

OP.



Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

07-22198

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO DERIVADO DE FTALAMIDA OPTICAMENTE
ACTIVO, INSECTICIDA AGRICOLA U HORTICOLA Y
METODO DE USO DEL MISMO.

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE NIHON NOHYAKU CO., LTD.

DOMICILIO TOKIO, JAPÓN.

74. APODERADO GERMAN A. CUBILLOS MENDOZA.

22. **BOGOTÁ, D. C.,** _____

F.N. 23-03-2007
Pake, Cecilia

PETITORIO			
Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO Rad: 07-022198- -00000-0000 Fee: 2007-03-08 14:59:14 Dep. 2020 NUECREACIONES Tra. 11 PATENTE/VI EYE: 378 FASE NACIONAL Act 411 PRESENTACION Folios: 238 FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL	
① SOLICITUD DE :			
☒ Patente de invención.		☐ Patente de Modelo de Utilidad.	
☒ Capítulo I.		☐ Capítulo II.	
② SOLICITANTE (71)	Nombre: NIHON NOHYAKU CO., LTD. Dirección: 2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokio, Japón Nacionalidad o Domicilio: TOKIO, JAPÓN Lugar de Constitución: JAPÓN Teléfono: Fax: E-mail:	IDENTIFICACIÓN C.C. ☐ NT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____	
③ REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: GERMAN CUBILLOS MENDOZA Calle 17 No. 8 - 49 Torre A, Dirección: Oficina 408 Bogotá, Colombia Teléfono: 2432835 Fax: 2848488 E-mail: nannett@col.net.co	IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número 19.387.478 TP. 38422 C.C.I.	
④ INVENTOR (ES) (72)	Nombre: (Ver anexo A) Dirección: (Ver anexo B) Nacionalidad o Domicilio: (Ver anexo C)		
⑤ PCT (86) Solicitud Internacional No. PCT/JP2005/015208 Fecha Agosto 22 de 2005 Publicación Internacional No. WO 2006/022225 Fecha Marzo 2 de 2006			
⑥ Título (84) DERIVADO DE FTALAMIDA ÓPTICAMENTE ACTIVO, INSECTICIDA AGRÍCOLA U HORTÍCOLA Y MÉTODO DE USO DEL MISMO.			
⑦ Clasificación Internacional (81) _____			
⑧ Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen JAPON	(32) Fecha 2004-08-23	(31) Número de Solicitud 2004-242259
⑨ Comprobante de pago No. 07-1-172 Fecha 2007-02-07			
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.			

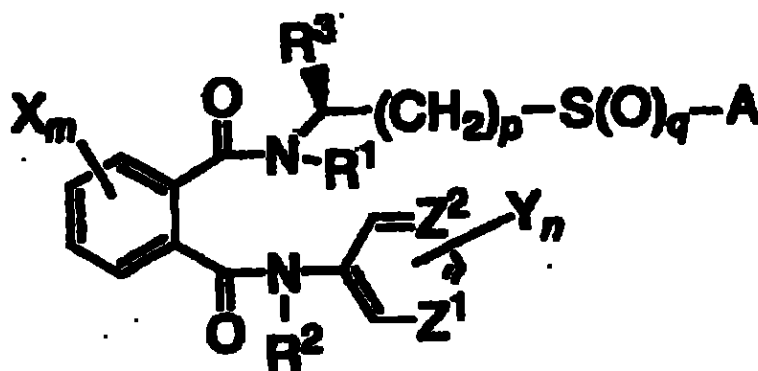
11

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- ☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☐ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento de cesión del invento al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☒ Arte final 12x12.
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- ☒ Otros Reporte de búsqueda internacional y su traducción al castellano

12

FIGURA CARACTERÍSTICA:



13

Solicito la concesión de la patente.

NOMBRE GERMAN CUBILLOS MENDOZA

FIRMA

G.C. 19.397.470

T.P. 38.422 C.S.J.

Instrucciones para la presentación de los anexos, ver reverso de esta página.

ANEXO A
NOMBRE DE LOS INVENTORES

Inventor (es)

- 1. Hayami NAKAO**
- 2. Yoshihiro MATSUZAKI**
- 3. Shinsuke FUJIOKA**
- 4. Masayuki MORIMOTO**
- 5. Masanori TOHNISHI**
- 6. Rudlger FISCHER**
- 7. Christian FUNKE**
- 8. Olga MALSAM**
- 9. Christian ARNOLD**
- 10. Erich SANWALD**
- 11. Waltraud HEMPEL**
- 12. Udo RECKMANN**

ANEXO B

DIRECCION DE LOS INVENTORES

- 1. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.**
- 2. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.**
- 3. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.**
- 4. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón.**
- 5. 345, Oyamadacho, Kawachinagano-shi, Osaka, Japón**
- 6. Zu den Flussfallen 23, Pulheim 50259, Alemania.**
- 7. Rothenberg 75a, Leichlingen 42799, Alemania.**
- 8. Berghovenerstr. 67, Bonn 53227, Alemania.**
- 9. Grimmerdorfer Weg 11, Wachtberg-Adendorf 53343, Alemania.**
- 10. Fallreep 15, Klei 24159, Alemania.**
- 11. Zum Morgengraben 18, Liederbach 65835, Alemania.**
- 12. Rontgenstr. 18, Köln 50823, Alemania.**

ANEXO C DOMICILIO DE LOS INVENTORES

- 1. Osaka, Japón.**
- 2. Osaka, Japón.**
- 3. Osaka, Japón.**
- 4. Osaka, Japón.**
- 5. Osaka, Japón.**
- 6. Pulheim, Alemania.**
- 7. Leichlingen, Alemania.**
- 8. Bonn, Alemania.**
- 9. Wachtberg-Adendorf, Alemania.**
- 10. Kiel, Alemania.**
- 11. Liederbach, Alemania.**
- 12. Köln, Alemania.**

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
 Rad: 07-022198- -00000-0000
 Fe: 2007-02-06 14:58:14 Dep. 2020 NUECREACIONES
 Tra. 11 PATENTE Y
 Eje: 375 FASE NACIONAL
 Act 111 ORIENTACION

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 11,172
 FECHA : FEBRERO 7 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
MERCEDES ROSALES	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	59096659	07/02/2007	1,207,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	482,000.00
		TOTAL :	\$ 482,000.00

SON: CUATROCIENTOS OCHENTA Y DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



**EMBAJADA DE COLOMBIA
SECCION CONSULAR
TOKIO, JAPON**

Tokio, 21 de mayo de 2003

No 21/2003

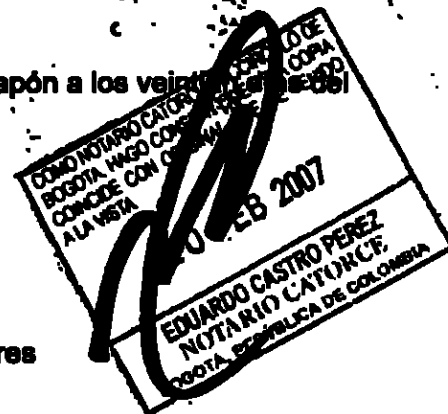
El suscrito Encargado de las Funciones Consulares en Tokio,

CERTIFICA

- Que la compañía **NIHON NOHYAKU CO, LTD** está constituida de acuerdo con las leyes del Japón, desde el día 10 de febrero de 1926, y tiene su sede principal en la ciudad de Tokio - Japón, según consta en el certificado de inscripción y registro de la Oficina de Asuntos Legales de Tokio, número de registro de personería jurídica 0199-01-034985, documento cuyo original y traducción al español tuvo a la vista.
- Que el objeto social de la compañía **NIHON NOHYAKU CO, LTD**, se encuentra descrito en el certificado de inscripción y registro anexo a la presente.
- Que la junta directiva de la compañía **NIHON NOHYAKU CO, LTD** esta constituida por las siguientes personas: **SHUKICHI OUCHI**, en calidad de Director Representante; **KUNIYOSHI KURODA**, en calidad de Director Representante; **KUNIAKI TANINAKA**, en calidad de Director; **SEIKOU IWASHITA**, en calidad de Director; **SADAO URABE**, en calidad de Director; **MASAATSU SOUMI**, en calidad de Director; **YOUJI KIKYO**, en calidad de Director; **HIROSHI HAMAGUCHI**, en calidad de Director; **FUJIO ARAKI**, en calidad de Auditor; **AKIRA IIDA**, en calidad de Auditor; **MORIO TAMURA** en calidad de Auditor.
- Que el señor **SHUKICHI OUCHI**, en su calidad de Director Representante, esta autorizado para firmar el poder adjunto a la presente.

En constancia de lo anterior se firma en la ciudad de Tokio, Japón a los veintidós (22) días del mes de mayo de dos mil tres.


SERGIO SUAREZ ROA
Primer Secretario
Encargado de las Funciones Consulares



Fondo Rotatorio	US\$ 100.00
Impuesto de timbre	US\$ 8.00
Total derechos cancelados:	US\$ 108.00 (Ciento ocho dólares)

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

2000 JUN 17 A 9:23

SENAR SUMAR
636679

1947
JEFE DE LEGALIZACIONES
CONSULADO DE BOGOTA D.C.

CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES DE NOTARIO

CONFECCIONADO POR EL CIRCULO N.
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE ESTA COPIA
CONCUE CON ORIGINAL QUE HE TERCIO
ALANSA
20 FEB 2007
EDUARDO
NOTARIO (C) BOGOTA D.C.
BOGOTA, 17 DE JUNIO DE 2000



1

DESCRIPTION

OPTICALLY ACTIVE PHTHALAMIDE DERIVATIVE, AGRICULTURAL
OR HORTICULTURAL INSECTICIDE, AND METHOD OF USING
THE SAME

TECHNICAL FIELD

5 The present invention relates to an optically
active phthalamide derivative, an agrohorticultural
insecticide containing the compound as an active
ingredient, and a method of using the same.

BACKGROUND ART

10 It has previously been known that a certain
type of phthalamide derivative is useful as an
agrohorticultural insecticide (see JP-A-11-240857, for
example). In addition, it has also been known that a
phthalamide derivative having a skeleton that is
15 similar to that of the present invention is useful as
an agrohorticultural insecticide (see JP-A-2001-131141,
for example). However, these previous publications
have disclosed only a racemic body and a part of
optically active substances having a certain
20 substituent. Thus, the optically active substance
having a substituent of the present invention is a
novel compound and it has not yet been known that it
has superior performance as an insecticide.

DISCLOSURE OF INVENTION

PROBLEMS TO BE SOLVED BY THE INVENTION

In crop production in the agricultural and horticultural fields, damage caused by insect pests is still serious. For such reasons as emergence of insect pests that are resistant to the existing insecticides, the development of a novel agrohorticultural insecticide has been desired. In addition, for such reasons as aging of farmer population, various types of labor-saving methods have been desired. At the same time, the development of agrohorticultural insecticides suitable for such labor-saving methods has also been desired.

MEANS TO SOLVE THE PROBLEM

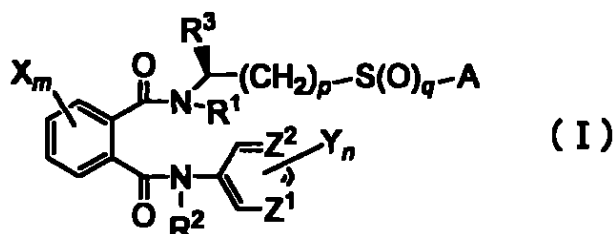
As a result of intensive studies directed towards the development of a novel agrohorticultural insecticide, the present inventors have found that the optically active phthalamide derivative represented by formula (I) of the present invention is a novel compound that had not been described in any publications, and that when compared with the compounds described in the aforementioned publications, it exhibits superior insecticidal effects at a low dosage. Further, they also have found that the optically active phthalamide derivative of the present invention can be a superior agrohorticultural insecticide exhibiting excellent activity to be absorbed from plant roots and

3

translocated into the whole plants, in particular, when soil or the like is treated with this insecticide.

Thus, the present inventors have completed the present invention.

5 That is to say, the present invention relates to an optically active phthalamide derivative represented by formula (I) indicated below:



(wherein R¹ and R² may be same or different, and each of R¹ and R² represents a hydrogen atom; a C1-
10 C6 alkyl group; a substituted C1-C6 alkyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a mono-C1-C6 alkylamino group, and a di-C1-C6 alkylamino
15 group in which the alkyl groups may be same or different; or a C1-C6 alkoxycarbonyl group;

R³ represents a C1-C6 alkyl group;

A represents a hydrogen atom; a C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkyl group; a C3-C6 alkenyl group;
20 a halo C3-C6 alkenyl group; a C3-C6 alkynyl group; a halo C3-C6 alkynyl group; a C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkylthio C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkylthio C1-

C6 alkyl group; a C1-C6 alkylsulfinyl C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkylsulfonyl C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkylsulfonyl C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkylcarbonyl group; a mono-C1-C6 alkylcarbamoyl group; a di-C1-C6 alkylcarbamoyl group in which the alkyl groups may be same or different; a phenoxy C1-C6 alkyl group; a substituted phenoxy C1-C6 alkyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a phenyl C1-C6 alkyl group; or a substituted phenyl C1-C6 alkyl group having, on the ring thereof, one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6

5

alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group,
 a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino
 group in which the alkyl groups may be same or
 different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a
 5 di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl
 groups may be same or different;

p represents an integer between 0 and 4;

q represents an integer between 0 and 2;

X may be same or different and represents a
 10 halogen atom, a cyano group, an amino group, a nitro
 group, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a
 C2-C6 alkenyl group, a halo C2-C6 alkenyl group, a C2-
 C6 alkynyl group, a halo C2-C6 alkynyl group, a C1-C6
 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6
 15 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6
 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group,
 a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl
 group, a mono-C1-C6 alkylamino group, or a di-C1-C6
 alkylamino group in which the alkyl groups may be same
 20 or different; and

m represents an integer between 0 and 4; and

X may form a condensed ring together with
 carbon atoms adjacent thereto on a phenyl ring, and
 such a condensed ring may have one or more substituents
 25 that may be same or different and are selected from the
 group consisting of a halogen atom; a C1-C6 alkyl
 group; a halo C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkoxy group;
 a halo C1-C6 alkoxy group; a C1-C6 alkylthio group; a

halo C1-C6 alkylthio group; a C1-C6 alkylsulfinyl group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl group; a C1-C6 alkylsulfonyl group; a halo C1-C6 alkylsulfonyl group; a mono-C1-C6 alkylamino group; a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different; a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group; a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a phenyl group; a substituted phenyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a heterocyclic group; and a substituted heterocyclic group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group,

7

a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and
 5 a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different;

Y may be same or different and represents a hydrogen atom; a halogen atom; a cyano group; an amino group; a nitro group; a C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6
 10 alkyl group; a C2-C6 alkenyl group; a halo C2-C6 alkenyl group; a C2-C6 alkynyl group; a halo C2-C6 alkynyl group; a cyclo C3-C6 alkyl group; a halocyclo C3-C6 alkyl group; a C1-C6 alkoxy group; a halo C1-C6 alkoxy group; a C1-C6 alkylthio group; a halo C1-C6
 15 alkylthio group; a C1-C6 alkylsulfinyl group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl group; a C1-C6 alkylsulfonyl group; a halo C1-C6 alkylsulfonyl group; a mono-C1-C6 alkylamino group; a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different; a tri-C1-C6
 20 alkylsilyl group in which the alkyl groups may be same or different; a phenyl group; a substituted phenyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6
 25 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a

halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a heterocyclic group; or a substituted heterocyclic group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; and

n represents an integer between 1 and 5; and

Y may form a condensed ring together with carbon atoms adjacent thereto on a phenyl ring, and such a condensed ring may have one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom; a C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkoxy group; a halo C1-C6 alkoxy group; a C1-C6 alkylthio group; a halo C1-C6 alkylthio group; a C1-C6 alkylsulfinyl

group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl group; a C1-C6
alkylsulfonyl group; a halo C1-C6 alkylsulfonyl group;
a mono-C1-C6 alkylamino group; a di-C1-C6 alkylamino
group in which the alkyl groups may be same or
5 different; a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group; a
di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl
groups may be same or different; a phenyl group; a
substituted phenyl group having one or more
substituents that may be same or different and are
10 selected from the group consisting of a halogen atom, a
C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6
alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6
alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6
alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group,
15 a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl
group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6
alkylamino group in which the alkyl groups may be same
or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and
a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl
20 groups may be same or different; a heterocyclic group;
or a substituted heterocyclic group having one or more
substituents that may be same or different and are
selected from the group consisting of a halogen atom, a
C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6
25 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6
alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6
alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group,
a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl

10

group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6
alkylamino group in which the alkyl groups may be same
or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and
a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl
5 group may be same or different; and

Z^1 and Z^2 may be same or different, and each
of Z^1 and Z^2 represents C-Y (wherein Y has the same
meaning as described above) or nitrogen atom;

provided that, when both R^1 and R^2 represent
10 hydrogen atoms, R^3 represents a methyl group, X
represents an iodine atom, m represents 1, Yn
represents a 2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-
(trifluoromethyl)ethyl] group, p represents 1, and q
represents 0, then A is not a methyl group and ethyl
15 group);

a salt thereof, an agrohorticultural
insecticide comprising these substances as active
ingredients, and a method of using the same.

The optically active phthalamide derivative
20 represented by the formula (I) of the present invention
exhibits excellent control effects as an
agrohorticultural insecticide. In addition, even when
it is used in admixture with other agrohorticultural
insecticides, acaricides, nematocides, fungicides,
25 herbicides, plant growth regulators, biotic pesticides,
and the like, it exhibits excellent control effects.

BEST MODE FOR CARRYING OUT THE INVENTION

In the formula (I) representing the optically active phthalamide derivative of the present invention, the term "halogen atom" is used to mean a chlorine atom, bromine atom, iodine atom, or fluorine atom. The
5 term "C1-C6 alkyl group" is used to mean a linear or branched alkyl group containing 1 to 6 carbon atoms. Examples of such a C1-C6 alkyl group may include a methyl group, ethyl group, n-propyl group, isopropyl group, n-butyl group, isobutyl group, s-butyl group, t-
10 butyl group, n-pentyl group, neopentyl group, and n-hexyl group. The term "halo C1-C6 alkyl group" is used to mean a linear or branched alkyl group containing 1 to 6 carbon atoms, which is substituted with one or more halogen atoms that may be same or different.
15 Examples of such a halo C1-C6 alkyl group may include a trifluoromethyl group, a difluoromethyl group, a perfluoroethyl group, a 1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl group, a chloromethyl group, a bromomethyl group, a 1-bromoethyl group, and a 2,3-
20 dibromopropyl group. The term "C1-C6 alkoxy group" is used to mean a linear or branched alkoxy group containing 1 to 6 carbon atoms. Examples of such a C1-C6 alkoxy group may include a methoxy group, ethoxy group, n-propoxy group, isopropoxy group, n-butoxy
25 group, s-butoxy group, t-butoxy group, n-pentyloxy group, isopentyloxy group, neopentyloxy group, and n-hexyloxy group.

