) (3H,s), (3,59+3,66+3,89+4,33) (4H,t), 7,38(2H,s), 7,49-7,55(2H,m), 7,73(1H,d), 7,79(1H,d), (8,27+8,41) (1H,s), (9,44+9,46) (1H,s)
1-82	1,26(3H,t), 2,78(2H,q), (3,17+3,61) (3H,s), ((3,74-3,85)(m)+4,28(t))(4H), 7,50-7,56(2H,m), 7,69(1H,s), 7,74-7,84(3H,m), 8,28(1H,s), (9,45+9,47) (1H,s)
1-84	2,12-2,23(2H,m), 2,34(6H,s), 3,46(2H,t), 3,57(2H,q), 7,35(2H,s), 7,52(1H,t), 7,64(1H,s), 7,68-7,83(3H,m), 8,29(1H,s), 9,46(1H,s)

ES 2 439 315 T3

	7,83(3H,m), 8,29(1H,s), 9,46(1H,s)
1-85	1,23(3H,t), 2,32(3H,s), 2,68(2H,q), 3,21-4,09(2H,m), 7,37(2H,s), 7,52(1H,t), 7,61(1H,s), 7,73(1H,d), 7,84(1H,d), 7,95(1H,t), 8,29(1H,s), 9,40(1H,s)
1-86	2,33(6H,s), (3,20+3,61) (3H,s), (4,13+4,85) (2H,q), 7,35(2H,s), 7,50(1H,t), 7,60(1H,s), 7,70-7,80(2H,m), 8,25(1H,s), (9,39+9,49) (1H,s)
1-87	1,23(3H,t), 2,34(3H,s), 2,70(2H,q), (3,21+3,62) (3H,s), (4,14+4,85) (2H,q), 7,37(2H,s), 7,52(1H,t), 7,65(1H,d), 7,75(2H,t), 8,24-8,28(1H,m), (9,40+9,50) (1H,s)
1-88	1,23(6H,t), 2,69(4H,q), (3,12+3,62) (3H,s), (4,14+4,86) (2H,q), 7,39(2H,s), 7,47-7,55(2H,m), 7,73(1H,d), 8,24(1H,s), (9,37+9,47) (1H,s)
1-89	2,42(3H,s), (3,21+3,63) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,45(1H,s), 7,50-7,59(2H,m), 7,73-7,83(3H,m), (8,25+8,28) (1H,s), (9,37+9,48) (1H,s)
1-90	2,43(3H,s), (3,21+3,63) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,49(1H,s), 7,53(1H,t), 7,71-7,84(4H,m), (8,26+8,29) (1H,s), (9,38+9,49) (1H,s)
1-91	2,44(3H,s), (3,22+3,64) (3H,s), (4,15+4,88) (2H,q), 7,51(1H,s), 7,55(1H,t), 7,69(1H,s), 7,81(2H,t), 7,94(1H,s), (8,28+8,31) (1H,s), (9,37+9,47) (1H,s)
1-92	1,26(3H,t), 2,77(2H,q), (3,21+3,63) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,48(1H,s), 7,53(1H,t), 7,59(1H,s), 7,69(1H,s), 7,76(1H,d), 7,81(1H,d), (8,25+8,27) (1H,s), (9,37+9,47) (1H,s)
1-93	1,25(3H,t), 2,77(2H,q), (3,21+3,62) (3H,s), (4,14+4,86)(2H,q), 7,49-7,56(2H,m), 7,71-7,85(4H,m), (8,25+8,28) (1H,s), (9,40+9,50) (1H,s)
1-94	1,25(3H,t), 2,78(2H,t), (3,22+3,64) (3H,s), (4,15+4,88) (2H,q), 7,48(1H,s), 7,52-7,58(2H,m), 7,65(1H,s), 7,81(2H,t), 7,96(1H,s), (8,27+8,30) (1H,s), (9,36+9,47) (1H,s)
1-95	1,25(6H,d), (3,21+3,62) (3H,s), 3,15-3,30(1H,m), (4,14+4,86) (2H,q), 7,49-7,59(3H,m), 7,67(1H,s), 7,76(1H,d), 7,82(1H,d), (8,24+8,26) (1H,s), (9,39+9,49) (1H,s)