The term "halo C1-C6 alkoxy group" is used to

mean a linear or branched C1-C6 alkyl group containing 1 to 6 carbon atoms, which is substituted with one or more halogen atoms that may be same or different.

Examples of such a halo C1-C6 alkoxy group may include 5 a difluoromethoxy group, a trifluoromethoxy group, and a 2,2,2-trifluoroethoxy group. The term "C1-C6 alkoxy carbonyl group" is used to mean a linear or branched alkoxy carbonyl group containing 1 to 6 carbon atoms. Examples of such a C1-C6 alkoxy carbonyl group 10 may include a methoxy carbonyl group, ethoxy carbonyl group, n-propoxy carbonyl group, isopropoxy carbonyl group, n-butoxy carbonyl group, and t-butoxy carbonyl group. The term "C1-C6 alkylthio group" is used to mean a linear or branched alkylthio group containing 1 15 to 6 carbon atoms. Examples of such a C1-C6 alkylthio group may include a methylthio group, ethylthio group, n-propylthio group, isopropylthio group, n-butylthio group, s-butylthio group, t-butylthio group, n-pentylthio group, isopentylthio group, and n-hexylthio 20 group. The term "C1-C6 alkylsulfinyl group" is used to mean a linear or branched alkylsulfinyl group containing 1 to 6 carbon atoms. Examples of such a C1-C6 alkylsulfinyl group may include a methylsulfinyl group, ethylsulfinyl group, n-propylsulfinyl group, 25 isopropylsulfinyl group, n-butylsulfinyl group, s-butylsulfinyl group, t-butylsulfinyl group, n-pentylsulfinyl group, isopentylsulfinyl group, and n-hexylsulfinyl group. The term "C1-C6 alkylsulfonyl

group" is used to mean a linear or branched alkylsulfonyl group containing 1 to 6 carbon atoms. Examples of such a C1-C6 alkylsulfonyl group may include a methylsulfonyl group, ethylsulfonyl group, n-
5 propylsulfonyl group, isopropylsulfonyl group, n-butylsulfonyl group, s-butylsulfonyl group, t-butylsulfonyl group, n-pentylsulfonyl group, isopentylsulfonyl group, and n-hexylsulfonyl group.

Examples of a "heterocyclic group" may
10 include a pyridyl group, a pyridin-N-oxide group, a pyrimidinyl group, a furyl group, a tetrahydrofuryl group, a thienyl group, a tetrahydrothienyl group, a tetrahydropyranyl group, a tetrahydrothiopyranyl group, an oxazolyl group, an isoxazolyl group, an oxadiazolyl
15 group, a thiazolyl group, an isothiazolyl group, a thiadiazolyl group, an imidazolyl group, a triazolyl group, and a pyrazolyl group. Examples of a "condensed ring" may include naphthalene, tetrahydronaphthalene, indene, indan, quinoline, quinazoline, indole,
20 indoline, chromane, isochromane, benzodioxane, benzodioxole, benzofuran, dihydrobenzofuran, benzothiophene, dihydrobenzothiophene, benzoxazole, benzothiazole, benzimidazole, and indazole.

Examples of a salt of the optically active
25 phthalamide derivative represented by the formula (I) of the present invention may include: inorganic acid salts such as hydrochloride, sulfate, nitrate, or phosphate; organic acid salts such as acetate,

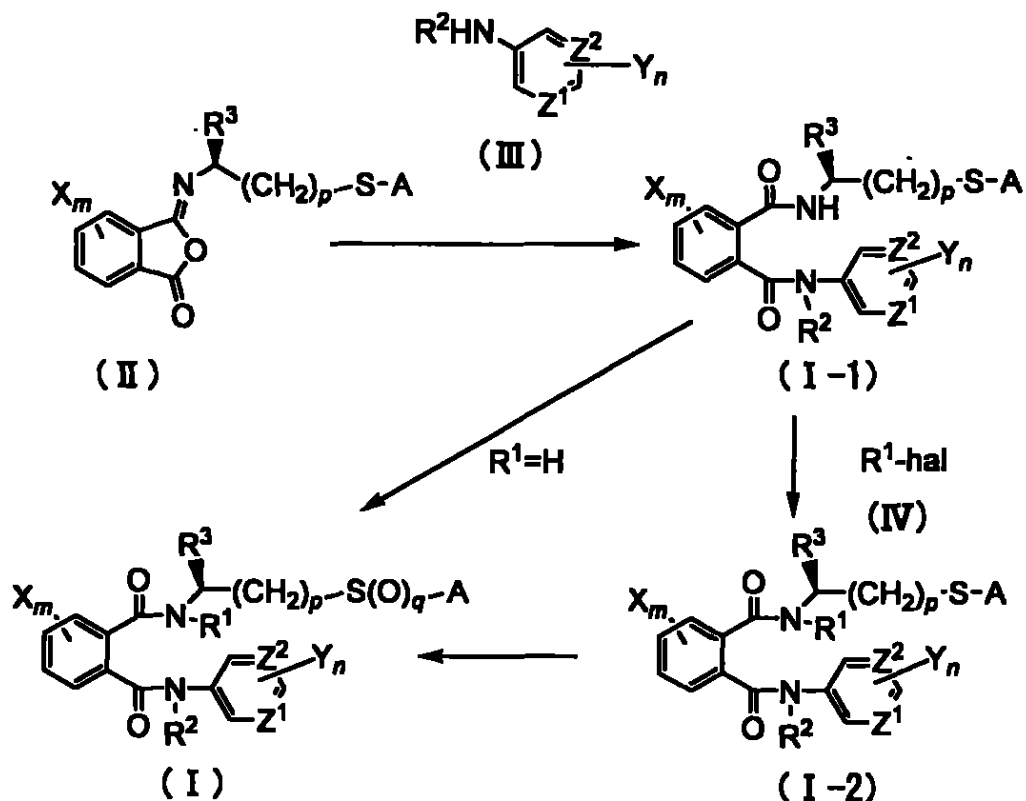
fumarate, maleate, oxalate, methanesulfonate, benzenesulfonate, or paratoluenesulfonate; and salts formed with sodium ion, potassium ion, or calcium ion.

In the optically active phthalamide

5 derivative represented by the formula (I) of the present invention, R^1 and R^2 are particularly preferably hydrogen atoms, and R^3 is particularly preferably a methyl group. A is preferably a C1-C6 alkyl group, and particularly preferably a methyl group or ethyl group.
10 p is preferably 1 or 2, and particularly preferably 1. q is an integer between 0 and 2, preferably 1 or 2, and particularly preferably 2. X is preferably a halogen atom, and particularly preferably a chlorine atom, bromine atom, or iodine atom. m is preferably 1 or 2,
15 and particularly preferably 1. Y is preferably a C1-C6 alkyl group, halogen atom, halo C1-C6 alkyl group, or halo C1-C6 alkoxy group. n is preferably 2 or 3. Z^1 and Z^2 are particularly preferably CH.

The absolute stereochemistry of the optically
20 active phthalamide derivative represented by the formula (I) of the present invention is a (S) form. It can be produced by the production method shown in the following formula, for example:

15



wherein R^1 , R^2 , R^3 , A , X , Y , Z^1 , Z^2 , p , q , m , and n have the same meanings as described above, and hal represents a halogen atom.

A phthalisoimide derivative represented by
 5 formula (II) is allowed to react with an aniline
 derivative represented by formula (III) in the presence
 or absence of an acid or base in an inert solvent, so
 as to obtain a phthalamide derivative represented by
 formula (I-1). The phthalamide derivative (I-1) is
 10 then allowed to react with a halide represented by
 formula (IV) in the presence of a dehydrohalogenating
 agent and an inert solvent, so as to obtain a
 phthalamide derivative represented by formula (I-2).
 The phthalamide derivative (I-2) is then allowed to

react with an oxidizing agent in the presence of an inert solvent, so as to produce a phthalamide derivative represented by the formula (I). When R^1 is a hydrogen atom, the phthalamide derivative represented by the formula (I) can be produced by allowing the phthalamide derivative represented by the formula (I-1) to react with an oxidizing agent in the presence of an inert solvent, without the process of producing the phthalamide derivative represented by the formula (I-2).

(1) Formula (II) $\rightarrow$ Formula (I-1)

In the present reaction, a product of interest can be produced by the method described in J. Med. Chem., 1967, Vol. 10, p. 982. Any inert solvent is used in the present invention, unless it significantly inhibits the progress of the reaction. Examples of such an inert solvent may include tetrahydrofuran, diethyl ether, methyl t-butyl ether, dioxane, chloroform, methylene chloride, chlorobenzene, toluene, acetonitrile, ethyl acetate, and butyl acetate. Examples of an acid used in the present reaction may include: organic acids such as acetic acid or trifluoroacetic acid; and inorganic acids such as hydrochloric acid or sulfuric acid. Such an acid may be used as appropriate in the range between a catalytic amount and an excessive molar amount with respect to the phthalisoimide derivative represented by the formula (II). Examples of a base may include: organic

bases such as triethylamine or pyridine; and inorganic bases such as potassium carbonate, sodium bicarbonate, sodium carbonate, or sodium hydroxide. Such a base may be used as appropriate in the range between a catalytic amount and an excessive molar amount with respect to the phthalisoimide derivative represented by the formula (II). The reaction temperature may be in the range between 0°C and the boiling point of an inert solvent used. The reaction time is different depending on the reaction scale, the reaction temperature, etc. It is in the range between several minutes and 48 hours. After completion of the reaction, a product of interest may be isolated from the reaction mixture containing it according to common methods. The obtained product is purified by recrystallization, column chromatography, or the like, if necessary, so as to produce a product of interest.

(2) Formula (I-1) → Formula (I-2)

Any inert solvent is used in the present invention, unless it significantly inhibits the progress of the reaction. Examples of such an inert solvent may include: aromatic hydrocarbons such as benzene, toluene, or xylene; halogenated aromatic hydrocarbons such as fluorobenzene, chlorobenzene, or dichlorobenzene; halogenated hydrocarbons such as methylene chloride, chloroform, or carbon tetrachloride; chain or cyclic ethers such as diethyl ether, dioxane, or tetrahydrofuran; esters such as

ethyl acetate; amides such as dimethylformamide or dimethylacetamide; acids such as acetic acid; dimethyl sulfoxide; and 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone. These inert solvents may be used singly or in combination of two or more types. Examples of a dehydrohalogenating agent may include: organic bases such as triethylamine or pyridine; and inorganic bases such as potassium carbonate, sodium bicarbonate, sodium carbonate, or sodium hydroxide. Since the present reaction is an equimolar reaction, all reactants may be used at an equimolar amount. However, it is also possible to use a certain reactant at an excessive amount. The reaction temperature may be between room temperature and the reflux temperature of an inert solvent used.

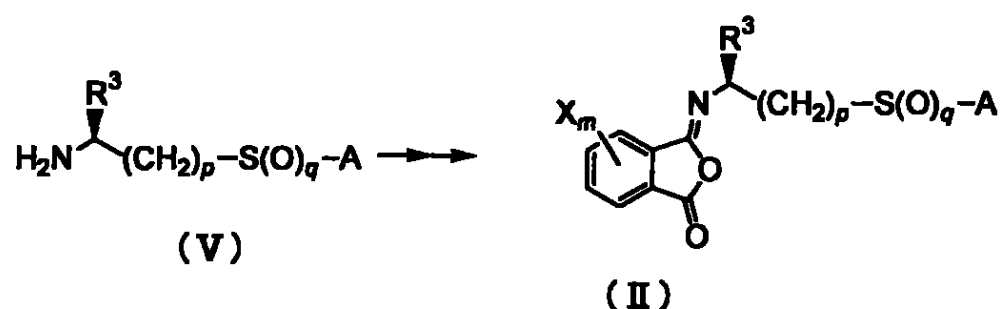
The reaction time is different depending on the reaction scale, the reaction temperature, etc. It may be selected as appropriate from the range between several minutes and 48 hours. After completion of the reaction, a product of interest may be isolated from the reaction mixture containing it according to common methods. The obtained product is purified by recrystallization, column chromatography, or the like, if necessary, so as to produce a product of interest. In addition, it is also possible to subject the obtained product of interest to the following reaction without isolation of the product from the reaction mixture.

(3) Formula (I-1) or (I-2) $\rightarrow$ Formula (I)

Examples of an inert solvent used in the present reaction may include: halogenated hydrocarbons such as methylene chloride or chloroform; aromatic hydrocarbons such as toluene or xylene; halogenated aromatic hydrocarbons such as fluorobenzene, chlorobenzene, or dichlorobenzene; acids such as acetic acid; and alcohols such as methanol, ethanol, or propanol. Examples of an oxidizing agent may include metachloroperbenzoic acid, peracetic acid, potassium metaperiodate, potassium hydrogen persulfate (oxone), and hydrogen peroxide. Such an oxidizing agent may be used in an amount between 0.5 and 3 equivalents with respect to the phthalamide derivative represented by the formula (I-1) or (I-2). The reaction temperature may be in the range between -50°C and the boiling point of an inert solvent used. The reaction time is different depending on the reaction scale, the reaction temperature, etc. It may be selected as appropriate from the range between several minutes and 24 hours. After completion of the reaction, a product of interest may be isolated from the reaction mixture containing it according to common methods. The obtained product can be purified by recrystallization, column chromatography, or the like, if necessary, so as to produce a product of interest.

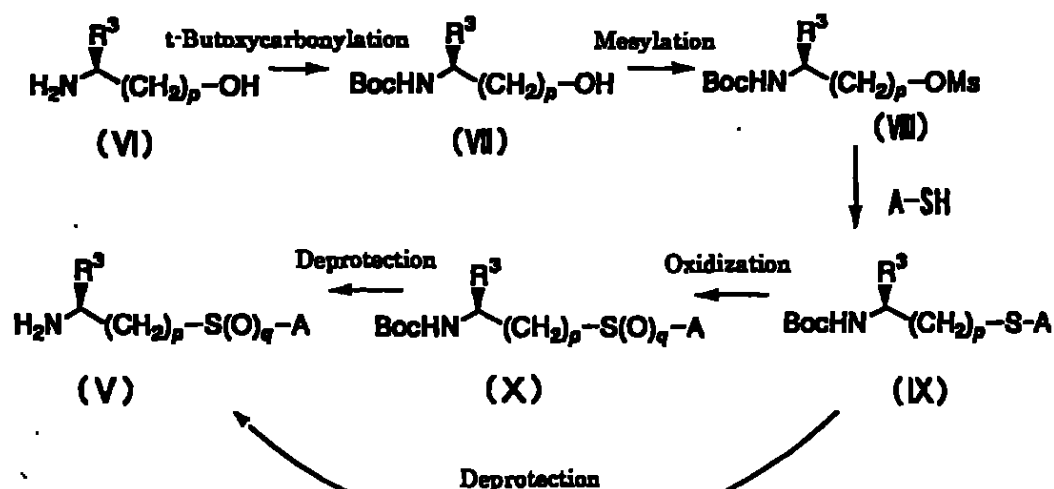
The phthalisoimide derivative represented by the formula (II) that is used as a raw material compound of the present invention can be produced from

an optically active amine represented by formula (V) according to the production methods described in JP-A-11-240857 and JP-A-2001-131141, as shown in the following formula:



5 wherein R^3 , A, X, p, q, and m have the same meanings as described above.

The optically active amine represented by the formula (V) can be produced from an optically active amino alcohol according to known methods (for example, 10 Tetrahedron Lett., 1989, Vol. 30, p. 2653), by the production method indicated below, for example.



wherein R^3 , A, p, and q have the same meanings as

described above; Boc represents a t-butoxycarbonyl group; and Ms represents a mesyl group.

An optically active amino alcohol represented by formula (VI) is subjected to t-butoxycarbonylation, so as to obtain a carbamate represented by formula (VII). The carbamate is then subjected to mesylation, so as to obtain a mesylate represented by formula (VIII). The obtained mesylate is then allowed to react with a thiol, so as to obtain a sulfide represented by formula (IX). When q is 0, the obtained sulfide is directly deprotected, so as to produce an optically active amine of interest represented by the formula (V). In contrast, when q is 1 or 2, the sulfur atom of the sulfide represented by the formula (IX) is oxidized to obtain a sulfoxide or sulfone represented by formula (X), followed by the deprotection of the obtained product, so as to produce an optically active amine of interest represented by the formula (V).

The agrohorticultural insecticide, containing an optically active phthalamide derivative represented by the formula (I) of the present invention as an active ingredient, are suitable for controlling various insect pests such as agrohorticultural insect pests, stored grain insect pests, house insect pests, sanitary insect pests, nematodes, etc., which are injurious to paddy rice, fruit trees, vegetables, other crops, flowers, ornamental plants, etc. They have a marked insecticidal effect, for example, on LEPIDOPTERA

- including summer fruit tortrix (Adoxophes orana fasciata), smaller tea tortrix (Adoxophyes sp.), Manchurian fruit moth (Grapholita inopinata), oriental fruit moth (Grapholita molesta), soybean pod borer
- 5 (Leguminovora glycinivorella), mulberry leafroller (Olethreutes mori), tea leafroller (Caloptilia thevivora), Caloptilia sp. (Caloptilia zachrysa), apple leafminer (Phyllonorycter ringoniella), pear barkminer (Spulerrina astaurota), common white (Piers rapae
- 10 crucivora), tobacco budworm (Heliothis sp.), codling moth (Laspeyresia pomonella), diamondback moth (Plutella xylostella), apple fruit moth (Argyresthia conjugella), peach fruit moth (Carposina niponensis), rice stem borer (Chilo suppressalis), rice leafroller
- 15 (Cnaphalocrocis medinalis), tobacco moth (Ephestia elutella), mulberry pyralid (Glyphodes pyloalis), yellow rice borer (Scirpophaga incertulas), rice skipper (Parnara guttata), rice armyworm (Pseudaletia separata), pink borer (Sesamia inferens), common
- 20 cutworm (Spodoptera litura), beet armyworm (Spodoptera exigua), etc.; HEMIPTERA including aster leafhopper (Macrosteles fascifrons), green rice leafhopper (Nephotettix cincticeps), brown rice planthopper (Nilaparvata lugens), whitebacked rice planthopper
- 25 (Sogatella furcifera), citrus psylla (Diaphorina citri), grape whitefly (Aleurolibus taonabae), sweetpotato whitefly (Bemisia tabaci), greenhouse whitefly (Trialeurodes vaporariorum), turnup aphid

- (Lipaphis erysimi), green peach aphid (Myzus persicae), Indian wax scale (Ceroplastes ceriferus), cottony citrus scale (Pulvinaria aurantii), camphor scale (Pseudaonidia duplex), san Jose scale (Comstockaspis perniciosa), arrowhead scale (Unapsis yanonensis), etc.; TYLENCHIDA including root-lesion nematode (Pratylenchus sp.), soybean beetle (Anomala rufocuprea), Japanese beetle (Popillia japonica), tobacco beetle (Lasioderma serricorne), powderpost beetle (Lyctus brunneus), twenty-eight-spotted ladybird (Epilachna vigintiotopunctata), azuki bean weevil (Callosobruchus chinensis), vegetable weevil (Listroderes costirostris), maize weevil (Sitophilus zeamais), boll weevil (Anthonomus grandis grandis), rice water weevil (Lissorhoptrus oryzophilus), cucurbit leaf beetle (Aulacophora femoralis), rice leaf beetle (Oulema oryzae), striped flea beetle (Phyllotreta striolata), pine shoot beetle (Tomicus piniperda), Colorado potato beetle (Leptinotarsa decemlineata), Mexican bean beetle (Epilachna varivestis), corn rootworm (Diabrotica sp.), etc.; DIPTERA including (Dacus(Zeugodacus) cucurbitae), oriental fruit fly (Dacus(Bactrocera) dorsalis), rice leafminer (Agnomyza oryzae), onion maggot (Delia antiqua), seedcorn maggot (Delia platura), soybean pod gall midge (Asphondylia sp.), muscid fly (Musca domestica), house mosquito (Culex pipiens pipiens), etc.; TYLENCHIDA including coffee root-lesion nematode (Pratylenchus coffeae),

- potato cyst nematode (Globodera rostochiensis), root-knot nematode (Meloidogyne sp.), citrus nematode (Tylenchulus semipenetrans), Aphelenchus sp. (Aphelenchus avenae), chrysanthemum foliar
- 5 (Aphelenchoides ritzemabosi), etc.; and ACARINA including citrus red mite (Panonychus citri), fruit tree red spider mite (Panonychus ulmi), carmine spider mite (Tetranychus cinnabarinus), Kanzawa spider mite (Tetranychus Kanzawai Kishida), two-spotted spider mite
- 10 (Tetranychus urticae Koch), pink tea rust mite (Acaphylla theae), pink citrus rust mite (Aculops pelekassi), purple tea mite (Calacarus carinatus), pear rust mite (Epitrimerus pyri), etc.

- The agrohorticultural insecticide, containing
- 15 an optically active phthalamide derivative represented by the formula (I) of the present invention as an active ingredient, exhibit a significant controlling effect against all species of termites harmful to houses, construction materials, furniture, leathers,
- 20 fibers, vinyl articles, wires and cables, such as, Rhinotermitidae including formosan subterranean termite (Coptotermes formosanus Shiraki) and Reticulitermes speratus (Kolbe); Reticulitermes hesperus, Reticulitermes tibialis and Reticulitermes flavipes
- 25 inhabiting North America; Reticulitermes lucifugus and Reticulitermes santonesis inhabiting the coast of Mediterranean Sea; Incisitermes minor (Hagen); termitidae including Odontotermes formosanus (Shiraki);

Kalotermitidae including Cryptotermes domesticus (Haviland); and Termopsidae including Hodotermopsis japonica (Holmgren), etc. It also exhibit a significant controlling effect against ants harmful to agricultural plants or human by coming into houses or public facilities such as parks, in a low dosage, the ants including Formicidae including Monomorium pharaoni Linnes, Monomorium nipponense Wheeler, Camponotus kiusiuensis Santschi, Formica japonica Motschulsky and Lasius fuliginosus (Latreille); fireants (Solenopsis richteri, Solenopsis invicta, Solenopsis geminata (F)) inhabiting North America.

The agrohorticultural insecticide, which contains an optically active phthalamide derivative represented by the formula (I) of the present invention as an active ingredient has a marked controlling effect on the above-exemplified insect pests, sanitary pests and/or nematodes, which are injurious to paddy field crops, upland crops, fruit trees, vegetables and other crops, flowers and ornament plants, and the like. Therefore, the desired effect of the agrohorticultural insecticide of the present invention can be exhibited by applying the insecticide to the nursery facility, paddy field, upland field, fruit trees, vegetables, other crops, seeds of flowers and ornament plants, paddy field water, stalks and leaves, or soil at a season at which the insect pests, sanitary pests or nematodes are expected to appear, before their

appearance or at the time when their appearance is confirmed. Particularly, a preferable application for using the agrohorticultural insecticide of the present invention is the application for which both of

5 "penetration and translocation" are utilized, wherein the present agrohorticultural insecticide is applied to the nursery soil of crops, ornamental plants or the like; the picking-in hole soil at a transplantation; the plant roots; the irrigation water; or the cultural
10 water of a water culture; so as to absorb the optically active phthalamide derivatives of the present invention from the roots through or not through the soil.

Moreover, in recent years, IPM (integrated pest management) technology using genetically modified
15 products (herbicide-resistant products, pest-resistant products into which an insecticidal protein-generating gene has been incorporated, disease-resistant products into which a gene generating a substance inducing resistance to disease has been incorporated, products
20 with improved taste, products with improved keeping quality, products with improved yield, etc.), insect pheromones (communication-disturbing agents used for Tortricidae or Mamestra, etc.), or natural enemy insects, has been developed. The agrohorticultural
25 insecticide of the present invention can be used in admixture with such a technique, or can be used in systematization therewith.

Plants to which the agrohorticultural

insecticide of the present invention can be applied are not particularly limited. Such plants include the following examples.

Examples of such plants may include cereals
 5 (e.g. rice, barley, wheat, rye, oat, corn, etc.), beans (soybeans, adzuki beans, horse beans, peas, red beans, peanuts, etc.), orchards/fruits (apples, citrus fruits, pomes, grapes, peaches, ume apricots, cherries, walnuts, chestnuts, almonds, bananas, strawberries,
 10 etc.), leave/fruit crops (cabbage, tomato, spinach, broccoli, lettuce, onion, green onion, bell pepper, egg plant, green pepper, etc.), root crops (carrot, potato, sweet potato, aroid, Japanese radish, lotus root, turnip, burdock, garlic, etc.), processed products
 15 (cotton, hemp, beet, hop, sugar cane, sugar beet, olive, gum, coffee, tobacco, tea, etc.), pepos (pumpkin, cucumber, Cucumis melo, watermelon, melon, etc.), pasture plants (orchard grass, sorghum, timothy, clover, alfalfa, etc.), turf grasses (lawn, bent grass,
 20 etc.), ornamental plants such as perfume (lavender, rosemary, thyme, parsley, pepper, ginger, etc.), flowering plants (chrysanthemum, rose, carnation, orchid; etc.), garden trees (ginkgo, cherry tree, Japanese laurel, etc.), and forest trees (*Abies*
 25 *sachalinensis*, *Picea jezoensis*, pine, thuja, Japanese cedar, Japanese cypress, etc.).

Moreover plants to which the agrohorticultural insecticide of the present invention can be applied

include transgenic plants or plant cultivars.

The transgenic plants or plant cultivars (i.e. those obtained by genetic engineering) include all plants which, in the genetic modification, received genetic material which imparts particularly advantageous useful traits to these plants. Examples of transgenic plants which may be mentioned are the important crop plants, such as cereals (wheat, rice), maize, soya beans, potatoes, cotton, tobacco, oilseed rape and also fruit plants (with the fruits apples, pears, citrus fruits and grapes), and particular emphasis is given to maize, soya beans, potatoes, cotton, tobacco and oilseed rape. Examples of such traits are better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, better quality and/or a higher nutritional value of the harvested products, better storage stability and/or processability of the harvested products. Further and particularly emphasized examples of such traits are a better defence of the plants against animal and microbial pests, such as against insects, mites, phytopathogenic fungi, bacteria and/or viruses, and also increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds. Traits that are particularly emphasized are the increased defence of the plants against insects, arachnids, nematodes and

worms by toxins formed in the plants, in particular those formed in the plants by the genetic material from *Bacillus thuringiensis* (for example by the genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb and CryIF and also combinations thereof) (hereinbelow referred to as "Bt plants"). Traits that are also particularly emphasized are the increased defence of plants against fungi, bacteria and viruses by systemic acquired resistance (SAR), systemin, phytoalexins, elicitors and also resistance genes and correspondingly expressed proteins and toxins. Traits that are furthermore particularly emphasized are the increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds, for example imidazolinones, sulphonylureas, glyphosate or phosphinotricin (for example the "PAT" gene). The genes in question which impart the desired traits can also be present in combination with one another in the transgenic plants. Examples of "Bt plants" which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties, soya bean varieties and potato varieties which are sold under the trade names YIELD GARD® (for example maize, cotton, soya beans), KnockOut® (for example maize), StarLink® (for example maize), Bollgard® (cotton), Nucotn® (cotton) and NewLeaf® (potato). Examples of herbicide-tolerant plants which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties and soya bean varieties which are sold under the trade names Roundup

Ready® (tolerance to glyphosate, for example maize, cotton, soya beans), Liberty Link® (tolerance to phosphinotricin, for example oilseed rape), IMI® (tolerance to imidazolinones) and STS® (tolerance to sulphonylureas, for example maize). Herbicide-resistant plants (plants bred in a conventional manner for herbicide tolerance) which may be mentioned include the varieties sold under the name Clearfield® (for example maize). Of course, these statements also apply to plant cultivars having these or still-to-be-developed genetic traits, which plants will be developed and/or marketed in the future. The above statements also apply to seeds ("seed" being used in the meaning set forth below) having these or still-to-be-developed genetic traits, which plants will be developed and/or marketed in the future.

In order to control various types of insect pests, the agrohorticultural insecticide of the present invention is applied at an amount effective for controlling insect pests or nematodes, directly, or in the form of being diluted with water or the like, or in the form of being suspended in water or the like, to plants regarding which the infestation of such insect pests or nematodes is forecasted. When the present agrohorticultural insecticide is applied to orchards, cereals, vegetables, and the like, infested with insect pests or nematodes, for example, it is applied to leaves or stems thereof, or it can also be applied by

treatments including: seed treatments such as immersion of seeds in the agent, or dust coating of seeds; and soil treatments in which the soil is treated with the agent, so as to allow plants to absorb the agent from
5 roots thereof, such as mixing of the agent into all layers of the soil, row treatment, mixing the agent into bed soil, cell nursery treatment, planting pit treatment, bedside treatment, top dressing, rice box treatment, or submerged application. In addition,
10 addition of the agent to the solution in solution (slop) culture, fumigation, or injection of the agent into tree trunks, may also be applied.

Moreover, the agrohorticultural insecticide of the present invention may be applied at an amount
15 effective for controlling insect pests or nematodes, directly, or in the form of being diluted with water or the like, or in the form of being suspended in water or the like, to plants regarding which the infestation of such insect pests or nematodes is forecasted. For
20 example, the present agrohorticultural insecticide is applied to stored grain insect pests, house insect pests, sanitary insect pests, forest insect pests, or the like. Otherwise, it may also be used by methods such as application to house construction materials,
25 fumigation, or baiting.

Examples of a seed treatment method may include: a method which comprises diluting or not diluting a liquid or solid formulation with water and

then immersing seeds in the obtained solution , so as
to allow an active ingredient to permeate into the
seeds; a method which comprises mixing a solid or
liquid formulation with seeds or dust-coating , so as
5 to allow an active ingredient to attach onto the
surface of the seeds; a method which comprises mixing
an active ingredient with an adhesive carrier such as a
resin or polymer and then coating seeds with the
resultant product; and a method of applying the agent
10 around seeds at the same time of planting.

The term "seed" that is subjected to the
above seed treatments means a plant body that is at the
initial stage of culture for the reproduction of
plants. Examples of such a seed may include a seed, a
15 bulb, a tuber, a seed tuber, a stock bud, a propagule,
a bulblet, and a plant body used for vegetative
reproduction in cutting culture.

The term "soil" or "culture carrier" for
plants in the case of applying the use method of the
20 present invention means a supporting medium for the
culture of plants, and particularly, a supporting
medium in which plant roots are allowed to extend. The
material of the soil or culture carrier is not
specifically limited, as long as plants can grow
25 thereon. Thus, such a soil or culture carrier may be
what is called soil, a raising planting mat, water, or
the like. Examples of a specific material may include
sand, pumice, vermiculite, diatomite, agar, a

gelatinous substance, a polymer, a rock wool, a glass wool, a wood chip, and a bark.

Examples of a method of applying the agent to the stems or leaves of plants, stored grain insect
5 pests, house insect pests, sanitary insect pests, forest insect pests, or the like, may include: a method which comprises diluting a liquid formulation such as an emulsion or flowable or a solid formulation such as a wettable powder or water dispersible granule with
10 water, as appropriate, and then applying the obtained solution to the target; a method of applying a dust; and fumigation.

Examples of a method of applying the agent to the soil may include: a method which comprises diluting
15 or not diluting a liquid formulation and then applying the obtained solution to the bottom portion of a plant body or a nursery bed for raising seedling; a method which comprises applying a granule to the bottom portion of a plant body or a nursery bed for raising
20 seedling; a method which comprises applying the agent that is in the form of a dust, a wettable powder, a water dispersible granule, a granule, or the like, to the soil before sowing or transplantation, so as to mix the agent into the soil as a whole; and a method which
25 comprises applying the agent that is in the form of a dust, a wettable powder, a water dispersible granule, a granule, or the like, to planting pits or rows before sowing or planting of plant bodies.

With regard to a method of applying the agent to a nursery box used for paddy rice, a formulation may be different depending on the period of application of the agent, such as application during sowing,
5 application during greening period, or application during transplantation. The agent may be applied in a formulation such as a dust, a water dispersible granule, or a granule. The agent may also be applied by mixing it with molding. Mixing of the molding with
10 a dust, a water dispersible granule, or a granule, may be applied. For example, the agent may be mixed into seedbed soil, cover soil, or the molding as a whole. The agent may simply be applied by placing the molding and various types of formulations alternately in a
15 layer form.

As a method of applying the agent to the paddy field, the agent that is in a solid formulation, such as a jumbo formulation, a pack formulation, a granule, or a water dispersible granule, or the
20 formulation that is in a liquid form, such as a flowable or an emulsion, is generally applied in the paddy field filled with water. In addition, during the rice planting period, the agent that is in an appropriate formulation may be applied to or injected
25 into the soil, directly or after being mixed with fertilizer. Moreover, the agent that is in the form of an emulsion or a flowable is applied to the source of water supply to the paddy field, such as a waterspout

or irrigation equipment, so as to apply the agent together with the supply of water in a labor-saving manner.

For field crops, the agent can be applied to
5 seeds or a culture carrier that is adjacent to plant bodies, during the sowing and raising seedling periods. In the case of plants that are directly sown to the field, direct application of the agent to seeds, and application of the agent to the bottom portions of
10 plants during culture, are preferable. In addition, a method of applying the agent that is in a granule form and a method of applying the agent that has been diluted or undiluted with water in a liquid state are also possible. A method which comprises mixing the
15 agent that is in a granule form with a culture carrier before sowing and then sowing seeds on the carrier is also preferable.

As a method of applying the agent during the sowing and raising planting periods of culture plants
20 to be transplanted, a method of directly applying the agent to seeds, a method of applying the agent that is in a liquid state to a nursery bed for raising planting, and a method of applying the agent that is in a granule form, are preferable. In addition, a method
25 of applying the agent that is in a granule form into planting pits during fix planting, and a method of mixing the agent with a culture carrier around the place to which the plants to be transplanted, are also

preferable.

The agrohorticultural insecticide of the present invention is generally prepared into suitable formulations according to a conventional manner for
5 preparation of agrochemicals.

That is, the optically active phthalamide derivative represented by the formula (I) and, optionally, an adjuvant are blended with a suitable inert carrier in a proper proportion and prepared into
10 a suitable formulation such as a flowable, emulsion, soluble concentrate, wettable powder, granules, dust, tablets, pack or the like through dissolution, dispersion, suspension, mixing, impregnation, adsorption or sticking.

15 The inert carrier usable in the present invention may be either solid or liquid. As a material usable as the solid carrier, there can be exemplified soybean flour, cereal flour, wood flour, bark flour, saw dust, powdered tobacco stalks, powdered walnut
20 shells, bran, powdered cellulose, extraction residue of vegetables, powdered synthetic polymers or resins, clays (e.g. kaolin, bentonite, and acid clay), talcs (e.g. talc and pyrophyllite), silica powders or flakes (e.g. diatomaceous earth, silica sand, mica and white
25 carbon [synthetic, high-dispersion silicic acid, also called finely divided hydrated silica or hydrated silicic acid, some of commercially available products contain calcium silicate as the major component]),

activated carbon, powdered sulfur, pumice, calcined diatomaceous earth, ground brick, fly ash, sand, calcium carbonate, calcium phosphate and other inorganic or mineral powders, plastic carriers such as
5 polyethylene, polypropylene, polyvinylidene chloride and the like, chemical fertilizers (e.g. ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, urea and ammonium chloride), and compost. These carriers may be used alone or as a mixture thereof.

10 A material usable as the liquid carrier is selected from materials that have solubility in themselves or which are without such solubility but are capable of dispersing an active ingredient with the aid of an adjuvant. The following are typical examples of
15 the liquid carrier and can be used alone or as a mixture thereof: water, alcohols (e.g. methanol, ethanol, isopropanol, butanol and ethylene glycol), ketones (e.g. acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone, diisobutyl ketone and cyclohexanone),
20 ethers (e.g. ethyl ether, dioxane, Cellosolve, dipropyl ether and tetrahydrofuran), aliphatic hydrocarbon (e.g. kerosene and mineral oils), aromatic hydrocarbons (e.g. benzene, toluene, xylene, solvent naphtha and alkyl-naphthalenes), halogenated hydrocarbons (e.g. dichloro-
25 ethane, chloroform, carbon tetrachloride and chlorobenzene), esters (e.g. ethyl acetate, diisopropyl phthalate, dibutyl phthalate and dioctyl phthalate), amides (e.g. dimethylformamide, diethylformamide and

dimethylacetamide), nitriles (e.g. acetonitrile), and dimethyl sulfoxide.

The following are typical examples of the adjuvant, which are used depending upon purposes and
5 used alone or in combination in some cases, or need not be used at all.

To emulsify, disperse, dissolve and/or wet a compound as active ingredient, a surfactant can be used. As the surfactant, there can be exemplified
10 polyoxyethylene alkyl ethers, polyoxyethylene alkylaryl ethers, polyoxyethylene higher fatty acid esters, polyoxyethylene resonates, polyoxyethylene sorbitan monolaurate, polyoxyethylene sorbitan monooleate, alkylarylsulfonates, naphthalene sulfonic acid
15 condensation products, ligninsulfonates and higher alcohol sulfate.