1-96	1,25(6H,d), 3,16-3,31(1H,m), (3,21+3,63) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,49-7,57(2H,m), 7,67-7,85(4H,m), (8,25+8,27) (1H,s), (9,39+9,49) (1H,s)
1-97	1,18-1,29(6H,m), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), (3,63(q)+(4,01-4,16)(m)+4,81(q))(4H), 7,38(2H,s), 7,48-7,55(2H,m), 7,71-7,81(2H,m), (8,24+8,26) (1H,s), (9,37+9,47)(1H,s)
1-98	1,22(3H,dt), 2,32(3H,s), 2,70(2H,q), (4,12+4,80) (2H,q), (4,23+4,67) (2H,d), 5,22-5,36(2H,m), 5,72-5,98(1H,m), 7,37(2H,s), 7,52(1H,dt), 7,58(1H,s), 7,72-7,80(2H,m), 8,25(1H,s), (9,35+9,46) (1H,s)
1-99	1,23(3H,t), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), (3,94+4,41) (2H,dt), (4,26+4,96)(2H,q), 6,12(1H,m), 7,38(2H,s), 7,52(1H,t), 7,58(1H,d), 7,71-7,80(2H,m), 8,26(1H,s), (9,40+9,50) (1H,s)
1-100	1,23(3H,t), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), (3,20+3,61) (3H,s), (3,81+4,24) (2H,dt), 5,87-6,33(1H,m), 7,37(2H,s), 7,52(1H,t), 7,58(1H,d), 7,71-7,80(2H,m), 8,26(1H,s), (9,40+9,50) (1H,s)
1-101	1,20-1,38(6H,m), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), (3,61+4,00) (2H,q), (3,74+4,17) (2H,dt), 5,92-6,36(1H,m), 7,38(2H,s), 7,48-7,56(2H,m), 7,71-7,82(2H,m), 8,26(1H,s), (9,37+9,50) (1H,s)
1-102	1,24(3H,t), 2,37(3H,s), 2,71(2H,q), 3,77-4,41(4H,m), (4,32+4,43) (2H,m), 5,91-6,34(1H,m), 7,38(2H,s), 7,50(1H,s), 7,55(1H,t), 7,75(1H,d), 7,79(1H,d), 8,26(1H,s), (9,38+9,42) (1H,s)
1-103	1,24(3H,t), 2,36(3H,s), 2,71(2H,q), (3,20+3,61) (3H,s), (3,77+3,84+4,22+4,28) (2H,t), (4,63+4,69+4,74+4,81) (2H,t), 7,38(2H,s), 7,49-7,58(2H,m), 7,71-7,79(2H,m), (8,26+8,28) (1H,s), (9,42+9,49) (1H,s)
1-104	1,19-1,38(6H,m), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), (3,60+3,98) (2H,q), (3,71+3,78) (1H,t), (4,14+4,20) (1H,t), (4,61+4,68+4,73+4,79) (2H,t), 7,37(2H,s), 7,50(1H,t), 7,64(1H,d), 7,70-7,80(2H,m), 8,26(1H,s), (9,48+9,56) (1H,s)
1-105	1,22(3H,t), 2,34(3H,s), 2,69(2H,q), (3,23+3,64) (3H,s), (4,18+4,95) (2H,t), 7,37(2H,s), 7,48-7,56(2H,m), 7,73(1H,d), 7,78(1H,d), (8,23+8,26) (1H,s), (9,37+9,49) (1H,s)
1-106	1,22(3H,t), (1,46+1,53) (3H,d), 2,34(3H,s), 2,69(2H,q), (3,05+3,42) (3H,s), ((5,29-5,41)+(6,22-6,35)) (1H,m), 7,37(2H,s), 7,48-7,58(2H,m), 7,70-7,80(2H,m), 8,25(1H,s), (9,33+9,47) (1H,s)