Further, to stabilize the dispersion of a compound as active ingredient, tackify it and/or bind it, the adjuvants exemplified below may also be used,
20 namely, there may also be used adjuvants such as casein, gelatin, starch, methyl cellulose, carboxymethyl cellulose, gum arabic, poly(vinyl alcohol)s, turpentine, bran oil, bentonite and ligninsulfonates.

To improve the flowability of a solid
25 product, the following adjuvants may also be used, namely, there may be used adjuvants such as waxes, stearates, alkyl phosphates, etc.

Adjuvants such as naphthalenesulfonic acid

condensation products and polycondensates of phosphates may be used as a peptizer for dispersible products, and adjuvants such as silicone oils may also be used as a defoaming agent.

5 Adjuvants such as 1,2-benzisothiazoline-3-one, 4-chloro-3,5-xyleneol, butyl p-hydroxybenzoate may also be added as a preservative.

 Further, if necessary, functional spreading agents, synergists such as metabolic inhibitor like
10 piperonyl butoxide, anti-freezing agents such as propylene glycol, antioxidants such as BHT, ultraviolet absorbers, and the like may also be added.

 The content of the compound as active ingredient may be varied as required, and the compound
15 as active ingredient may be used in a proportion properly chosen in the range of 0.01 to 90 parts by weight per 100 parts of the agrohorticultural insecticide. For example, in dusts, granules, emulsion or wettable powder, the suitable content of the
20 compound as active ingredient is from 0.01 to 50 % by weight.

 The agrohorticultural insecticide of the present invention is used to control a variety of insect pests in the following manner: it is applied to
25 a crop on which the insect pests are expected to appear, or a site where appearance or growth of the insect pests is undesirable, as it is or after being properly diluted with or suspended in water or the

like, in an amount effective for control of the insect pests.

The applying dosage of the agrohorticultural insecticide of the present invention is varied
5 depending upon various factors such as a purpose, insect pests to be controlled, a growth state of a plant, tendency of insect pests appearance, weather, environmental conditions, a preparation form, an application method, an application site and application
10 time. It may be properly chosen in the range of 0.001 g to 10 kg, preferably 0.01 g to 1 kg, (in terms of the compound as active ingredient) per 10 ares depending upon purposes.

The agrohorticultural insecticide of the
15 present invention may be used in admixture with other agrohorticultural insecticides, acaricides, nematocides, fungicides, biotic pesticides or the like in order to expand both spectrum of controllable insect pest species and the period of time when effective
20 application are possible or to reduce the dosage. Furthermore, the agrohorticultural insecticide of the present invention may be used in admixture with herbicides, plant growth regulators, fertilizers or the like, depending upon application situations.

25 As the other agrohorticultural insecticides, acaricides and nematocides, which are used for the above purpose, there can be exemplified agrohorticultural insecticides, acaricides and

- nematocides, such as Ethion, Trichlorfon, Metamidophos, Acephate, Dichlorvos, Mevinphos, Monocrotophos, Malathion, Dimethoate, Formothion, Mecarbam, Vamidothion, Thiometon, Disulfoton, Oxydeprofos, Naled,
- 5 Methylparathion, Fenitrothion, Cyanophos, Propaphos, Fenthion, Prothiofos, Profenofos, Isofenphos, Temephos, Phenthoate, Dimethylvinphos, Chlorfenvinphos, Tetrachlorvinphos, Phoxim, Isoxathion, Pyraclofos, Methidathion, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos-methyl,
- 10 Pyridaphenthion, Diazinon, Pirimiphosmethyl, Phosalone, Phosmet, Dioxabenzophos, Quinalphos, Terbuphos, Ethoprophos, Cadusafos, Mesulfenfos, DPS (NK-0795), Phosphocarb, Fenamiphos, Isoamidophos, Fosthiazate, Isazophos, Ethoprophos, Fenthion, Fostietane,
- 15 Dichlofenthion, Thionazin, Sulprofos, Fensulfothion, Diamidafos, Pyrethrin, Allethrin, Prallethrin, Resmethrin, Permethrin, Tefluthrin, Bifenthrin, Fenpropathrin, Cypermethrin, α -Cypermethrin, Cyhalothrin, λ -Cyhalothrin, Deltamethrin, Acrinathrin,
- 20 Fenvalerate, Esfenvalerate, Cycloprothrin, Ethofenprox, Halfenprox, Silafluofen, Flucythrinate, Fluvalinate, Methomyl, Oxamyl, Thiodicarb, Aldicarb, Alanycarb, Cartap, Metolcarb, Xyllylcarb, Propoxur, Phenoxycarb, Fenobucarb, Ethiofencarb, Fenothiocarb, Bifenazate,
- 25 Carbaryl, Pirimicarb, Carbofuran, Carbosulfan, Furathiocarb, Benfuracarb, Aldoxycarb, Diafenthion, Diflubenzuron, Teflubenzuron, Hexaflumuron, Novaluron, Lufenuron, Flufenoxuron, Chlorfluazuron, Fenbutatin

- oxide, tricyclohexyltin hydroxide, sodium oleate, potassium oleate, Methoprene, Hydroprene, Binapacryl, Amitraz, Dicofol, Kersen, Chlorobenzilate, Bromopropylate, Tetradifon, Bensultap, Benzoximate,
- 5 Tebufenozide, Methoxyfenozide, pyridalyl, Chromafenozide, Propargite, Acequinosyl, Endosulfan, Diofenolan, Chlorfenapyl, Fenpyroximate, Tolfenpyrad, Fipronil, Tebufenpyrad, Triazamate, Etoxazole, Hexythiazox, nicotine sulfate, Nitenpyram, Acetamiprid,
- 10 Thiacloprid, Imidacloprid, Thiamethoxam, Clothianidin, Dinotefuran, Fluazinam, Pyriproxyfen, Hydramethylnon, Pyrimidifen, Pyridaben, Cyromazin, TPIC (tripropyl isocyanurate), Pymetrozin, Clofentezin, Buprofezin, Thiocyclam, Fenazaquin, Chinomethionate, Indoxacarb,
- 15 Polynactin complexes, Milbemectin, Abamectin, Enamectin-benzoate, Spinosad, BT (*Bacillus thuringiensis*), Azadirachtin, Rotenone, hydroxypropyl starch, Levamisole hydrochloride, Metam-sodium, Morantel tartrate, Dazomet, Trichlamide, Pasteuria
- 20 penetrans, Monacrosporium-phymatophagum, etc.

As the agrohorticultural fungicides used for the same purpose as above, there can be exemplified agrohorticultural fungicides such as sulfur, lime sulfur, copper sulfate basic, Iprobenfos, Edifenfos,

25 Tolclofos-methyl, Thiram, Polycarbamate, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Thiophanate, Thiophanate methyl, Benomyl, Iminoctadin acetate, Iminocutadin albecylate, Mepronil, Flutolanil, Pencycuron, Furametpyl,

- Thiifluzamide, Metalaxyl, Oxadixyl, Carpropamid,
 Dichlofluanid, Flusulfamide, Chlorothalonil, Kresoxim-
 methyl, Fenoxanil, Himexazol, Etridiazol, Fluoroimide,
 Procymidone, Vinclozolin, Iprodione, Triadimefon,
 5 Triflumizole, Bitertanol, Ipconazole, Fluconazole,
 Propiconazole, Diphenconazole, Myclobutanil,
 Tetraconazole, Hexaconazole, Tebuconazole,
 Imibenconazole, Prochloraz, Pefurazoate, Cyproconazole,
 Isoprothiolane, Fenarimol, Pyrimetanil, Mepanipyrin,
 10 Pyrifenox, Fluazinam, Triforine, Diclomezine,
 Azoxystrobin, Trifloxystrobin, Orysastrobin,
 Thiadiazin, Captan, Tiadinil, Probenazole, Acibenzolar-
 S-methyl (CGA-245704), Fthalide, Tricyclazole,
 Pyroquilon, Chinomethionat, Oxolinic acid, Dithianon,
 15 Cyazofamid, Diclocymet, Kasugamycin, Validamycin,
 Polyoxin, Blastocidin, Streptomycin, etc.

- Similarly, as the herbicides, there can be
 exemplified herbicides such as Glyphosate, Sulfosate,
 Glyfosinate, Bialaphos, Butamifos, Esprocarb,
 20 Prosulcarb, Benthocarb, Pyributycarb, Asulam, Linulon,
 Dymron, Isouron, Bensulfuron methyl, Cyclosulfamuron,
 Cinosulfuron, Pyrazosulfuron ethyl, Azimsulfuron,
 Imazosulfuron, Tenylchlor, Alachlor, Pretilachlor,
 Clomeprop, Etobenzanid, Mefenacet, Flufenacet,
 25 Fentrazamide, Pendimethalin, Bifenox, Acifluorfen,
 Lactfen, Cyhalofop-butyl, Ioxynil, Bromobutide,
 Alloxymid, Setoxydim, Napropamide, Indanofan,
 Pyrazolate, Benzofenap, Pyraflufen-ethyl, Imazapyl,

Sulfentrazone, Cafenstrole, Bentoxazon, Oxadiazon,
 Paraquat, Diquat, Pyriminobac, Simazine, Atrazine,
 Dimethametryn, Triazyflam, Benfuresate, Fluthiacet-
 methyl, Quizalofop-ethyl, Bentazone, Oxaziclomefone,
 5 Azafenidin, Benzobicyclon, calcium peroxide, etc.

As to the biotic pesticides, the same effect
 as above can be expected by using the agrohorticultural
 insecticide of the present invention in admixture with,
 for example, viral formulations obtained from nuclear
 10 polyhedrosis virus (NPV), granulosis virus (GV),
 cytoplasmic polyhedrosis virus (CPV), entomopox virus
 (EPV), etc.; microbial pesticides utilized as
 insecticides or nematocides, such as *Monacrosporium*
phymatophagum, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema*
 15 *kushidai*, *Pasteuria penetrans*, etc.; microbial
 pesticides utilized as fungicides, such as *Trichoderma*
lignorum, *Agrobacterium radiobactor*, nonpathogenic
Erwinia carotovora, *Bacillus subtilis*, etc.; and biotic
 pesticides utilized as herbicides, such as *Xanthomonas*
 20 *campestris*, etc.

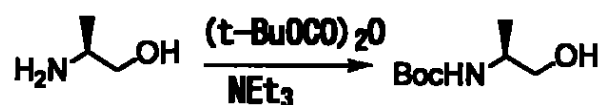
In addition, the agrohorticultural
 insecticide of the present invention can be used in
 combination with biotic pesticides including natural
 enemies such as Parasitic wasp (*Encarsia formosa*),
 25 Parasitic wasp (*Aphidius colemani*), Gall-mildge
 (*Aphidoletes aphidimyza*), Parasitic wasp (*Diglyphus*
isaea), Parasitic mite (*Dacnusa sibirica*), Predatory
 mite (*Phytoseiulus persimilis*), Predatory mite

(*Amblyseius cucumeris*), Predatory bug (*Orius sauteri*),
 etc.; microbial pesticides such as *Beauveria*
brongniartii, etc.; and pheromones such as (Z)-10-
 tetradecenyl acetate, (E,Z)-4,10-tetradecadienyl
 5 acetate, (Z)-8-dodecenyl acetate, (Z)-11-tetradecenyl
 acetate, (Z)-13-icosen-10-one, (Z)-13-icosen-10-one,
 14-methyl-1-octadecene, etc.

Examples

The present invention will be further
 10 described in the following representative examples.
 However, these examples are not intended to limit the
 scope of the present invention.

Example 1: Production of (S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-
 trifluoromethoxyphenyl)-N²-(1-methyl-2-
 15 methylthioethyl)phthalamide (Compound No. I-42)
 (1-1) Production of t-butyl (S)-(2-hydroxy-1-
 methylethyl)carbamate



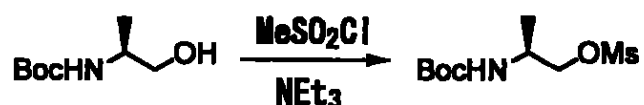
13.8 g of triethylamine was added to 100 ml
 of a tetrahydrofuran solution containing 10.0 g (133
 20 mmol) of L-alaninol. Thereafter, 30.0 g (137 mmol) of
 di-t-butyl dicarbonate was added dropwise to the
 obtained mixture while cooling in ice water. The
 temperature of the reaction solution was returned to
 room temperature, and it was then stirred for 12 hours.
 25 Thereafter, the reaction solution was poured into ice

water, followed by extraction with ethyl acetate. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate and then concentrated under reduced pressure, so as to obtain 24.0 g of t-butyl (S)-(2-hydroxy-1-methylethyl)carbamate.

Yield: Quantitative

Physical properties: [^1H NMR, CDCl_3 , δ (ppm)]
 4.62(br, 1H), 3.77(br, 1H), 3.64(br, 1H), 3.49(br, 1H),
 2.54(br, 1H), 1.44(s, 9H), 1.14(d, 3H).

(1-2) Production of (S)-2-(t-butoxycarbonylamino)propyl methanesulfonate



14.5 g (144 mmol) of triethylamine was added to 180 ml of a tetrahydrofuran solution containing 24.0 g (137 mmol) of t-butyl (S)-(2-hydroxy-1-methylethyl)carbamate. Thereafter, 16.4 g (143 mmol) of methanesulfonyl chloride was added dropwise to the obtained mixture while cooling in ice water. The temperature of the reaction solution was returned to room temperature, and it was then stirred for 5 hours. Thereafter, the reaction solution was poured into water, followed by extraction with ethyl acetate. The organic layer was washed with a saturated sodium chloride aqueous solution and then dried over anhydrous magnesium sulfate. The resultant product was then concentrated under reduced pressure, so as to obtain

47

34.0 g of (S)-2-(t-butoxycarbonylamino)propyl methanesulfonate.

Yield: 98.1%

Physical properties: [^1H NMR, CDCl_3 , δ (ppm)]

5 4.61(br, 1H), 4.22(dd, 1H), 4.14(dd, 1H), 3.96(br, 1H), 3.03(s, 3H), 1.44(s, 9H), 1.23(d, 3H).

(1-3) Production of t-butyl (S)-(1-methyl-2-methylthioethyl)carbamate



34.0 g (134 mmol) of (S)-2-(t-

10. butoxycarbonylamino)propyl methanesulfonate was added to 100 ml of an ethanol solution containing 73.0 g (156 mmol) of a sodium methyl mercaptan aqueous solution (15%). Thereafter, the obtained mixture was heated to reflux for 5 hours. The temperature of the reaction
15 solution was returned to room temperature, and it was then concentrated under reduced pressure to eliminate ethanol. Thereafter, water was added to the residue, followed by extraction with ethyl acetate. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate and
20 then concentrated under reduced pressure, so as to obtain 21.0 g of t-butyl (S)-(1-methyl-2-methylthioethyl)carbamate.

Yield: 76.4%

Physical properties: [^1H NMR, CDCl_3 , δ (ppm)]

25 4.59(br, 1H), 3.84(br, 1H), 2.65(dd, 1H), 2.54(dd, 1H),

48

2.14 (s, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.21 (d, 3H).

(1-4) Production of (S)-1-methyl-2-methylthioethylamine



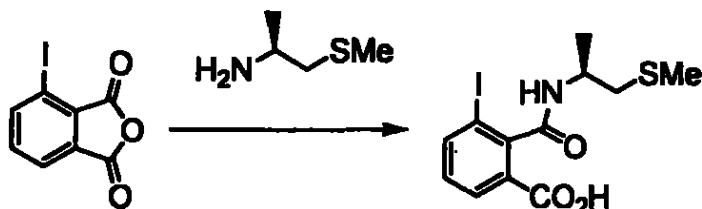
32.0 g of concentrated hydrochloric acid
 5 (35%) was added dropwise to 150 ml of an ethyl acetate
 solution containing 21.0 g (102 mmol) of t-butyl (S)-
 (1-methyl-2-methylthioethyl)carbamate. The obtained
 mixture was stirred at room temperature for 3 hours.
 Thereafter, water was added to the reaction solution,
 10 followed by washing with ethyl acetate. The water
 layer was converted to be basic with addition of sodium
 hydroxide, and it was then extracted with t-butyl
 methyl ether. The organic layer was dried over
 anhydrous magnesium sulfate and then concentrated under
 15 reduced pressure, so as to obtain 5.5 g of (S)-1-
 methyl-2-methylthioethylamine.

Yield: 51.4%

Physical properties: [¹HNMR, CDCl₃, δ (ppm)]
 4.90 (br, 2H), 3.07 (m, 1H), 2.58 (dd, 1H), 2.36 (dd, 1H),
 20 2.10 (s, 3H), 1.15 (d, 3H).

(1-5) Production of (S)-3-iodo-N-(1-methyl-2-methylthioethyl)phthalamic acid

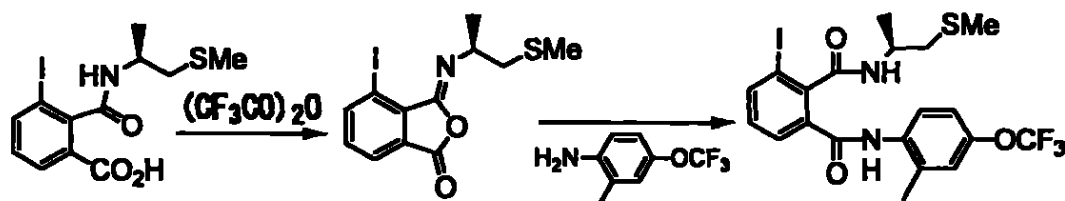
49



50 ml of an acetonitrile solution containing 5.5 g (52.4 mmol) of (S)-1-methyl-2-methylthioethylamine was added dropwise to 150 ml of an acetonitrile solution containing 14.4 g (52.6 mmol) of 3-iodophthalic anhydride at a slow rate. The obtained mixture was stirred at room temperature for 12 hours. Thereafter, precipitated crystals were filtrated and then washed with acetonitrile, so as to obtain 7.0 g of (S)-3-iodo-N-(1-methyl-2-methylthioethyl)phthalamic acid.

Yield: 35.2%

Physical properties: [^1H NMR, CDCl_3 , δ (ppm)] 8.01(dd, 2H), 7.15(t, 1H), 6.00(d, 1H), 4.43(m, 1H), 2.88(dd, 1H), 2.68(dd, 1H), 2.17(s, 3H), 1.37(d, 3H).
 (1-6) Production of (S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-trifluoromethoxyphenyl)-N²-(1-methyl-2-methylthioethyl)phthalamide (Compound No. I-42)



0.67 g (3.2 mmol) of a trifluoroacetic anhydride was added to 8 ml of a t-butyl methyl ether

suspension containing 0.8 g (2.1 mmol) of (S)-3-iodo-N-(1-methyl-2-methylthioethyl)phthalamic acid. The obtained mixture was stirred at room temperature for 2 hours. Thereafter, the reaction solution was slowly
5 poured into ice water in which 0.88 g (6.4 mmol) of potassium carbonate had been dissolved, followed by extraction with ethyl acetate. The organic layer was washed with a saturated sodium chloride aqueous solution and then dried over anhydrous magnesium
10 sulfate. The resultant product was then concentrated under reduced pressure, so as to obtain crude isoimide. The obtained product was then dissolved in 10 ml of acetonitrile. Thereafter, 0.40 g (2.2 mmol) of 2-methyl-4-trifluoromethoxyaniline and 2 drops of
15 trifluoroacetic acid were added to the reaction solution, and the obtained mixture was then stirred at room temperature for 12 hours. Precipitated crystals were filtrated and then washed with acetonitrile, so as to obtain 1.0 g of (S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-
20 trifluoromethoxyphenyl)-N²-(1-methyl-2-methylthioethyl)phthalamide.

Yield: 88.2%

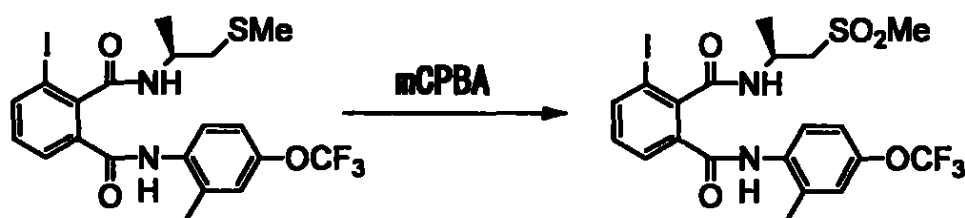
Physical properties: [¹HNMR, CDCl₃, δ (ppm)]
8.32(br, 1H), 8.13(d, 1H), 7.97(d, 1H), 7.79(d, 1H),
25 7.22(t, 1H), 7.08(d, 1H), 7.06(s, 1H), 6.20(d, 1H),
4.33(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.33(s, 3H), 1.96(s, 3H),
1.27(d, 3H).

Specific rotation: $[\alpha]_D^{20} = +2.61^\circ$ (c = 1.04,

51

CHCl₃)

Example 2: Production of (S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-trifluoromethoxyphenyl)-N²-(1-methyl-2-methylsulfonylethyl)phthalamide (Compound No. I-44)



5 While cooling in ice water, 0.40 g (2.3 mmol)
 of m-chloroperbenzoic acid was added to 10 ml of a
 chloroform solution containing 0.38 g (0.70 mmol) of
 (S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-trifluoromethoxyphenyl)-N²-(1-
 methyl-2-methylthioethyl)phthalamide. The obtained
 10 mixture was stirred at room temperature for 3 hours.
 Thereafter, a potassium carbonate aqueous solution was
 added to the reaction solution, followed by extraction
 with chloroform. The organic layer was washed with a
 sodium sulfite aqueous solution and then dried over
 15 anhydrous magnesium sulfate. The resultant product was
 then concentrated under reduced pressure. The residue
 was purified by silica gel column chromatography, so as
 to obtain 0.26 g of (S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-
 trifluoromethoxyphenyl)-N²-(1-methyl-2-
 20 methylsulfonylethyl)phthalamide.

Yield: 64.9%

Physical properties: [¹HNMR, CDCl₃, δ (ppm)]
 8.07(br, 1H), 7.97(m, 2H), 7.70(d, 1H), 7.21(t, 1H),

52

7.70(m, 2H), 6.64(d, 1H), 4.61(m, 1H), 3.37(dd, 1H),
3.17(dd, 1H), 2.78(s, 3H), 2.32(s, 3H), 1.51(d, 3H).

Specific rotation: $[\alpha]_D^{20} = +3.80^\circ$ (c = 1.03,
CHCl₃)

- 5 Representative compounds as optically active
phthalamide compounds represented by the formula (I) of
the present invention, which can be produced in the
same manner as in examples, are shown in Tables 1 to 3.
However, the present invention is not limited to these
10 compounds. In the tables, the term "physical
properties" means a melting point or logP. The symbol
"Me" represents a methyl group, "Et" represents an
ethyl group, "Pr" represents a propyl group, "-n"
represents normal, and "-i" represents iso.
- 15 In Table 4, NMR data and specific rotation
are shown regarding some compounds, the physical
properties of which are not described in Tables 1 to 3.

Formula (I-3)

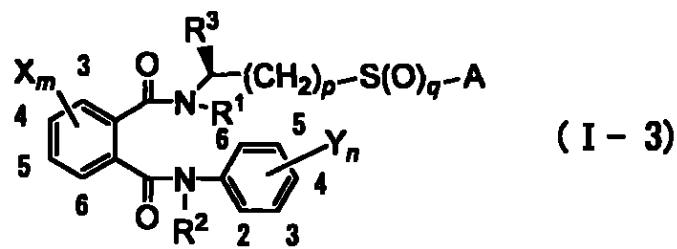


Table 1 ($R^1=R^2=H$, $R^3=Me$, $p=1$)

No.	X_m	A	q	Y_n	Physical properties Melting point (°C)
1-1	3-I	Me	0	4-CF(CF ₃) ₂	
1-2	3-I	Me	1	4-CF(CF ₃) ₂	
1-3	3-I	Me	2	4-CF(CF ₃) ₂	138
1-4	3-I	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	110-129
1-5	3-I	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-6	3-I	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-7	3-I	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	103-108
1-8	3-I	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-9	3-I	Pr-n	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-10	3-I	Pr-n	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	112-115
1-11	3-I	Pr-n	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-12	3-I	Pr-i	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-13	3-I	Pr-i	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	109-131
1-14	3-I	Pr-i	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-15	3-I	Me	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-16	3-I	Me	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-17	3-I	Me	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-18	3-I	Me	0	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-19	3-I	Me	1	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-20	3-I	Me	2	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
1-21	3-I	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-22	3-I	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	87-92
1-23	3-I	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-24	3-I	Et	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-25	3-I	Et	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	85-88

Table 1 (continued)

No.	Xm	A	q	Yn	Physical properties Melting point (°C)
1-26	3-I	Et	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	Amorphous
1-27	3-I	Pr-i	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-28	3-I	Pr-i	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-29	3-I	Pr-i	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-30	3-I	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	90-95
1-31	3-I	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-32	3-I	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-33	3-I	Me	0	2-Me-4-CF ₃	203-215
1-34	3-I	Me	1	2-Me-4-CF ₃	
1-35	3-I	Me	2	2-Me-4-CF ₃	
1-36	3-I	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	198-202
1-37	3-I	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	
1-38	3-I	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	
1-39	3-I	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	
1-40	3-I	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	197-206
1-41	3-I	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	
1-42	3-I	Me	0	2-Me-4-OCF ₃	
1-43	3-I	Me	1	2-Me-4-OCF ₃	179-180
1-44	3-I	Me	2	2-Me-4-OCF ₃	
1-45	3-I	Et	0	2-Me-4-OCF ₃	
1-46	3-I	Et	1	2-Me-4-OCF ₃	
1-47	3-I	Et	2	2-Me-4-OCF ₃	
1-48	3-I	Me	0	2-Cl-4-OCF ₃	
1-49	3-I	Me	1	2-Cl-4-OCF ₃	
1-50	3-I	Me	2	2-Cl-4-OCF ₃	
1-51	3-I	Et	0	2-Cl-4-OCF ₃	
1-52	3-I	Et	1	2-Cl-4-OCF ₃	
1-53	3-I	Et	2	2-Cl-4-OCF ₃	
1-54	3-I	Me	0	2-Br-4-OCF ₃	
1-55	3-I	Me	1	2-Br-4-OCF ₃	
1-56	3-I	Me	2	2-Br-4-OCF ₃	
1-57	3-I	Et	0	2-Br-4-OCF ₃	
1-58	3-I	Et	1	2-Br-4-OCF ₃	
1-59	3-I	Et	2	2-Br-4-OCF ₃	
1-60	3-I	Me	0	2-Cl-3,4-(-CF ₂ OCF ₂ O-)	
1-61	3-I	Me	1	2-Cl-3,4-(-CF ₂ OCF ₂ O-)	
1-62	3-I	Me	2	2-Cl-3,4-(-CF ₂ OCF ₂ O-)	

Table 1 (continued)

No.	Xm	A	q	Yn	Physical properties Melting point (°C)
1-63	3-I	Me	0	2,4-Cl ₂	
1-64	3-I	Me	1	2,4-Cl ₂	151-159
1-65	3-I	Me	2	2,4-Cl ₂	
1-66	3-I	Me	0	2,3,4-Cl ₃	203-205
1-67	3-I	Me	1	2,3,4-Cl ₃	
1-68	3-I	Me	2	2,3,4-Cl ₃	212-213
1-69	3-I	Me	0	2-Cl-4-CF ₃	
1-70	3-I	Me	1	2-Cl-4-CF ₃	
1-71	3-I	Me	2	2-Cl-4-CF ₃	
1-72	3-Br	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-73	3-Br	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	123-132
1-74	3-Br	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-75	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-76	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	74-96
1-77	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-78	3-F	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-79	3-F	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	160
1-80	3-F	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-81	3-F	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-82	3-F	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	93-103
1-83	3-F	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-84	3-NO ₂	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-85	3-NO ₂	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	191-194
1-86	3-NO ₂	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-87	H	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-88	H	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	93-104
1-89	H	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-90	3-OCF ₃	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-91	3-OCF ₃	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-92	3-OCF ₃	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-93	3,4-Cl ₂	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-94	3,4-Cl ₂	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-95	3,4-Cl ₂	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-96	3-I	Et	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-97	3-I	Et	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-98	3-I	Et	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-99	3-I	Me	0	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	

Table 1 (continued)

No.	X _m	A	q	Y _n	Physical properties logP (pH2.3)
1-100	3-I	Me	1	2-Et-4-CH (CF ₃) ₂	
1-101	3-I	Me	2	2-Et-4-CH (CF ₃) ₂	
1-102	3-I	Et	0	2-Et-4-CH (CF ₃) ₂	
1-103	3-I	Et	1	2-Et-4-CH (CF ₃) ₂	
1-104	3-I	Et	2	2-Et-4-CH (CF ₃) ₂	
1-105	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-CF (CF ₃) ₂	4.71
1-106	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-CF (CF ₃) ₂	2.97
1-107	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-CF (CF ₃) ₂	3.47
1-108	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.36
1-109	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	
1-110	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.15
1-111	3-I	Et	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.53
1-112	3-I	Et	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
1-113	3-I	Et	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.28
1-114	3-I	Et	0	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	4.28
1-115	3-I	Et	1	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	
1-116	3-I	Et	2	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	3.09
1-117	3-I	Et	0	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	4.26
1-118	3-I	Et	1	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	
1-119	3-I	Et	2	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	3.07
1-120	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-Br	3.65
1-121	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-Br	
1-122	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-Br	2.49
1-123	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-OCF ₃	3.90
1-124	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-OCF ₃	
1-125	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-OCF ₃	2.77
1-126	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₃	3.90
1-127	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₃	
1-128	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₃	2.74
1-129	3-I	Et	0	2-Me-3,4-Br ₂	3.89
1-130	3-I	Et	1	2-Me-3,4-Br ₂	
1-131	3-I	Et	2	2-Me-3,4-Br ₂	2.67
1-132	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-I	3.77
1-133	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-I	
1-134	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-I	2.59
1-135	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.03
1-136	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.50

Table 1 (continued)

No.	Xm	A	q	Yn	Physical properties logP (pH2.3)
1-137	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.97
1-138	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-OCF ₃	3.59
1-139	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-OCF ₃	
1-140	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-OCF ₃	2.60
1-141	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.41
1-142	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.78
1-143	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.27
1-144	3-I	Me	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.20
1-145	3-I	Me	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
1-146	3-I	Me	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.10
1-147	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-Br	3.30
1-148	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-Br	
1-149	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-Br	2.29
1-150	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-I	3.42
1-151	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-I	
1-152	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-I	2.40
1-153	3-I	Me	0	2-Me-3,4-Br ₂	3.55
1-154	3-I	Me	1	2-Me-3,4-Br ₂	
1-155	3-I	Me	2	2-Me-3,4-Br ₂	2.49
1-156	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₃	3.58
1-157	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₃	
1-158	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₃	
1-159	3-I	Et	0	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	4.41
1-160	3-I	Et	1	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	
1-161	3-I	Et	2	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	3.18
1-162	3-I	Et	0	2-Cl-3-Br-4-OCF ₃	4.42
1-163	3-I	Et	1	2-Cl-3-Br-4-OCF ₃	
1-164	3-I	Et	2	2-Cl-3-Br-4-OCF ₃	3.19
1-165	3-Br	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.93
1-166	3-Br	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.42
1-167	3-Br	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.86
1-168	3-Br	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.31
1-169	3-Br	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.72
1-170	3-Br	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.21
1-171	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.26
1-172	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.59
1-173	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.06

Table 1 (continued)

No.	Xm	A	q	Yn	Physical properties logP (pH2.3)
1-174	3-Br	Et	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.43
1-175	3-Br	Et	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
1-176	3-Br	Et	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.19
1-177	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-Br	3.54
1-178	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-Br	
1-179	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-Br	2.39
1-180	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₃	3.80
1-181	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₃	
1-182	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₃	2.66
1-183	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-I	3.66
1-184	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-I	
1-185	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-I	2.51
1-186	3-Br	Et	0	2-Me-3,4-Br ₂	3.78
1-187	3-Br	Et	1	2-Me-3,4-Br ₂	
1-188	3-Br	Et	2	2-Me-3,4-Br ₂	2.59
1-189	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-OCF ₃	3.81
1-190	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-OCF ₃	
1-191	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-OCF ₃	2.69
1-192	3-Br	Et	0	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	4.16
1-193	3-Br	Et	1	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	
1-194	3-Br	Et	2	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	2.96
1-195	3-Br	Et	0	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	4.18
1-196	3-Br	Et	1	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	
1-197	3-Br	Et	2	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	2.99
1-198	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.63
1-199	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.90
1-200	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.39
1-201	3-Cl	Et	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.54
1-202	3-Cl	Et	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.86
1-203	3-Cl	Et	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.34
1-204	3-Cl	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.23
1-205	3-Cl	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.69
1-206	3-Cl	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-207	3-Cl	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.21
1-208	3-Cl	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.56
1-209	3-Cl	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.01
1-210	3-Cl	Et	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.37

Table 1 (continued)

No.	X _m	A	q	Y _n	Physical properties Melting point (°C) logP (pH2.3)
1-211	3-Cl	Et	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
1-212	3-Cl	Et	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.14
1-213	3-Cl	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.88
1-214	3-Cl	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	
1-215	3-Cl	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.82
1-216	3-Cl	Me	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	4.36
1-217	3-Cl	Me	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-218	3-Cl	Me	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	3.26
1-219	3-Br	Me	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	4.42
1-220	3-Br	Me	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
1-221	3-Br	Me	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	3.31
1-222	3-I	Me	0	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
1-223	3-I	Me	1	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
1-224	3-I	Me	2	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
1-225	3-I	Me	0	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂	
1-226	3-I	Me	1	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂	
1-227	3-I	Me	2	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂	
1-228	3-I	Me	0	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	
1-229	3-I	Me	1	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	
1-230	3-I	Me	2	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	196-198
1-231	3-I	Me	0	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-232	3-I	Me	1	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-233	3-I	Me	2	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-234	3-CH=CH- CH=CH-4	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-235	3-CH=CH- CH=CH-4	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-236	3-CH=CH- CH=CH-4	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-237	3-I	Me	0	2-I-4-CF(CF ₃) ₂	
1-238	3-I	Me	1	2-I-4-CF(CF ₃) ₂	
1-239	3-I	Me	2	2-I-4-CF(CF ₃) ₂	
1-240	3-Br	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-241	3-Br	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	133-144
1-242	3-Br	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-243	3-Br	Et	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-244	3-Br	Et	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	205-209

Table 1 (continued)

No.	X _m	A	q	Y _n	Physical properties Melting point (°C)
1-245	3-Br	Et	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	110-122
1-246	3-Br	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-247	3-Br	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-248	3-Br	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-249	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	113-126
1-250	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-251	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-252	3-Cl	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-253	3-Cl	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	136-143
1-254	3-Cl	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-255	3-Cl	Et	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-256	3-Cl	Et	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
1-257	3-Cl	Et	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	121-129
1-258	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-259	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-260	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-261	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-262	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-263	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-264	3-Cl	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-265	3-Cl	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-266	3-Cl	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
1-267	3-Cl	Me	0	2-Me-4-OCF ₃	
1-268	3-Cl	Me	1	2-Me-4-OCF ₃	
1-269	3-Cl	Me	2	2-Me-4-OCF ₃	
1-270	3-Cl	Me	0	2-Cl-4-OCF ₃	
1-271	3-Cl	Me	1	2-Cl-4-OCF ₃	
1-272	3-Cl	Me	2	2-Cl-4-OCF ₃	
1-273	3-Cl	Me	0	2-Br-4-OCF ₃	
1-274	3-Cl	Me	1	2-Br-4-OCF ₃	
1-275	3-Cl	Me	2	2-Br-4-OCF ₃	
1-276	3-I	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-277	3-I	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-278	3-I	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-279	3-I	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-280	3-I	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
1-281	3-I	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	

Table 1 (continued)

No.	X _m	A	q	Y _n	Physical properties Melting point (°C)
1-282	3-I	Me	0	2-Me-4-O-(2-(3-Cl- 5-CF ₃)pyridyl)	201-202
1-283	3-I	Me	1	2-Me-4-O-(2-(3-Cl- 5-CF ₃)pyridyl)	
1-284	3-I	Me	2	2-Me-4-O-(2-(3-Cl- 5-CF ₃)pyridyl)	
1-285	3-Cl	Me	0	2-Me-4-O-(2-(3-Cl- 5-CF ₃)pyridyl)	
1-286	3-Cl	Me	1	2-Me-4-O-(2-(3-Cl- 5-CF ₃)pyridyl)	140-143
1-287	3-Cl	Me	2	2-Me-4-O-(2-(3-Cl- 5-CF ₃)pyridyl)	
1-288	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-289	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-290	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	197
1-291	3-Br	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	160-173
1-292	3-Br	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-293	3-Br	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-294	3-F	Me	0	2-Me-4-OCHF ₂	
1-295	3-F	Me	1	2-Me-4-OCHF ₂	165-167
1-296	3-F	Me	2	2-Me-4-OCHF ₂	174-175
1-297	3-F	Me	0	2-Me-4-OCF ₃	177-179
1-298	3-F	Me	1	2-Me-4-OCF ₃	201-210
1-299	3-F	Me	2	2-Me-4-OCF ₃	204-208
1-300	3-F	Me	0	2-Me-4-F	188-190
1-301	3-F	Me	1	2-Me-4-F	212-218
1-302	3-F	Me	2	2-Me-4-F	201-206
1-303	3-F	Me	0	2-F-3-CF ₃	112-114
1-304	3-F	Me	1	2-F-3-CF ₃	165-172
1-305	3-F	Me	2	2-F-3-CF ₃	166-177
1-306	3-F	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	148-158
1-307	3-F	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	75-82
1-308	3-F	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	121-125
1-309	3-F	Me	0	2,4-Cl ₂	70-77
1-310	3-F	Me	1	2,4-Cl ₂	164