ES 2 439 315 T3

	6,35)) (1H,m), 7,37(2H,s), 7,48-7,58(2H,m), 7,7-0-7,80(2H,m), 8,25(1H,s), (9,33+9,47) (1H,s)
1-107	(1,47+1,54) (3H,d), 2,44(3H,s), (3,06+3,45) (3H,s), ((5,30-5,43)+(6,28-6,40)) (1H, m), 7,51(1H,s), 7,55(1H,t), 7,64(1H,d), 7,81(2H,t), 7,94(1H,s), 8,29(1H,s), (9,28+9,43) (1H,s)
1-108	1,25(3H,t), (1,46+1,53) (3H,d), 2,78(2H,q), (3,05+3,43) (3H,s), ((5,29-5,42)+(6,24-6,36)) (1H,m), 7,48-7,56(2H,m), 7,69(1H,d), 7,73-7,84(3H,m), 8,27(1H,s), (9,33+9,47) (1H,s)
1-109	1,26(3H,t), 2,78(2H,q), (3,20+3,62) (3H,s), (3,81+4,25) (2H,dt), 5,87-6,33(1H,m), 7,50-7,52(2H,m), 7,72-7,83(4H,m), 8,27(1H,s), (9,40+9,49) (1H,s)
1-110	1,26(3H,t), 2,78(2H,q), (3,20+3,61) (3H,s), (3,77+3,83+4,21+4,28) (2H,t), 4,60-4,82(2H,m), 7,50-7,56(2H,m), 7,71-7,83(4H,m), (8,27+8,29) (1H,s), (9,46+9,52) (1H,s)
1-111	(1,23+1,33) (3H,t), (3,08+3,48) (3H,s), (3,53+3,93) (2H,q), 3,90(3H,s), 7,06(1H,s), 7,35(1H,s), 7,51(1H,t), 7,64(1H,s), 7,75(1H,d), 7,80(1H,d), 8,24(1H,s), (9,46+9,49) (1H,s)
1-112	(3,21+3,62) (3H,s), 3,90(3H,s), (4,14+4,86) (2H,q), 7,06(1H,s), 7,35(1H,s), 7,52(1H,t), 7,64(1H,s), 7,76(1H,d), 7,81(1H,d), (8,21+8,23) (1H,s), (9,36+9,47) (1H,s)
1-113	(1,23+1,33) (3H,t), (3,08+3,48) (3H,s), (3,53+3,93) (2H,q), 3,89(3H,s), 7,11(1H,s), 7,48-7,54(2H,m), 7,62(1H,s), 7,75(1H,d), 7,81(1H,d), 8,23(1H,s), (9,45+9,49) (1H,s)
1-114	(3,21+3,63) (3H,s), 3,89(3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,11(1H,s), 7,49-7,55(2H,m), 7,61(1H,s), 7,77(1H,d), 7,82(1H,d), (8,21+8,23) (1H,s), (9,35+9,46) (1H,s)
1-115	(1,23+1,34) (3H,t), (3,08+3,49) (3H,s), (3,54+3,94) (2H,q), 7,51-7,56(2H,m), 7,68-7,75(3H,m), 7,79-7,83(1H,m), 8,25-8,27(1H,m), (9,64+9,50) (1H,s)
1-116	(3,22+3,64) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,52-7,58(2H,m), 7,66(1H,s), 7,71(1H,s), 7,75(1H,d), 7,82(1H,d), (8,21-8,26) (1H,m), (9,34+9,46) (1H,s)
2-1	1,24(3H,t), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), (3,21+3,64) (3H,s), (4,15+4,87) (2H,q), 7,38(2H,s), 7,50-7,56(2H,m), 7,75(1H,d), 7,78(1H,d), (8,24+8,27) (1H,s), (9,36+9,47) (1H,s)
2-2	1,23(3H,t), 1,49(9H,s), 2,34(3H,s), 2,70(2H,q), 3,20(3H,s), 7,35(2H,s), 7,44(1H,t), 7,70(1H,d), 7,74-7,83(2H,m), 8,15(1H,s), 9,46(1H,s)
2-3	1,24(3H,t), 2,37(3H,s), 2,71(2H,q), (3,22+3,64) (3H,s), (4,15+4,87) (2H,q), 7,37(2H,s), 7,51-7,57(2H,m), 7,77(2H,t), (8,26+8,28) (1H,s), (9,36+9,47) (1H,s)
2-4	1,21(3H,t), 1,48(9H,s), 2,34(3H,s), 2,69(2H,q), 3,21(3H,s), 7,35(2H,s), 7,46(1H,t), 7,62(1H,s), 7,69(1H,d), 7,76(1H,d), 8,18(1H,s), 9,37(1H,s)
2-5	1,22(3H,t), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), (3,21+3,63) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,36(2H,s), 7,47-7,55(2H,m), 7,74(1H,d), 7,78(1H,d), (8,25+8,27) (1H,s), (9,36+9,47) (1H,s)
2-6	1,24(3H,t), 1,48(9H,s), 2,76(2H,q), 3,21(3H,s), 7,43-7,49(2H,m), 7,57(1H,s), 7,71(1H,d), 7,78-7,84(2H,m), 8,19(1H,s), 9,41(1H,s)
2-7	1,25(3H,t), 2,76(2H,q), (3,21+3,63) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,47(1H,s), 7,53(1H,t), 7,57(1H,s), 7,69(1H,s), 7,76(1H,d), 7,80(1H,d), (8,25+8,28) (1H,s), (9,38+9,48) (1H,s)
2-8	1,24(3H,t), 1,49(9H,s), 2,77(2H,q), 3,21(3H,s), 7,43-7,52(2H,m), 7,69-7,86(4H,m), 8,21(1H,s), 9,40(1H,s)
2-9	1,25(3H,t), 2,78(2H,q), (3,21+3,64) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,49-7,57(2H,m), 7,67(1H,s), 7,74(1H,s), 7,77(1H,d), 7,81(1H,d), (8,26+8,29) (1H,s), (9,37+9,47) (1H,s)
2-10	1,23(3H,t), 1,49(9H,s), 2,34(3H,s), 2,70(2H,q), 3,22(3H,s), 7,37(2H,s), 7,46(1H,e), 7,64-7,79(3H,m), 8,18(1H,s), 9,34(1H,s)
2-11	1,24(3H,t), 2,36(3H,s), 2,70(2H,q), (3,22+3,64) (3H,s), (4,15+4,87) (2H,q), 7,38(2H,s), 7,49-7,56(2H,m), 7,72-7,80(2H,m), (8,25+8,27)(1H,s), (9,35-9,46) (1H,s)
2-12	1,26(3H,t), 2,77(2H,q), (3,21+3,64) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,50-7,57(2H,m), 7,69(1H,s), 7,73-7,85(3H,m), (8,24+8,27) (1H,s), (9,37-9,47) (1H,s)
2-13	(1,22+1,33) (3H,t), 2,36(6H,s), (3,07+3,47) (3H,s), (3,53+3,91) (2H,q), 7,36(2H,s), 7,50(1H,t), 7,63(1H,s), 7,70-7,78(2H,m), 8,28(1H,s), (9,53+9,55) (1H,s)