Table 1 (continued)

No.	Xm	A	q	Yn	Physical properties Melting point (°C)
1-311	3-F	Me	2	2,4-Cl ₂	195-199
1-312	3-F	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	143-160
1-313	3-F	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	197
1-314	3-F	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	173-176
1-315	3-F	Me	0	2-Cl-4-OCF ₃	140
1-316	3-F	Me	1	2-Cl-4-OCF ₃	161-162
1-317	3-F	Me	2	2-Cl-4-OCF ₃	164-165
1-318	3-F	Me	0	2-Me-4-Cl	183-185
1-319	3-F	Me	1	2-Me-4-Cl	192-196
1-320	3-F	Me	2	2-Me-4-Cl	210-211
1-321	3-F	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	141-142
1-322	3-F	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	166-168
1-323	3-F	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	203-206
1-324	3-F	Me	0	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	182-184
1-325	3-F	Me	1	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	191-208
1-326	3-F	Me	2	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	200-209
1-327	3-CF ₃	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	211
1-328	3-CF ₃	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	208-209
1-329	3-CF ₃	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	238-243
1-330	3-Cl	Me	0	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	95-98
1-331	3-Cl	Me	1	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	128-132
1-332	3-Cl	Me	2	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	95-97
1-333	3-I	Me	0	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	156-158
1-334	3-I	Me	1	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	117-121
1-335	3-I	Me	2	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	158-160
1-336	3-Cl	Me	0	2-Me-4-S-(2-(5-CF ₃)pyridyl)	130-132
1-337	3-Cl	Me	1	2-Me-4-S-(2-(5-CF ₃)pyridyl)	
1-338	3-Cl	Me	2	2-Me-4-S-(2-(5-CF ₃)pyridyl)	

Formula (I-3)

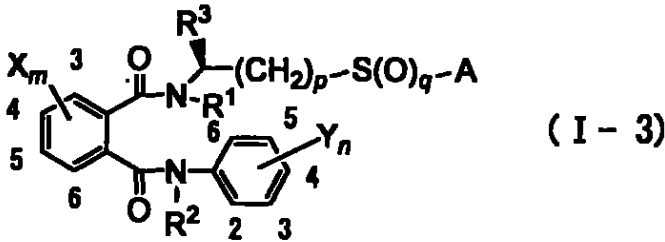


Table 2 (R¹=R²=H, p=1)

No.	X _m	A	R ³	q	Y _n	Physical properties logP (pH2.3)
1-339	3-Cl	Me	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	4.47
1-340	3-Cl	Me	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	2.78
1-341	3-Cl	Me	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.31
1-342	3-Br	Me	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	4.54
1-343	3-Br	Me	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	2.83
1-344	3-Br	Me	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.37
1-345	3-I	Me	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	4.62
1-346	3-I	Me	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	2.90
1-347	3-I	Me	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.45
1-348	3-Cl	Me	i-Pr	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	4.77
1-349	3-Cl	Me	i-Pr	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.03
1-350	3-Cl	Me	i-Pr	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.54
1-351	3-Br	Me	i-Pr	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	4.80
1-352	3-Br	Me	i-Pr	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.06
1-353	3-Br	Me	i-Pr	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.62
1-354	3-I	Me	i-Pr	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	4.97
1-355	3-I	Me	i-Pr	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.13
1-356	3-I	Me	i-Pr	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.70
1-357	3-Cl	Me	i-Bu	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	5.11
1-358	3-Cl	Me	i-Bu	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.27
1-359	3-Cl	Me	i-Bu	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.77
1-360	3-Br	Me	i-Bu	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	5.16
1-361	3-Br	Me	i-Bu	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.30
1-362	3-Br	Me	i-Bu	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.82
1-363	3-I	Me	i-Bu	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	5.24
1-364	3-I	Me	i-Bu	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.39
1-365	3-I	Me	i-Bu	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	3.87

Formula (I-4)

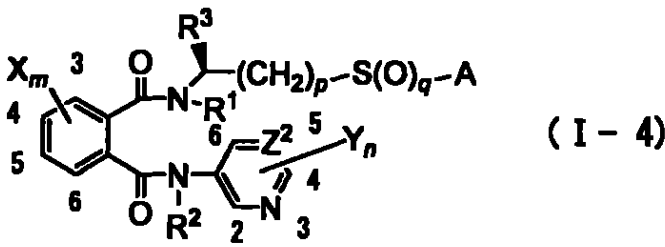


Table 3 (R¹=R²=H, R³=Me, p=1)

No.	X _m	A	q	Y _n	Z ²	Physical properties Melting point (°C)
2-1	3-I	Me	0	4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-2	3-I	Me	1	4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-3	3-I	Me	2	4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-4	3-I	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-5	3-I	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	91-96
2-6	3-I	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-7	3-I	Me	0	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-8	3-I	Me	1	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-9	3-I	Me	2	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-10	3-I	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-11	3-I	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-12	3-I	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-13	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-14	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-15	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
2-16	3-F	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	186
2-17	3-F	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	99-104
2-18	3-F	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	96-105
2-19	3-F	Me	0	2-Me-4-OCH(CF ₃) ₂	CH	203-204
2-20	3-F	Me	1	2-Me-4-OCH(CF ₃) ₂	CH	90-97
2-21	3-F	Me	2	2-Me-4-OCH(CF ₃) ₂	CH	172-175
2-22	3-F	Me	0	2,4-Cl ₂	CH	115-122
2-23	3-F	Me	1	2,4-Cl ₂	CH	
2-24	3-F	Me	2	2,4-Cl ₂	CH	
2-25	3-F	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	138-148
2-26	3-F	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-27	3-F	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	77
2-28	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	196-197

Table 3 (continued)

No.	X _m	A	q	Y _n	Z ²	Physical properties Melting point (°C) logP (pH2.3)
2-29	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	109-119
2-30	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-31	3-Br	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-32	3-Br	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-33	3-Br	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
2-34	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₃	CH	2.76
2-35	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₃	CH	
2-36	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₃	CH	3.33
2-37	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	CH	
2-38	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	CH	
2-39	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	CH	2.55
2-40	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₃	N	
2-41	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₃	N	
2-42	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₃	N	
2-43	3-Br	Me	0	2-Me-4-CF ₃	N	
2-44	3-Br	Me	1	2-Me-4-CF ₃	N	2.60
2-45	3-Br	Me	2	2-Me-4-CF ₃	N	
2-46	3-I	Me	0	2-Me-4-CF ₃	N	2.70
2-47	3-I	Me	1	2-Me-4-CF ₃	N	
2-48	3-I	Me	2	2-Me-4-CF ₃	N	

Table 4

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-3		+32.50° (c=1.06)
1-5	8.26 (d, 1H), 8.13 (br, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.59 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.73 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.52 (d, 3H)	-0.39° (c=1.03)
1-6	8.48 (br, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.00 (dd, 1H), 7.82 (dd, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.13 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 2.64 (dd, 1H), 2.56 (dd, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.34 (m, 2H), 1.26 (d, 3H), 1.08 (t, 3H)	-4.26° (c=0.99)
1-8	8.26 (d, 1H), 8.18 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.64 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.30 (dd, 1H), 3.08 (dd, 1H), 2.82 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.52 (d, 3H), 1.22 (t, 3H)	-4.48° (c=0.46)
1-9	8.47 (br, 1H), 8.40 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.15 (d, 1H), 4.31 (m, 1H), 2.59 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 2.44 (m, 2H), 1.25 (d, 3H), 0.87 (t, 3H)	-2.25° (c=1.01)
1-11	8.28 (br, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.22 (t, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.09 (dd, 1H), 2.84 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.73 (m, 2H), 1.50 (d, 3H), 0.96 (t, 3H)	+3.70° (c=1.04)
1-12	8.48 (br, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.13 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 2.74 (m, 1H), 2.60 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.25 (d, 3H), 1.10 (dd, 6H)	-12.26° (c=1.28)
1-14	8.29 (d, 1H), 8.23 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.66 (d, 1H), 4.68 (m, 1H), 3.27 (dd, 1H), 3.03 (dd, 1H), 2.93 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 1.53 (d, 3H), 1.22 (dd, 6H)	-9.68° (c=1.03)
1-15	8.48 (br, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.16 (d, 1H), 4.33 (m, 1H), 2.71 (q, 2H), 2.58 (dd, 2H), 1.89 (s, 3H), 1.27 (t, 3H), 1.26 (d, 3H)	-5.75° (c=1.01)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-17	8.23(br, 1H), 8.16(d, 1H), 7.97(d, 1H), 7.69(d, 1H), 7.46(s, 1H), 7.45(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.72(d, 1H), 4.59(m, 1H), 3.36(dd, 1H), 3.16(dd, 1H), 2.72(s, 3H), 2.70(q, 2H), 1.50(d, 3H), 1.26(t, 3H)	+4.39° (c=1.06)
1-18	8.77(br, 1H), 8.58(d, 1H), 7.98(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.20-7.26(m, 2H), 7.08(s, 1H), 6.05(d, 1H), 4.32(m, 1H), 3.94(s, 3H), 2.64(dd, 1H), 2.55(dd, 1H), 1.95(s, 3H), 1.24(d, 3H)	-3.31° (c=1.07)
1-20	8.52-8.55(m, 2H), 8.00(d, 1H), 7.67(d, 1H), 7.20-7.27(m, 2H), 7.10(s, 1H), 6.43(d, 1H), 4.62(m, 1H), 3.95(s, 3H), 3.45(dd, 1H), 3.21(dd, 1H), 2.87(s, 3H), 1.53(d, 3H)	-3.06° (c=0.93)
1-21	8.38(br, 1H), 8.30(d, 1H), 8.00(d, 1H), 7.81(d, 1H), 7.21-7.29(m, 3H), 6.09(d, 1H), 4.33(m, 1H), 3.99(m, 1H), 2.58(m, 2H), 2.36(s, 3H), 1.89(s, 3H), 1.25(d, 3H)	-2.45° (c=1.03)
1-23	8.17(d, 1H), 8.03(br, 1H), 8.00(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.25-7.30(m, 2H), 7.24(t, 1H), 6.53(d, 1H), 4.62(m, 1H), 4.00(m, 1H), 3.34(dd, 1H), 3.16(dd, 1H), 2.70(s, 3H), 2.35(s, 3H), 1.52(d, 3H)	-3.48° (c=1.06)
1-24	8.39(br, 1H), 8.28(d, 1H), 7.98(d, 1H), 7.81(d, 1H), 7.20-7.28(m, 3H), 6.15(d, 1H), 4.31(m, 1H), 3.99(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.28-2.35(m, 5H), 1.25(d, 3H), 1.08(t, 3H)	-4.35° (c=0.99)
1-26	8.12-8.15(m, 2H), 7.97(d, 1H), 7.72(d, 1H), 7.25-7.28(m, 2H), 7.22(t, 1H), 7.63(d, 1H), 4.62(m, 1H), 4.00(m, 1H), 3.29(dd, 1H), 3.07(dd, 1H), 2.79(m, 2H), 2.34(s, 3H), 1.52(d, 3H), 1.20(t, 3H)	-4.86° (c=1.05)
1-27	8.42(br, 1H), 8.29(d, 1H), 7.98(d, 1H), 7.81(d, 1H), 7.19-7.28(m, 3H), 6.16(d, 1H), 4.32(m, 1H), 3.99(m, 1H), 2.65-2.79(m, 2H), 2.53(dd, 1H), 2.35(s, 3H), 1.25(d, 3H), 1.10(dd, 6H)	-12.09° (c=1.12)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-29	8.19(br, 1H), 8.15(d, 1H), 7.97(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.20-7.26(m, 3H), 6.66(d, 1H), 4.67(m, 1H), 4.00(m, 1H), 3.27(dd, 1H), 3.02(dd, 1H), 2.90(m, 1H), 2.34(s, 3H), 1.54(d, 3H), 1.20(t, 6H)	-10.45° (c=1.14)
1-30	8.46(br, 1H), 8.41(d, 1H), 8.20(d, 1H), 8.00(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.41(s, 1H), 7.24(t, 1H), 6.12(d, 1H), 4.32(m, 1H), 2.57(m, 2H), 2.39(s, 3H), 1.91(s, 3H), 1.25(d, 3H)	
1-32	8.25(d, 1H), 8.18(br, 1H), 7.99(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.45(d, 1H), 7.44(s, 1H), 7.23(t, 1H), 6.65(d, 1H), 4.61(m, 1H), 3.35(dd, 1H), 3.16(dd, 1H), 2.76(s, 3H), 2.37(s, 3H), 1.50(d, 3H),	+2.97° (c=1.01)
1-33	8.37-8.45(m, 2H), 8.01(d, 1H), 7.84(d, 1H), 7.45-7.52(m, 2H), 7.26(t, 1H), 6.12(d, 1H), 4.34(m, 1H), 2.59(dd, 2H), 2.39(s, 3H), 1.95(s, 3H), 1.26(d, 3H)	+4.99° (c=1.02)
1-35	8.22(d, 1H), 8.14(br, 1H), 7.99(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.48(d, 1H), 7.47(s, 1H), 7.23(t, 1H), 6.62(d, 1H), 4.61(m, 1H), 3.35(dd, 1H), 3.16(dd, 1H), 2.79(s, 3H), 2.36(s, 3H), 1.50(d, 3H)	+27.26° (c=0.96)
1-36	8.32(br, 1H), 8.17(d, 1H), 7.99(d, 1H), 7.83(d, 1H), 7.24(t, 1H), 7.08(d, 1H), 7.06(s, 1H), 6.12(d, 1H), 4.84-5.15(m, 1H), 4.35(m, 1H), 2.61(m, 2H), 2.34(s, 3H), 1.97(s, 3H), 1.28(d, 3H)	+1.95° (c=1.09)
1-38	8.12(br, 1H), 7.91-7.98(m, 2H), 7.69(d, 1H), 7.20(t, 1H), 7.06(s, 1H), 7.05(d, 1H), 6.72(d, 1H), 4.88-5.09(m, 1H), 4.60(m, 1H), 3.36(dd, 1H), 3.16(dd, 1H), 2.76(s, 3H), 2.31(s, 3H), 1.51(d, 3H)	-0.16° (c=1.02)
1-39	8.30(br, 1H), 8.15(d, 1H), 7.98(d, 1H), 7.81(d, 1H), 7.23(t, 1H), 7.07(d, 1H), 7.06(s, 1H), 6.11(d, 1H), 5.90(tt, 1H), 4.34(m, 1H), 2.60(br, 2H), 2.33(s, 3H), 1.97(br, 3H), 1.27(d, 3H)	+2.25° (c=1.04)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-41	8.14 (br, 1H), 7.88-7.99 (m, 2H), 7.68 (d, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.90 (tt, 1H), 4.60 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.76 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	-
1-42	8.32 (br, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.20 (d, 1H), 4.33 (m, 1H), 2.60 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.27 (d, 3H)	+2.61° (c=1.04)
1-44	8.07 (br, 1H), 7.97 (m, 2H), 7.70 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.70 (m, 2H), 6.64 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.37 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	+3.80° (c=1.03)
1-45	8.36 (br, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.05-7.08 (m, 2H), 6.24 (d, 1H), 4.31 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.40 (m, 2H), 2.32 (s, 1H), 1.25 (d, 3H), 1.12 (t, 3H)	+0.26° (c=1.23)
1-47	7.96-8.03 (m, 3H), 7.73 (d, 1H), 7.23 (t, 1H), 7.06-7.10 (m, 2H), 6.58 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.09 (dd, 1H), 2.86 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.53 (d, 3H), 1.25 (t, 3H)	-
1-48	8.64 (br, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.16-7.31 (m, 3H), 6.06 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.63 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-
1-50	8.46 (d, 1H), 8.37 (br, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.45 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.24 (dd, 1H), 2.95 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	-
1-51	8.64 (br, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.07 (d, 1H), 4.34 (m, 1H), 2.66 (m, 2H), 2.44 (m, 2H), 1.27 (d, 3H), 1.15 (t, 3H)	-5.01° (c=1.03)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-53	8.47(d, 1H), 8.39(br, 1H), 8.01(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.32(s, 1H), 7.24(t, 1H), 7.20(d, 1H), 6.47(d, 1H), 4.63(m, 1H), 3.44(dd, 1H), 3.16(dd, 1H), 3.02(q, 2H), 1.55(d, 3H), 1.33(t, 3H)	+7.35° (c=0.79)
1-54	8.58(br, 1H), 8.46(d, 1H), 8.00(d, 1H), 7.74(d, 1H), 7.46(s, 1H), 7.19-7.26(m, 2H), 6.07(d, 1H), 4.36(m, 1H), 2.64(m, 2H), 2.00(s, 3H), 1.29(d, 3H)	-3.08° (c=1.10)
1-56	8.43(d, 1H), 8.33(br, 1H), 8.02(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.48(s, 1H), 7.21-7.27(m, 2H), 6.42(d, 1H), 4.62(m, 1H), 3.50(dd, 1H), 3.25(dd, 1H), 2.95(s, 3H), 1.55(d, 3H)	+10.11° (c=1.07)
1-57	8.57(br, 1H), 8.45(d, 1H), 8.00(d, 1H), 7.74(d, 1H), 7.46(s, 1H), 7.19-7.26(m, 2H), 6.08(d, 1H), 4.35(m, 1H), 2.44-2.75(m, 4H), 1.27(d, 3H), 1.15(t, 3H)	-4.51° (c=1.02)
1-59	8.43(d, 1H), 8.34(br, 1H), 8.02(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.48(s, 1H), 7.21-7.27(m, 2H), 6.45(d, 1H), 4.63(m, 1H), 3.45(dd, 1H), 3.17(dd, 1H), 3.03(m, 2H), 1.56(d, 3H), 1.33(t, 3H)	
1-60	8.76(br, 1H), 8.68(d, 1H), 8.02(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.25(t, 1H), 7.12(d, 1H), 6.01(d, 1H), 4.38(m, 1H), 2.64(dd, 1H), 2.01(s, 3H), 1.31(d, 3H)	-8.47° (c=1.00)
1-62	8.62(d, 1H), 8.45(br, 1H), 8.03(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.26(t, 1H), 7.14(d, 1H), 6.41(d, 1H), 4.64(m, 1H), 3.49(dd, 1H), 3.25(dd, 1H), 2.97(s, 3H), 1.56(d, 3H)	
1-63	8.64(br, 1H), 8.51(d, 1H), 8.00(d, 1H), 7.76(d, 1H), 7.16-7.31(m, 3H), 6.06(d, 1H), 4.36(m, 1H), 2.63(m, 2H), 2.00(s, 3H), 1.28(d, 3H)	-0.19° (c=1.24)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-65	8.37 (d, 1H), 8.34 (br, 1H), 8.01 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.29 (dd, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.44 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.23 (dd, 1H), 2.95 (s, 3H), 1.54 (d, 3H)	+9.91° (c=1.06)
1-66		-4.37° (c=1.01)
1-72	8.53 (br, 1H), 8.38 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.38-7.48 (m, 3H), 6.12 (d, 1H), 4.34 (m, 1H), 2.57 (dd, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.89 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	+0.20° (c=1.04)
1-74	8.25 (d, 1H), 8.17 (br, 1H), 7.71-7.77 (m, 2H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.40 (t, 1H), 6.60 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	-0.36° (c=1.20)
1-75	8.55 (br, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.41-7.51 (m, 3H), 6.17 (d, 1H), 4.35 (m, 1H), 2.57 (dd, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	+13.42° (c=0.23)
1-77	8.23 (d, 1H), 8.19 (br, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.44-7.50 (m, 3H), 6.66 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.50 (d, 3H)	-0.61° (c=1.02)
1-78	8.73 (br, 1H), 8.28 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.42-7.56 (m, 3H), 7.28 (t, 1H), 6.25 (d, 1H), 4.38 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	+8.70° (c=1.18)
1-80	8.28 (br, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.43-7.52 (m, 4H), 7.22-7.29 (m, 1H), 6.80 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.49 (d, 3H)	-2.70° (c=1.00)
1-81	8.66 (br, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.23-7.30 (m, 3H), 6.27 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.27 (d, 3H)	+9.33° (c=1.01)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-83	8.11(br, 1H), 8.06(d, 1H), 7.47-7.55(m, 2H), 7.24-7.30(m, 3H), 6.69(d, 1H), 4.63(m, 1H), 4.01(m, 1H), 3.35(dd, 1H), 3.21(dd, 1H), 2.73(s, 3H), 2.35(s, 3H), 2.51(d, 3H)	- -4.64° (c=1.07)
1-84	9.04(br, 1H), 8.18(d, 1H), 8.12(d, 1H), 7.98(d, 1H), 7.56(t, 1H), 7.25-7.33(m, 2H), 4.10(m, 1H), 2.38(m, 2H), 2.28(s, 3H), 1.67(s, 3H), 1.07(d, 3H)	
1-86	8.35(br, 1H), 8.25-8.31(m, 2H), 8.08(d, 1H), 8.72(t, 1H), 8.48(d, 1H), 7.45(s, 1H), 6.92(d, 1H), 4.60(m, 1H), 3.28(m, 2H), 2.79(s, 3H), 2.38(s, 3H), 1.44(d, 3H)	+17.48° (c=1.03)
1-87	9.03(br, 1H), 8.32(d, 1H), 7.90(m, 1H), 7.42-7.60(m, 5H), 6.25(d, 1H), 4.35(m, 1H), 2.64(m, 2H), 2.41(s, 3H), 2.03(s, 3H), 1.27(d, 3H)	+17.09° (c=0.81)
1-89	8.50(br, 1H), 8.21(d, 1H), 7.75(m, 1H), 7.44-7.62(m, 5H), 6.84(d, 1H), 4.62(m, 1H), 3.26(m, 2H), 2.81(s, 3H), 2.39(s, 3H), 1.47(d, 3H)	
1-90	8.67(br, 1H), 8.32(d, 1H), 7.82(d, 1H), 7.58(t, 1H), 7.42-7.50(m, 3H), 6.17(d, 1H), 4.37(m, 1H), 2.57(br, 2H), 2.40(s, 3H), 1.90(s, 3H), 1.26(d, 3H)	+2.13° (c=1.02)
1-92	8.22(d, 1H), 8.16(br, 1H), 7.73(d, 1H), 7.60(t, 1H), 7.45-7.51(m, 3H), 6.62(d, 1H), 4.66(m, 1H), 3.33(dd, 1H), 3.18(dd, 1H), 2.74(s, 3H), 2.39(s, 3H), 1.51(d, 3H)	
1-93	8.86(br, 1H), 8.01(d, 1H), 7.38-7.50(m, 4H), 7.04(d, 1H), 4.18(m, 1H), 2.54(m, 2H), 2.33(s, 3H), 1.99(s, 3H), 1.16(d, 3H)	