## ES 2 439 315 T3

	7,63(1H,s), 7,70-7,78(2H,m), 8,28(1H,s), (9,53+9,55) (1H,s)
2-14	1,49(9H,s), 2,36(6H,s), 3,22(3H,s), 7,36(2H,s), 7,47(1H,t), 7,64-7,76(3H,m), 8,22(1H,s), 9,31(1H,s)
2-15	2,35(6H,s), (3,21+3,61) (3H,s), (4,13+4,85) (2H,q), 7,36(2H,s), 7,51(1H,t), 7,63(1H,d), 7,75(2H,t), (8,26+8,27) (1H,s), (9,41+9,50) (1H,s)
2-16	1,19-1,36(6H,m), 2,36(3H,s), 2,71(2H,q), (3,07+3,47) (3H,s), (3,53+3,91) (2H,q), 7,38(2H,s), 7,50(1H,t), 7,61(1H,s), 7,70-7,79(2H,m), 8,27(1H,s), (9,53+9,56) (1H,s)
2-17	1,23(3H,t), 1,49(9H,s), 2,35(3H,s), 2,71(2H,q), 3,22(3H,s), 7,38(2H,s), 7,47(1H,t), 7,65-7,77(3H,m), 8,21(1H,s), 9,34(1H,s)
2-18	1,23(3H,t), 2,35(3H,s), 2,70(2H,q), (3,21+3,63) (3H,s), (4,14+4,86) (2H,q), 7,38(2H,s), 7,49-7,58(2H,m), 7,72-7,80(2H,m), (8,26+8,28) (1H,s), (9,38+9,48) (1H,s)
2-19	1,49(9H,s), 2,41(3H,s), 3,23(3H,s), 7,44(1H,s), 7,50(1H,t), 7,57(1H,s), 7,72(1H,d), 7,76-7,81(2H,m), 8,24(1H,s), 9,26(1H,s)
2-20	2,42(3H,s), (3,21+3,64) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,45(1H,s), 7,54(1H,t), 7,58(1H,s), 7,72-7,83(3H,m), (8,26+8,28) (1H,s), (9,37+9,47) (1H,s)
2-21	1,49(9H,s), 2,43(3H,s), 3,23(3H,s), 7,46-7,52(2H,m), 7,71-7,81(4H,m), 8,25(1H,s), 9,28(1H,s)
2-22	2,44(3H,s), (3,22+3,64) (3H,s), (4,14+4,87) (2H,q), 7,49(1H,s), 7,54(1H,t), 7,71-7,84(4H,m), (8,27+8,29) (1H,s), (9,36+9,47) (1H,s)
2-23	1,49(9H,s), 2,43(3H,s), 3,22(3H,s), 7,45-7,52(2H,m), 7,74(1H,d), 7,77-7,83(2H,m), 7,94(1H,s), 8,25(1H,s), 9,38(1H,s)
2-24	2,44(3H,s), (3,22+3,64) (3H,s), (4,15+4,87) (2H,q), 7,49-7,58(2H,m), 7,67(1H,s), 7,81(2H,t), 7,95(1H,s), (8,28+8,31) (1H,s), (9,37+9,47) (1H,s)
2-25	1,26(3H,t), 1,49(9H,s), 2,77(2H,q), 3,22(3H,s), 7,45-7,51(2H,m), 7,59(1H,s), 7,72(1H,d), 7,75-7,82(2H,m), 8,21(1H,s), 9,33(1H,s)
2-26	1,27(3H,t), 2,77(2H,q), (3,21+3,64) (3H,s), (4,15+4,87) (2H,q), 7,49(1H,s), 7,54(1H,t), 7,60(1H,s), 7,66(1H,s), 7,76(1H,d), 7,81(1H,d), (8,25+8,28) (1H,s), (9,36+9,47) (1H,s)
2-27	1,26(3H,t), 1,49(9H,s), 2,78(2H,q), 3,23(3H,s), 7,46-7,54(2H,m), 7,69-7,82(4H,m), 8,24(1H,s), 9,27(1H,s)
2-28	1,26(3H,t), 2,79(2H,q), (3,22+3,64) (3H,s), (4,15+4,88) (2H,q), 7,51-7,57(2H,m), 7,64(1H,s), 7,74-7,84(3H,m), (8,26+8,29) (1H,s), (9,35+9,46) (1H,s)
2-29	1,24(3H,t), 1,49(9H,s), 2,78(2H,q), 3,22(3H,s), 7,48(1H,t), 7,54(1H,s), 7,71-7,77(2H,m), 7,82(1H,d), 7,97(1H,s), 8,24(1H,s), 9,27(1H,s)
2-30	1,24(3H,t), 2,78(2H,q), (3,22+3,64) (3H,s), (4,15+4,87) (2H,q), 7,51-7,57(2H,m), 7,61(1H,s), 7,77-7,85(2H,m), 7,97(1H,s), (8,27+8,30) (1H,s), (9,37+9,47) (1H,s)
3-1	(1,19+1,31) (3H,t), (1,45+1,49) (9H,s), (2,32+2,28) (3H,s), 2,47-2,72(2H,m), (3,16+3,25) (3H,s), (3,18+3,35) (3H,s), 6,98-7,87(6H,m), (8,78+9,11) (1H,s)
3-2	(1,20+1,32) (3H,t), (2,31+2,39) (3H,s), 2,49-2,80(2H,m), 3,16-3,66(6H,m), ((4,06-4,19)+(4,78-4,93)) (2H,m), 7,05-7,87(6H,m), (8,99-9,42) (1H,m)
3-3	1,20-1,25(3H,m), (2,34+2,36) (3H,s), 2,68(2H,q), 3,11-3,46(6H,m), (3,84+4,16) (2H,q), 7,38(2H,s), 7,47-7,63(3H,m), 7,82-7,91(2H,m)
3-4	(1,23+1,33) ((3H,t), 2,35(6H,s), (3,08+3,47) (3H,s), (3,53+3,91) (2H,q), 7,27(1H,t), 7,36(2H,s), 7,52(1H,s), 7,75-7,82(1H,m), (8,94+8,96) (1H,s), (9,62+9,67) (1H,s)
3-5	2,35(6H,s), (3,22+3,61) (3H,s), (4,14+4,83) (2H,q), 7,28(1H,t), 7,36(2H,s), 7,53(1H,s), 7,76-7,83(1H,m), 8,87-8,95(1H,m), (9,52+9,66) (1H,s)

Lo que sigue es la descripción de los Ejemplos de Preparación de Fármacos. A este respecto, el término "parte"

significa "parte en masa".

Ejemplo de Preparación de Fármaco 1: Emulsión

5 Se preparó una emulsión mezclando uniformemente y disolviendo el compuesto de la presente invención (10 partes), xileno (60 partes), N-metil-2-pirrolidona (20 partes), y SORPOL 3005X (el nombre registrado de una mezcla de un tensioactivo no iónico y un tensioactivo aniónico, disponible en Toho Chemical Industry Co., Ltd.) (10 partes).

Ejemplo de Preparación de Fármaco 2: Polvo dispersable en agua-1

10 Se preparó un polvo dispersable en agua mezclando uniformemente y pulverizando, en un laminador de aire, el compuesto de la presente invención (20 partes), NIPSIL NS-K (el nombre comercial del carbón blanco, disponible en Tosoh silica Co., Ltd.) (20 partes), arcilla de caolín (el nombre comercial de la caolinita, disponible en Takehara Chemical Industry Co., Ltd.) (20 partes), SUNEKIS P-252 (el nombre comercial del ligninsulfonato de sodio, disponible en Nippon Paper Chemicals Co., Ltd.) (5 partes) y RUNOX P-65L (el nombre comercial de la sal de alquilalilo del ácido sulfónico, disponible en Toho Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes).

Ejemplo de Preparación de Fármaco 3: Polvo dispersable en agua-2

15 Se preparó un polvo dispersable en agua mezclando uniformemente y pulverizando, en un laminador de aire, el compuesto de la presente invención (20 partes), NIPSIL NS-K (20 partes), arcilla de caolín (50 partes), RUNOX 1000C (el nombre comercial de un condensado de sal de ácido naftalenosulfónico, disponible en Toho Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes) y SORPOL 5276 (el nombre comercial de un tensioactivo no iónico disponible en Toho Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes).

Ejemplo de Preparación de Fármaco 4: Preparación de sol (Preparación capaz de fluir)-1

20 Se dispersó el compuesto de la presente invención (20 partes) en una mezcla que comprendía propilenglicol (5 partes), SORPOL 7933 (el nombre comercial de un tensioactivo aniónico disponible en Toho Chemical Industry Co., Ltd.) (5 partes) y agua (50 partes) para dar así una mezcla similar a una suspensión, que había sido previamente mezclada, después la mezcla similar a una suspensión fue sometida a pulverización en húmedo usando DYNOMILL (disponible en SINMARU Enterprises Co., Ltd.) y finalmente, se añadió, a la mezcla similar a una suspensión, goma xantana (0,2 partes) que había sido previamente mezclada con y dispersada en agua (19,8 partes) suficientemente.

Ejemplo de Preparación de Fármaco 5: Preparación de sol (Preparación capaz de fluir)-2

30 El compuesto de la presente invención (20 partes), NEWKALGEN FS-26 (el nombre comercial de una mezcla de sulfosuccinato de dioctilo y éter tri-estirilfenílico de polioxietileno, disponible en TAKEMOTO Oil and Fat Co., Ltd.) (5 partes), propilenglicol (8 partes) y agua (50 partes) se mezclaron preliminarmente entre sí para dar una mezcla similar a una suspensión, y después esta última fue sometida a pulverización en húmedo usando DYNOMILL (disponible en SINMARU Enterprises Co., Ltd.). Después se mezcló suficientemente goma xantana (0,2 partes) en agua y se dispersó en la misma (16,8 partes) para formar así un producto similar a un gel, y posteriormente el producto similar a un gel resultante se mezcló satisfactoriamente con la suspensión anterior para preparar así una preparación de un sol (una preparación capaz de fluir).

35 Ahora, el efecto de operación/funcionamiento y la utilidad del compuesto de la presente invención será descrito más específicamente con referencia a los siguientes Ejemplos.