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-95	10.17 (br, 1H), 8.68 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 4.44 (m, 1H), 3.25-3.38 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.23 (d, 3H)	
1-96	8.48 (br, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.15 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 2.71 (q, 2H), 2.61 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 1.27 (t, 3H), 1.26 (d, 3H), 1.08 (t, 3H)	-3.28° (c=0.69)
1-98	8.22 (br, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.08 (dd, 1H), 2.83 (q, 2H), 2.70 (q, 2H), 1.52 (d, 3H), 1.27 (t, 3H), 1.21 (t, 3H)	-4.23° (c=0.99)
1-99	8.42 (br, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.23-7.29 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 6.22 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 2.68 (q, 2H), 2.58 (m, 2H), 1.89 (s, 3H), 1.26 (d, 3H), 1.25 (t, 3H)	-1.48° (c=1.05)
1-101	8.18 (br, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.25-7.29 (m, 2H), 7.20 (t, 1H), 6.73 (d, 1H), 4.59 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.14 (dd, 1H), 2.69 (s, 3H), 2.66 (q, 2H), 1.51 (d, 3H), 1.25 (t, 3H)	-2.58° (c=1.07)
1-102	8.41 (br, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.19-7.29 (m, 3H), 6.17 (d, 1H), 4.31 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 2.68 (q, 2H), 2.62 (m, 2H), 2.36 (m, 2H), 1.26 (d, 3H), 1.25 (t, 3H), 1.08 (t, 3H)	-5.44° (c=1.16)
1-104	8.17 (br, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 6.69 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.20 (dd, 1H), 3.07 (dd, 1H), 2.80 (q, 2H), 2.66 (q, 2H), 1.52 (d, 3H), 1.25 (t, 3H), 1.20 (t, 3H)	-3.63° (c=1.01)
1-222	8.82 (br, 1H), 8.69 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.76 (d, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.04 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-3.15° (c=1.10)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-224	8.65 (d, 1H), 8.55 (br, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.72 (d, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.26 (t, 1H), 6.43 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.25 (dd, 1H), 2.94 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	+7.94° (c=1.11)
1-225	8.71 (br, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.02 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.63 (m, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	-9.28° (c=1.04)
1-227	8.59 (d, 1H), 8.48 (br, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.82 (s, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.25 (t, 1H), 6.42 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.50 (dd, 1H), 3.25 (dd, 1H), 2.93 (s, 3H), 1.56 (d, 3H)	+8.56° (c=1.02)
1-231	8.82 (br, 1H), 8.60 (t, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.37-7.43 (m, 2H), 7.23 (t, 1H), 6.05 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.63 (br, 2H), 1.94 (s, 3H), 1.30 (d, 3H)	
1-233	8.49-8.55 (m, 2H), 8.01 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.51 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.48 (dd, 1H), 3.23 (dd, 1H), 2.89 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	+7.48° (c=1.43)
1-234	8.60 (s, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.00-8.10 (m, 1H), 7.80-7.90 (m, 2H), 7.60-7.70 (m, 3H), 7.45 (d, 1H), 7.40 (s, 1H), 6.80 (d, 1H), 4.50 (m, 1H), 2.60 (d, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	
1-236	8.32 (d, 1H), 8.24 (br, 1H), 8.01 (m, 1H), 7.82-7.89 (m, 2H), 7.61-7.68 (m, 3H), 7.46 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 6.96 (d, 1H), 4.78 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.69 (s, 3H), 1.44 (d, 3H)	
1-237	8.50 (br, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.00-8.06 (m, 2H), 7.76 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.08 (d, 1H), 4.38 (m, 1H), 2.65 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 1.30 (d, 3H)	

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-240	8.55(br, 1H), 8.36(d, 1H), 7.80(d, 1H), 7.74(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.42(s, 1H), 7.40(t, 1H), 6.22(d, 1H), 4.33(m, 1H), 2.61(m, 1H), 2.39(s, 3H), 2.35(m, 2H), 1.25(d, 3H), 1.09(t, 3H)	-6.78° (c=1.23)
1-242	8.30(br, 1H), 8.23(d, 1H), 7.70-7.77(m, 2H), 7.46(d, 1H), 7.44(s, 1H), 7.40(t, 1H), 6.71(d, 1H), 4.65(m, 1H), 3.31(dd, 1H), 3.09(dd, 1H), 2.84(q, 2H), 2.39(s, 3H), 1.52(d, 3H), 1.23(t, 3H)	-2.83° (c=0.99)
1-243	8.49(br, 1H), 8.23(d, 1H), 7.77(d, 1H), 7.72(d, 1H), 7.37(t, 1H), 7.23-7.27(m, 2H), 6.24(d, 1H), 4.32(m, 1H), 3.99(m, 1H), 2.61(m, 2H), 2.35(s, 3H), 2.31-2.39(m, 2H), 1.25(d, 3H), 1.09(t, 3H)	-6.42° (c=1.06)
1-245	8.17(br, 1H), 8.13(d, 1H), 7.69-7.75(m, 2H), 7.39(t, 1H), 7.24-7.29(m, 2H), 6.62(d, 1H), 4.64(m, 1H), 4.01(m, 1H), 3.29(dd, 1H), 3.08(dd, 1H), 2.81(m, 2H), 2.35(s, 3H), 1.52(d, 3H), 1.22(t, 3H)	-3.29° (c=1.05)
1-246	8.50(br, 1H), 8.20(d, 1H), 7.75(d, 1H), 7.70(d, 1H), 7.36(t, 1H), 7.24(d, 1H), 7.23(s, 1H), 6.27(d, 1H), 4.33(m, 1H), 3.99(m, 1H), 2.57(m, 2H), 2.34(s, 3H), 1.89(s, 3H), 1.25(d, 3H)	-3.41° (c=1.10)
1-248	8.35(br, 1H), 7.99(d, 1H), 7.66(d, 1H), 7.62(d, 1H), 7.32(t, 1H), 7.24(s, 1H), 7.23(d, 1H), 6.85(d, 1H), 4.57(m, 1H), 4.00(m, 1H), 3.31(dd, 1H), 3.11(dd, 1H), 2.65(s, 3H), 2.32(s, 3H), 1.47(d, 3H)	-1.66° (c=1.96)
1-249	8.51(br, 1H), 8.22(d, 1H), 7.74(d, 1H), 7.41-7.58(m, 2H), 7.26(d, 1H), 7.24(s, 1H), 6.22(d, 1H), 4.35(m, 1H), 4.00(m, 1H), 2.58(dd, 2H), 2.36(s, 3H), 1.91(s, 3H), 1.26(d, 3H)	-1.51° (c=1.06)
1-251	8.32(br, 1H), 8.02(d, 1H), 7.37-7.63(m, 3H), 7.22-7.27(m, 2H), 6.80(d, 1H), 4.60(m, 1H), 4.01(m, 1H), 3.33(dd, 1H), 3.13(dd, 1H), 2.68(s, 3H), 2.33(s, 3H), 1.48(d, 3H)	-3.24° (c=1.08)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-252	8.59(br, 1H), 8.33(d, 1H), 7.75(d, 1H), 7.56(d, 1H), 7.41-7.49(m, 3H), 6.27(d, 1H), 4.33(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.39(s, 3H), 2.30-2.37(m, 2H), 1.24(d, 3H), 1.08(t, 3H)	- -3.86° (c=1.04)
1-254	8.36(br, 1H), 8.18(d, 1H), 7.66(d, 1H), 7.41-7.58(m, 4H), 6.76(d, 1H), 4.64(m, 1H), 3.30(dd, 1H), 3.05(dd, 1H), 2.83(q, 2H), 2.38(s, 3H), 1.51(d, 3H), 1.21(t, 3H)	-3.86° (c=1.03)
1-255	8.56(br, 1H), 8.18(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.53(d, 1H), 7.43(t, 1H), 7.24(d, 1H), 7.23(s, 1H), 6.30(d, 1H), 4.32(m, 1H), 3.99(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.34(s, 3H), 2.31-2.40(m, 2H), 1.24(d, 3H), 1.09(t, 3H)	-4.18° (c=1.02)
1-257	8.10-8.17(m, 2H), 7.69(d, 1H), 7.43-7.60(m, 3H), 7.30(s, 1H), 6.60(d, 1H), 4.66(m, 1H), 4.01(m, 1H), 3.30(dd, 1H), 3.05(dd, 1H), 2.82(q, 2H), 2.35(s, 3H), 1.53(d, 3H), 1.22(t, 3H)	-6.23° (c=1.17)
1-260	8.24(br, 1H), 8.23(d, 1H), 7.66(d, 1H), 7.56(d, 1H), 7.42-7.48(m, 3H), 6.70(d, 1H), 4.63(m, 1H), 3.34(dd, 1H), 3.17(dd, 1H), 2.75(s, 3H), 2.38(s, 3H), 1.48(d, 3H)	+0.48° (c=1.00)
1-263	8.14(d, 1H), 8.13(br, 1H), 7.66(d, 1H), 7.56(d, 2H), 7.46(t, 1H), 7.26(d, 1H), 7.25(s, 1H), 6.64(d, 1H), 4.63(m, 1H), 4.01(m, 1H), 3.34(dd, 1H), 3.17(dd, 1H), 2.73(s, 3H), 2.35(s, 3H), 1.49(d, 3H)	+2.42° (c=1.02)
1-264	8.70(br, 1H), 8.17(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.58(d, 1H), 7.49(t, 1H), 7.46(t, 1H), 6.13(d, 1H), 4.37(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.28(d, 3H), 1.94(s, 3H), 1.27(d, 3H)	+2.72° (c=1.04)
1-266	8.49(br, 1H), 7.95(d, 1H), 7.65(d, 1H), 7.55(d, 1H), 7.46(t, 1H), 7.43(t, 1H), 6.72(d, 1H), 4.62(m, 1H), 3.36(dd, 1H), 3.19(dd, 1H), 2.80(s, 3H), 2.26(d, 3H), 1.50(d, 3H)	+1.76° (c=1.23)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-267	8.42 (br, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.17 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.62 (dd, 1H), 2.58 (dd, 1H), 2.34 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.26 (d, 3H)	+6.04° (c=1.05)
1-269	8.04 (br, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.09 (br, 1H), 6.58 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	
1-270	8.67 (br, 1H), 8.49 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.08 (d, 1H), 4.39 (m, 1H), 2.67 (dd, 1H), 2.61 (dd, 1H), 2.02 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	-0.30° (c=1.01)
1-272	8.46 (d, 1H), 8.39 (br, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.21 (d, 1H), 6.46 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.48 (dd, 1H), 3.24 (dd, 1H), 2.96 (s, 3H), 1.54 (d, 3H)	+12.19° (c=1.06)
1-273	8.58 (br, 1H), 8.44 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.24 (d, 1H), 6.08 (d, 1H), 4.39 (m, 1H), 2.68 (dd, 1H), 2.62 (dd, 1H), 2.03 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	-1.81° (c=1.10)
1-275	8.43 (d, 1H), 8.33 (br, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.46-7.53 (m, 2H), 7.23 (s, 1H), 6.42 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.26 (dd, 1H), 2.97 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	
1-278	8.27 (d, 1H), 8.16 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.63 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.50 (d, 3H)	+2.41° (c=2.04)
1-281	8.08-8.20 (m, 2H), 7.97 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.22-7.27 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.60 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.34 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.49 (d, 3H)	-0.39° (c=1.01)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
1-282	8.30 (s, 1H), 8.26 (d, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.23 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.02 (s, 1H), 6.19 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.67 (dd, 1H), 2.59 (dd, 1H), 2.35 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	+3.73° (c=1.06)
1-284	8.24 (d, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.95-8.00 (m, 3H), 7.71 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.03 (s, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.60 (d, 1H), 4.65 (m, 1H), 3.39 (dd, 1H), 3.20 (dd, 1H), 2.84 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.57 (d, 3H)	-1.98° (c=1.01)
1-285	8.39 (s, 1H), 8.26 (d, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.01 (s, 1H), 6.23 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.69 (dd, 1H), 2.61 (dd, 1H), 2.37 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.31 (d, 3H)	+4.93° (c=1.02)
1-287	8.24 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.44 (t, 1H), 7.03 (s, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.59 (d, 1H), 4.65 (m, 1H), 3.38 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.56 (d, 3H)	
1-288	8.78 (br, 1H), 8.77 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 6.09 (d, 1H), 4.39 (m, 1H), 2.64 (s, 3H), 2.59 (d, 2H), 1.90 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-4.10° (c=1.02)
2-4	8.80 (d, 1H), 8.63 (br, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.26 (t, 1H), 6.04 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.63 (s, 3H), 2.58 (d, 2H), 1.87 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-10.27° (c=1.04)
2-6	8.63 (d, 1H), 8.41 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.38 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.61 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	
2-10	8.70 (d, 1H), 8.62 (br, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.25 (t, 1H), 6.06 (d, 1H), 4.31-4.48 (m, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.56-2.61 (m, 2H), 1.87 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-7.39° (c=1.01)

Table 4 (continued)

No.	NMR data ¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Specific rotation [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
2-12	8.52 (d, 1H), 8.30 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.65 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.39 (m, 1H), 3.37 (dd, 1H), 3.18 (dd, 1H), 2.76 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 1.52 (d, 3H)	
2-15	8.57 (d, 1H), 8.49 (br, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.48 (t, 1H), 6.71 (d, 1H), 4.65 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.62 (s, 3H), 1.50 (d, 3H)	+2.66° (c=1.03)

EXAMPLES

Typical examples of the present invention are described below but they should not be construed as limiting the scope of the invention.

5 As used in the examples, the terms "part" and "parts" are by weight.

Formulation Example 1

	Each compound listed in Tables 1 and 2	10 parts
10	Xylene	70 parts
	N-methylpyrrolidone	10 parts
	Mixture of polyoxyethylene nonylphenyl ether and calcium alkylbenzenesulfonate	10 parts

15 An emulsion was prepared by mixing uniformly the above ingredients to effect dissolution.

Formulation Example 2

Each compound listed in Tables 1 and 2	3 parts
Clay powder	82 parts
Diatomaceous earth powder	15 parts

- 5 A dust was prepared by mixing uniformly and grinding the above ingredients.