Ejemplo de Ensayo 1: Efecto insecticida de los compuestos sobre larvas de *Plutella xylostella*:

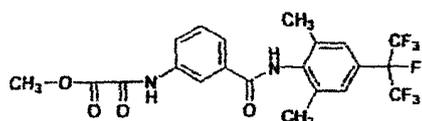
40 Se sembraron semillas de col china en una maceta y después se cultivaron los plantones a lo largo de 3 semanas. Una emulsión diluida en agua preparada según los procedimientos usados en el Ejemplo 1 de Preparación de Fármaco anterior se roció suficientemente sobre las hojas de estas plantas en maceta usando un cepillo de aire (una concentración, una vez repetido). Después de secar al aire el líquido que contenía el fármaco, las plantas fueron mantenidas en una cámara termostática mantenida a 25°C y las larvas del insecto fueron liberadas. 5 días después de la liberación de las larvas, estas últimas fueron examinadas en cuanto a si estaban muertas o no, y si estaban en agonía o no, y se determinaron las tasas de insectos (larvas) muertos (%), aunque las larvas agonizantes fueron consideradas como muertas. A este respecto, los compuestos comparativos usados en este ensayo fueron los compuestos A y B descritos en el documento JP-A-2006-306771 (Documento de Patente 25).

50 Los resultados de los ensayos anteriores indican claramente que los compuestos de la presente invención Nos. 1-1, 1-3 a 7, 1-9 a 19, 1,21 a 57, 1,59 a 60, 1,62, 1,64 a 67, 1-69 a 71, 1-73 a 78, 1-80, 1-83 a 105, 1-109, 1-111 a 116, 2-1 a 3, 2-13 a 18 y 3-4 a 5 mostraron una tasa de insectos (larvas) muertos de 100% a una concentración de 500 ppm. Contrariamente a esto, tanto el compuesto A como el compuesto B no mostraron ningún efecto insecticida.

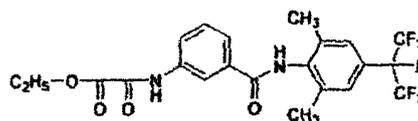
Alternativamente, cuando se llevó a cabo el mismo ensayo a una concentración más baja, se encontró que los compuestos de la presente invención especificados a continuación tuvieron una tasa de insectos (larvas) muertos de 100% a una concentración de 50 ppm: Los compuestos de la presente invención Nos. 1-4 a 7, 1-9 a 13, 1-19, 1-21 a 28, 1-30, 1-32 a 33, 1-35 a 45, 1-47, 1-49 a 51, 1-53, 1-56 a 57, 1-59 a 60, 1-62, 1-64 a 67, 1-69 a 71, 1-73 a 78, 1-

83, 1-85 a 97, 1-99 a 105, 1-109, 1-112, 1-114 a 116, 2-1 a 3, 2-13 a 18 y 3-4 a 5.

Además, el ensayo también se llevó a cabo usando el compuesto a una concentración de 12,5 ppm o 5 ppm. Como resultado, se encontró que los compuestos de la presente invención especificados a continuación tuvieron una tasa de insectos (larvas) muertos de 100% a una concentración de 12,5 ppm: Los compuestos de la presente invención Nos. 1-45, 1-62, 1-64 a 65, 1-69 a 71, 1-88 a 94, 1-96, 1-99 a 101, 1-103 a 105, 1-109, 1-112, 1-114 a 116, 2-3, 2-13 a 18 y 3-4. También se encontró que los compuestos de la presente invención Nos. 1-22 a 25, 1-28, 1-37 a 38, 1-44, 1-57, 1-59 a 60, 1-75 y 1-86 a 87 mostraron una tasa de de insectos (larvas) muertos de 100% a una concentración de 5 ppm.



Compuesto A



Compuesto B

10 Ejemplo de Ensayo 2: Ensayo del efecto acaricida de los Compuestos sobre adultos de *Tetranychus urticae*

Una taza de polietileno que tenía un volumen de 430 ml y llena de agua se cubrió con una tapa en la que se había formado un agujero (diámetro: aproximadamente 5 mm) en su centro. Se hizo un recorte que tenía una anchura de aproximadamente 5 mm en un papel de filtro circular que tenía un diámetro de 6,5 cm; la porción similar a una tira del papel de filtro, que colgaba hacia abajo, se insertó en la taza a través del agujero de la misma de tal manera que la porción fue sumergida en el agua contenida en la copa, y se puso algodón absorbente en el papel de filtro para que el agua de la taza fuera siempre suministrada al algodón absorbente. Después, dos discos de hoja (2 cm x 5 cm) preparados a partir de las hojas principales de una planta de judía se pusieron sobre el algodón absorbente y después estos dos discos de hoja fueron inoculados con 10 adultos hembra de *Tetranychus urticae*. Esta taza se puso en un cilindro de resina acrílica que tenía una altura de 50 cm y un diámetro interno de 10 cm, y después una emulsión diluida en agua preparada según los mismos procedimientos usados en el Ejemplo de Preparación de Fármaco 1 anterior fue rociada sobre cada taza en una cantidad de 1,35 ml por taza usando un cepillo de aire (una concentración, una vez repetido). Después de rociar el producto químico agrícola, las tazas fueron mantenidas en una cámara termostática mantenida a una temperatura de 25°C. 4 días después del rociado del fármaco, los adultos fueron examinados, bajo la observación mediante un binocular prismático, en cuanto a si estaban muertos o no y si estaban en agonía o no, y se determinaron las tasas de ácaros (adultos) muertos (%), aunque los adultos agonizantes fueron considerados como muertos. A este respecto, los compuestos comparativos usados en este ensayo fueron los compuestos A y B descritos en el documento de patente JP-A-2006-306771.

Los resultados de los ensayos anteriores indican claramente que los compuestos de la presente invención especificados a continuación mostraron una tasa de adultos muertos de 100% a una concentración de 50 ppm: Los compuestos de la presente invención Nos. 1-21 a 23, 1-26 a 28, 1-37 a 47, 1-49 a 50, 1-56 a 57, 1-59 a 60, 1-64 a 65, 1-69 a 71, 1-74, 1-78, 1-86 a 97, 1-100 a 101, 1-103 a 105, 1-109, 1-112, 1-114 a 116, 2-1 a 3, y 2-13 a 18. Por otra parte, tanto el compuesto A como el compuesto B no mostraron ningún efecto insecticida.

Además, el ensayo también se llevó a cabo usando el compuesto a una baja concentración del orden de 12,5 ppm o 5 ppm. Como resultado, se encontró que los compuestos de la presente invención especificados a continuación tuvieron una tasa de adultos muertos de 100% a una concentración de 12,5 ppm: Los compuestos de la presente invención Nos. 1-46, 1-50, 1-64 a 65, 1-69 a 71, 1-88 a 94, 1-96, 1-100, 1-103, 1-109, 1-115 a 116, 2-1 a 3 y 2-13 a 18. También se encontró que los compuestos de la presente invención Nos. 1-28, 1-40, 1-44 y 1-86 a 87 mostraron una tasa de adultos muertos de 100% incluso a una concentración de 5 ppm.

Ejemplo de Ensayo 3: Efecto de matar larvas de *Myzus persicae*

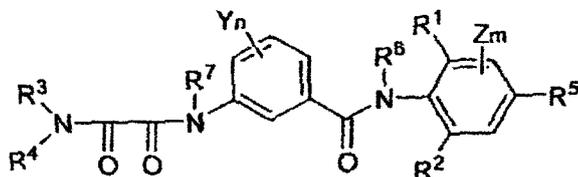
Se inocularon tres adultos de *Myzus persicae* en un trozo cortado (que tenía un tamaño de 3 cm x 4 cm) de la hoja de la col china, y se hicieron crecer durante 48 horas dentro de una cámara termostática mantenida a una temperatura de 25°C. Después de retirar los adultos, cada trozo cortado de la hoja fue sumergido en una emulsión diluida en agua preparada según los mismos procedimientos usados en el Ejemplo de Preparación de Fármaco 1 durante 5 segundos, y después se mantuvieron en una cámara termostática mantenida a una temperatura de 25°C. En el 7º día después del tratamiento anterior, se inspeccionaron las ninfas en cuanto a si estaban muertas o no y si estaban en agonía o no, y se determinaron las tasas (%) de ninfas muertas de los piojos de la planta, aunque las ninfas agonizantes se consideraron como muertas. A este respecto, los compuestos comparativos usados en este ensayo fueron los compuestos A y B descritos en el documento JP-A-2006-306771.

Los resultados de los ensayos anteriores indican claramente que los compuestos de la presente invención especificados a continuación tuvieron una tasa de ninfas muertas de 100% a una concentración de 50 ppm: Los compuestos de la presente invención Nos. 1-21, 1-24, 1-28, 1-33, 1-37 a 42, 1-44, 1-47, 1-56 a 57, 1-64 a 65, 1-69 a 71, 1-87, 1-89 a 96, 1-103 a 104, 1-109, 1-115 a 1-116, 2-2 a 3 y 2-13 a 18. Por otra parte, tanto el compuesto A como el compuesto B no mostraron ningún efecto insecticida.

5 Además, el ensayo también se llevó a cabo usando el compuesto a una baja concentración del orden de 12,5 ppm o 5 ppm. Como resultado, se encontró que los compuestos de la presente invención especificados a continuación tuvieron una tasa de ninfas muertas de 100% a una concentración de 12,5 ppm: Los compuestos de la presente invención Nos. 1-65, 1-69 a 71, 1-89 a 94, 1-97, 1-103 a 104, 1-109, 1-115, 2-2, 2-15 y 2-17 a 18. También se encontró que los compuestos de la presente invención Nos. 1-38 a 39 y 1-87 mostraron una tasa de ninfas muertas de 100% incluso a una concentración de 5 ppm.

## REIVINDICACIONES

1. Un derivado de 3-aminoxalilaminobenzamida representado por la siguiente fórmula general [1]:



[ 1 ]

en donde

5  $R^1$  y  $R^2$  representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$ , un grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$ , un átomo de halógeno o un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$ ;

$R^3$  y  $R^4$  representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_8$ , un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_8$ , un grupo alilo, un grupo cicloalquilo  $C_3$  a  $C_8$  o un grupo cicloalquil( $C_3$  a  $C_6$ )-alquilo  $C_1$  a  $C_4$ , a condición de que  $R^3$  y  $R^4$  puedan estar unidos entre sí para formar un enlace alquileo  $C_3$  a  $C_8$ ;

10  $R^5$  representa un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_5$ ;

$R^6$  y  $R^7$  representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$ , un grupo cicloalquilo  $C_3$  a  $C_8$ , un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_5$ , un grupo alcoxi( $C_1$  a  $C_3$ )-alquilo  $C_1$  a  $C_4$ , un grupo alquenilo  $C_2$  a  $C_6$ , un grupo haloalquenilo  $C_2$  a  $C_6$ , un grupo alquil( $C_1$  a  $C_4$ )-carbonilo, un grupo haloalquil( $C_1$  a  $C_4$ )-carbonilo, un grupo alquil( $C_1$  a  $C_4$ )-sulfonilo, un grupo haloalquil( $C_1$  a  $C_4$ )-sulfonilo, un grupo alcoxi( $C_1$  a  $C_3$ )-carbonilo o un grupo haloalcoxi( $C_1$  a  $C_3$ )-carbonilo.

Y representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$ , un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_5$ , un grupo alquil( $C_1$  a  $C_3$ )-amino, un grupo dialquil( $C_1$  a  $C_3$ )-amino, un grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$  o un grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$ ;

20 Z representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$ , un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_5$ , un grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$  o un grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$ ; y

n es un número entero que varía de 0 a 4 y m es un número entero que varía de 0 a 2.

25 2. El derivado de 3-aminoxalilaminobenzamida expuesto en la reivindicación 1, en donde  $R^1$  y  $R^2$  representan independientemente cada uno un grupo alcoxi  $C_1$  a  $C_3$ , un grupo haloalcoxi  $C_1$  a  $C_3$ , un átomo de halógeno o un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$ ;

$R^3$  y  $R^4$  representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_6$ , un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_6$ , un grupo alilo, un grupo cicloalquilo  $C_3$  a  $C_6$  o un grupo cicloalquil( $C_3$  a  $C_6$ )-alquilo  $C_1$  a  $C_4$ , a condición de que  $R^3$  y  $R^4$  puedan estar unidos entre sí para formar un enlace alquileo  $C_3$  a  $C_6$ ;

$R^5$  representa un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_5$ ;

30  $R^6$  y  $R^7$  representan independientemente cada uno un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_5$ ;

Y representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_3$  o un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_3$ ;

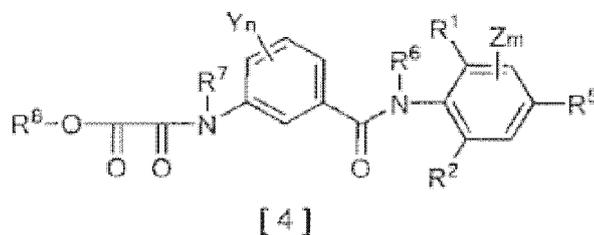
Z representa independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_3$ ; y

n es un número entero que varía de 0 a 4 y m es un número entero que varía de 0 a 2.

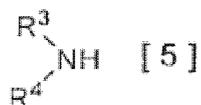
35 3. El derivado de 3-aminoxalilaminobenzamida expuesto en la reivindicación 2, en donde  $R^1$  representa un grupo metoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo isopropilo; y  $R^2$  representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metilo o un grupo etilo.

40 4. El derivado de 3-aminoxalilaminobenzamida expuesto en la reivindicación 2, en donde  $R^3$  es un grupo metilo o un grupo etilo y  $R^4$  representa un grupo alquilo  $C_1$  a  $C_6$ , un grupo haloalquilo  $C_1$  a  $C_6$ , un grupo alilo, un grupo cicloalquilo  $C_3$  a  $C_6$  o un grupo cicloalquil( $C_3$  a  $C_6$ )-alquilo  $C_1$  a  $C_4$ , a condición de que  $R^3$  y  $R^4$  puedan estar unidos entre sí para formar un enlace alquileo  $C_3$  a  $C_6$ .

5. Un método para preparar un compuesto expuesto en la reivindicación 1, que comprende la etapa de hacer reaccionar un compuesto representado por la siguiente fórmula general [4]:

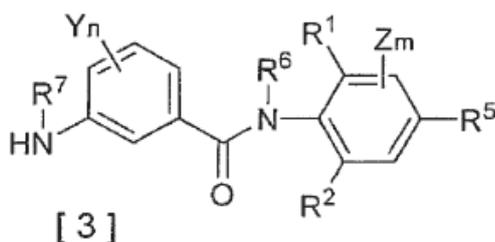


5 (en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, n, m, Y y Z son los mismos que los especificados anteriormente y R<sup>8</sup> representa un grupo alquilo inferior) con un compuesto representado por la siguiente fórmula general [5]:

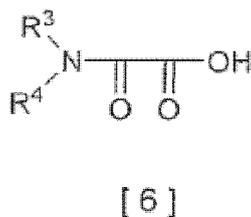


(en donde R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son los mismos que los especificados anteriormente)

o que comprende la etapa de hacer reaccionar un compuesto representado por la siguiente fórmula general [3]:

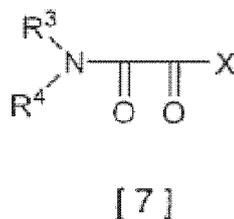


10 (en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, n, m, Y y Z son los mismos que los especificados anteriormente) con un compuesto representado por la siguiente fórmula general [6]:



(en donde R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son los mismos que los especificados anteriormente)

o bien con un compuesto representado por la siguiente fórmula general [7]:



15

(en donde R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> son los mismos que los especificados anteriormente y X representa un átomo de halógeno).

6. Un agente insecticida o un agente acaricida que comprende, como ingrediente activo, un derivado de 3-aminoxalilaminobenzamida como el expuesto en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.