Formulation Example 3

Each compound listed in Tables 1 and 2	5 parts
Mixed powder of bentonite and clay	90 parts
10 Calcium ligninsulfonate	5 parts

Granules were prepared by mixing the above ingredients uniformly, and kneading the resulting mixture together with a suitable amount of water, followed by granulation and drying.

15 Formulation Example 4

Each compound listed in Tables 1 and 2	20 parts
Mixture of kaolin and synthetic	
kaoline and high-dispersion silicic acid	75 parts
Mixture of polyoxyethylene nonylphenyl	
20 ether and calcium alkylbenzenesulfonate	5 parts

A wettable powder was prepared by mixing uniformly and grinding the above ingredients.

Test Example 1: Insecticidal activity on diamond back moth (Plutella xylostella)

- 25 A cabbage leaf disc (variety: Shikidori) cut

into 7cm-diameter was dipped for about 30 seconds into a chemical solution prepared by diluting a preparation containing each compound listed in Tables 1 and 2 as an active ingredient to adjust the concentration to 50 ppm. After dried, it was put into a plastic Petri dish with a diameter of 9 cm and inoculated with ten of the third instar larvae of diamond back moths. Eight days after the inoculation, the dead and alive larvae were counted. The mortality was calculated according to the following equation and the insecticidal activity was judged according to the criterion shown below. The test was carried out with three replications under the condition of 25°C, 50-60%RH and 16L-8D photoperiod.

$$\text{Mortality (\%)} = \frac{\text{Number of alive larvae in untreated group} - \text{Number of alive larvae in treated group}}{\text{Number of alive larvae in untreated group}} \times 100$$

Criterion:

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

As a result, the following compounds were rated A: compound Nos. 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-

29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-56, 1-57, 1-59, 1-60, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-68, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-92, 1-93, 1-95, 1-96, 1-98, 1-99, 1-101, 1-102, 1-104, 1-105, 1-222, 1-224, 1-225, 1-227, 1-231, 1-233, 1-234, 1-236, 1-237, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248, 1-249, 1-250, 1-251, 1-252, 1-253, 1-254, 1-255, 1-256, 1-257, 1-260, 1-263, 1-264, 1-266, 1-267, 1-269, 1-270, 1-272, 1-273, 1-275, 1-278, 1-281, 1-282, 1-283, 1-284, 1-285, 1-287, 1-288, 1-290, 1-291, 1-293, 1-306, 1-307, 1-308, 1-315, 1-317, 1-321, 1-323, 1-327, 1-328, 1-329, 1-330, 1-331, 1-332, 1-333, 1-334, 1-335, 2-4, 2-5, 2-6, 2-10, 2-12, 2-13, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-27, 2-28, 2-30 and 2-32.

Test Example 2: Insecticidal activity on common cutworm (Spodoptera litura)

20 A cabbage leaf disc (variety: Shikidori) cut into 7cm-diameter was dipped for about 30 seconds into a chemical solution prepared by diluting a preparation containing each compound listed in Tables 1 and 2 as an active ingredient to adjust the concentration to 50
25 ppm. After dried, it was put into a plastic Petri dish with a diameter of 9 cm and inoculated with ten of the second instar larvae of common cutworm. Eight days

after the inoculation, the dead and alive larvae were counted. The mortality was calculated and the insecticidal activity was judged in the same manner as in Test Example 1. The test was carried out with three
5 replications under the condition of 25°C, 50-60%RH and 16L-8D photoperiod.

As a result, the following compounds were rated A: compound Nos. 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-
10 20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-56, 1-57, 1-59, 1-60, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-68, 1-72, 1-73, 1-74, 1-
15 75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-92, 1-93, 1-95, 1-96, 1-98, 1-99, 1-101, 1-102, 1-104, 1-105, 1-222, 1-225, 1-227, 1-231, 1-233, 1-234, 1-237, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248,
20 1-249, 1-250, 1-251, 1-252, 1-253, 1-254, 1-255, 1-256, 1-257, 1-260, 1-263, 1-264, 1-266, 1-269, 1-270, 1-272, 1-273, 1-275, 1-278, 1-281, 1-282, 1-283, 1-284, 1-285, 1-287, 1-288, 1-290, 1-291, 1-293, 1-306, 1-307, 1-308, 1-321, 1-327, 1-328, 1-329, 1-331, 1-332, 1-333, 1-334, 1-
25 335, 2-4, 2-5, 2-6, 2-10, 2-12, 2-13, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-28 and 2-30.

Test Example 3: Insecticidal activity on smaller tea tortrix (Adxophyes sp.)

Tea leaves were dipped for about 30 seconds in a chemical solution prepared by diluting a
 5 preparation containing each compound listed in Tables 1 and 2 as an active ingredient to adjust the concentration to 50 ppm. After dried, the tea leaves were placed in a plastic Petri dish with a diameter of 9 cm and inoculated with larvae of smaller tea tortrix.
 10 Eight days after the inoculation, the dead and alive larvae were counted. The mortality was calculated and the insecticidal activity was judged in the same manner as in Test Example 1. The test was carried out with three replications under the condition of 25°C, 50-60%RH
 15 and 16L-8D photoperiod.

As a result, the following compounds were rated A: compound Nos. 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-
 20 29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-42, 1-44, 1-45, 1-47, 1-48, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-56, 1-60, 1-62, 1-64, 1-66, 1-68, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-90, 1-92, 1-93, 1-95, 1-96, 1-98, 1-99, 1-
 25 104, 1-105, 1-222, 1-224, 1-225, 1-227, 1-231, 1-233, 1-234, 1-236, 1-237, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248, 1-249, 1-250, 1-251, 1-252, 1-253, 1-254, 1-255, 1-256, 1-257, 1-260, 1-263, 1-264,

1-266, 1-267, 1-269, 1-270, 1-278, 1-281, 1-282, 1-283,
1-284, 1-285, 1-287, 1-288, 1-290, 1-291, 1-293, 1-307,
1-308, 1-327, 1-328, 1-329, 1-330, 1-332, 1-333, 1-334,
1-335, 2-10, 2-12, 2-13, 2-15, 2-16, 2-17, 2-28 and 2-
5 30.

Comparative test 1: Systemic activity of agent in
Chinese cabbage

A Chinese cabbage seedling (variety: Aichi)
cultured in a paper pot filled with horticultural
10 molding was placed in a cylindrical plastic container.
An agent containing, as an active ingredient, each of
the compounds shown in the table and a comparative
compound 1 (the compound with Compound No. 216
described in JP-A-2001-131141), was diluted with water
15 into concentrations of 0.03, 0.1, 0.3, 1, and 3 ppm, so
as to prepare 10 ml each of an agent solution. The
plant foot of each Chinese cabbage seedling was
drenched in the obtained solution. The Chinese
cabbage was inoculated with the third instar larvae of
20 common cutworm (Spodoptera litura). Four days after
the inoculation, the number of surviving larvae was
counted. The mortality was calculated according to the
expression indicated below, and it was then evaluated
in accordance with the criterion indicated below. The
25 results are shown in Table 5. The test was carried out
with three replications under the condition of 25°C, 50-
60%RH and 16L-8D photoperiod.

$$\text{Mortality} = \frac{\text{Number of alive larvae in untreated group} - \text{Number of alive larvae in treated group}}{\text{Number of alive larvae in untreated group}} \times 100$$

Criterion:

10 --- Mortality 91%-100%	9 --- Mortality 81%-90%
8 --- Mortality 71%-80%	7 --- Mortality 61%-70%
6 --- Mortality 51%-60%	5 --- Mortality 41%-50%
5 4 --- Mortality 31%-40%	3 --- Mortality 21%-30%
2 --- Mortality 11%-20%	1 --- Mortality 1%-10%
0 --- Mortality 0%	

Table 5

Compound	concentration (ppm)	Mortality evaluation (4 days later)
1-4	3	10
	1	10
	0.3	5
	0.1	4
	0.03	0
1-5	3	10
	1	10
	0.3	10
	0.1	4
	0.03	3
1-77	3	10
	1	10
	0.3	5
	0.1	3
	0.03	0
1-74	3	10
	1	10
	0.3	10
	0.1	3
	0.03	2
Comparative compound 1	3	10
	1	4
	0.3	2
	0.1	0
	0.03	0
Untreated		0

When compared with the comparative compound, the compound of the present invention clearly exhibited superiority.

Comparative test 2: Control of common white (Pieris
5 rapae) on cabbage by prick-in-hole application at transplanting

An agent containing, as an active ingredient (AI), each of the compounds shown in the table and a comparative compound 1 (the compound with Compound No.
10 216 described in JP-A-2001-131141), was put into a prick-in-hole on the ground, and then cabbage seedlings (Variety: YR Seitoku) transplanted onto the treated hole (at the end of April). 27 days after the transplanting, the number of larvae of common white was
15 counted. The control value was calculated according to the expression indicated below, and it was then evaluated in accordance with the criterion noted in Comparative test 1 above. One test group consisted of 20 cabbage loaves. The results are shown in Table 6.

$$\text{Control value} = \frac{\text{Number of parasites in untreated group} - \text{Number of parasites in treated group}}{\text{Number of parasites in untreated group}} \times 100$$

Table 6

Compound	Dosage (mgAI/plant)	Evaluation of control value (27 days later)
1-4	10	10
1-5	10	10
1-77	10	10
1-74	10	10
Comparative compound 1	10	5
Untreated		0

When compared with the comparative compound, the compound of the present invention clearly exhibited superiority.

Comparative test 3: Control of common cutworm

5 (Spodoptera litura) on cabbage by prick-in-hole application at transplanting

An agent containing, as an active ingredient (AI), each of the compounds shown in the table and a comparative compound 1 (the compound with Compound No. 10 216 described in JP-A-2001-131141), was put into a prick-in-hole on the ground, and then cabbage seedlings (Variety: YR Seitoku) transplanted onto the treated hole (at the end of April). 30 days after the transplanting, the third leaf from top leaf was cut off 15 and placed into a Petri dish with ten of the third instar larvae of common cutworm. Four days after the

inoculation, the number of surviving larvae was counted. The mortality was calculated and evaluated in the same manner as in Comparative test 1 above. The test was carried out with two replications. The results are shown in Table 7.

Table 7

Compound	Dosage (mgAI/loaf)	Mortality evaluation (30 days later)
1-4	10	10
1-5	10	10
1-77	10	10
1-74	10	10
Comparative compound 1	10	2
Untreated		0

When compared with the comparative compound, the compound of the present invention clearly exhibited superiority.

10 Comparative test 4: Control of common cutworm
(Spodoptera litura) on cabbage by drenching application
into nursery box

An agent containing, as an active ingredient,
each of the compounds shown in the table and a
15 comparative compound 1 (the compound with Compound No.
216 described in JP-A-2001-131141) was diluted into

prescribed concentrations. A cabbage seedling (Variety: YR Seitoku) on the nursery box was drenched in the obtained solution at a rate of 4 ml/plant. Shortly after the drenching, the cabbage plant was

5 transplanted to the field. 20 days after the transplanting, the third leaf from the top leaf was cut off and placed in a Petri dish with ten of the third instar larvae of common cutworm. Four days after the inoculation, the number of surviving larvae was

10 counted. The mortality was calculated and evaluated in the same manner as in Comparative test 1 above. The test was carried out with two replications. The results are shown in Table 8.

Table 8

Compound	Dosage		Mortality evaluation (20 days later)
	(mgAI/loaf)	(ppm)	
1-4	1.56	400	10
	0.78	200	10
	0.39	100	8
1-5	1.56	400	10
	0.78	200	10
	0.39	100	9
Comparative compound 1	1.56	400	9
	0.78	200	0
	0.39	100	0
Untreated			0

When compared with the comparative compound,

the compound of the present invention clearly exhibited superiority.

Comparative test 5: Control of *Myzus persicae*
- systemic

5 An agent containing, as an active ingredient,
each of representative of the compounds of the present
invention (Compound Nos. 1-77 and 1-74), comparative
compound 2 (Compound No. 101 described in JP-A-2001-
131141) and comparative compound 3 (Compound No. 97
10 described in JP-A-2001-131141) was diluted into
prescribed concentrations.

The preparation containing the active
ingredient is mixed into water. The stated
concentration is based on the amount of active
15 ingredient per unit volume of water (mg/l = ppm). The
diluted agent was filled into a container with an
infested pea plant (Pisum sativum) with Green peach
aphids (Myzus persicae).

After 6 days, mortality was determined. Table 9 shows
20 the results. 100 % means that all the aphids have been
killed; 0 % means that none of the aphids have been
killed.

Table 9

Compound	Dosage	Mortality (%)
	(ppm)	
1-77	20	90
	4	85
	0.8	0
1-74	100	70
Comparative compound 2	20	0
	4	0
	0.8	0
Comparative compound 3	100	0
Untreated		0

When compared with the comparative compounds, the compounds of the present invention clearly exhibited superiority.

5 Comparative test 6: Control of Spodoptera exigua

An agent containing, as an active ingredient, each of the compound of the present invention (Compound No. 1-77) and comparative compound 2 (Compound No. 101 described in JP-A-2001-131141) was diluted into
10 prescribed concentrations.

Cabbage leaves (Brassica oleracea) were treated by being dipped into the preparation of the active compound of the desired concentration and were infested

with caterpillars of the beet army worm (Spodoptera exigua) while the leaves were still moist.

After 7 days, mortality was determined. Table 10 shows the results. 100 % means that all the caterpillars have been killed; 0 % means that none of the caterpillars have been killed.

Table 10

Compound	Dosage (ppm)	Mortality (%)
1-77	4	100
	0.8	100
	0.16	100
	0.032	0
	0.0064	0
Comparative compound 2	4	100
	0.8	100
	0.16	0
	0.032	0
	0.0064	0
Untreated		0

In this test, the compound of the present invention showed remarkably higher efficacy than its racemate.

10 Comparative test 7: Control of *Phaedon cochleariae*

An agent containing, as an active ingredient,

each of the compound of the present invention (Compound No. 1-77) and comparative compound 2 (Compound No. 101 described in JP-A-2001-131141) was diluted into prescribed concentrations.

- 5 Cabbage leaves (Brassica oleracea) were treated by being dipped into the diluted agent and were infested with mustard beetle larvae (Phaedon cochleariae) as long as the leaves were still moist.
- After 7 days, mortality was determined. Table 11 shows
- 10 the results. 100 % means that all the beetle larvae have been killed; 0 % means that none of the beetle larvae have been killed.

Table 11

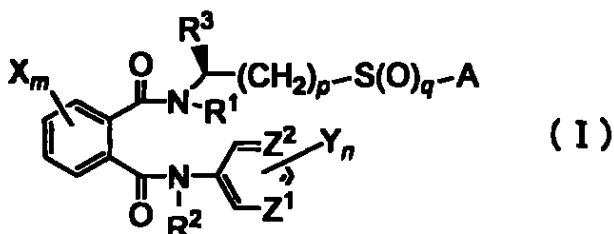
Compound	Dosage (ppm)	Mortality (%)
1-77	100	100
	20	100
	4	100
	0.8	0
	0.16	0
Comparative compound 2	100	100
	20	100
	4	0
	0.8	0
	0.16	0
Untreated		0

95

In this test, the compound of the present invention showed remarkably higher efficacy than its racemate.

CLAIMS

1. An optically active phthalamide derivative represented by the following formula (I) or a salt thereof:



(wherein R^1 and R^2 may be same or different, and each of R^1 and R^2 represents a hydrogen atom; a C1-C6 alkyl group; a substituted C1-C6 alkyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a mono-C1-C6 alkylamino group, and a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different; or a C1-C6 alkoxycarbonyl group;

R^3 represents a C1-C6 alkyl group;

A represents a hydrogen atom; a C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkyl group; a C3-C6 alkenyl group; a halo C3-C6 alkenyl group; a C3-C6 alkynyl group; a halo C3-C6 alkynyl group; a C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkylthio C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkylthio C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkylsulfinyl C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkylsulfonyl C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6

alkylsulfonyl C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkylcarbonyl group; a mono-C1-C6 alkylcarbamoyl group; a di-C1-C6 alkylcarbamoyl group in which the alkyl groups may be same or different; a phenoxy C1-C6 alkyl group; a substituted phenoxy C1-C6 alkyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a phenyl C1-C6 alkyl group; or a substituted phenyl C1-C6 alkyl group having, on the ring thereof, one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or

different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different;

p represents an integer between 0 and 4;

q represents an integer between 0 and 2;

X may be same or different and represents a halogen atom, a cyano group, an amino group, a nitro group, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C2-C6 alkenyl group, a halo C2-C6 alkenyl group, a C2-C6 alkynyl group, a halo C2-C6 alkynyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, or a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different; and

m represents an integer between 0 and 4; and

X may form a condensed ring together with carbon atoms adjacent thereto on a phenyl ring, and such a condensed ring may have one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom; a C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkoxy group; a halo C1-C6 alkoxy group; a C1-C6 alkylthio group; a halo C1-C6 alkylthio group; a C1-C6 alkylsulfinyl group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl group; a C1-C6 alkylsulfonyl group; a halo C1-C6 alkylsulfonyl group;

a mono-C1-C6 alkylamino group; a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different; a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group; a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a phenyl group; a substituted phenyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a heterocyclic group; and a substituted heterocyclic group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same

or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different;

Y may be same or different and represents a hydrogen atom, a halogen atom; a cyano group; an amino group; a nitro group; a C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkyl group; a C2-C6 alkenyl group; a halo C2-C6 alkenyl group; a C2-C6 alkynyl group; a halo C2-C6 alkynyl group; a cyclo C3-C6 alkyl group; a halocyclo C3-C6 alkyl group; a C1-C6 alkoxy group; a halo C1-C6 alkoxy group; a C1-C6 alkylthio group; a halo C1-C6 alkylthio group; a C1-C6 alkylsulfinyl group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl group; a C1-C6 alkylsulfonyl group; a halo C1-C6 alkylsulfonyl group; a mono-C1-C6 alkylamino group; a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different; a tri-C1-C6 alkylsilyl group in which the alkyl groups may be same or different; a phenyl group; a substituted phenyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6

alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a heterocyclic group; or a substituted heterocyclic group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; and

n represents an integer between 1 and 5; and

Y may form a condensed ring together with carbon atoms adjacent thereto on a phenyl ring, and such a condensed ring may have one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom; a C1-C6 alkyl group; a halo C1-C6 alkyl group; a C1-C6 alkoxy group; a halo C1-C6 alkoxy group; a C1-C6 alkylthio group; a halo C1-C6 alkylthio group; a C1-C6 alkylsulfinyl group; a halo C1-C6 alkylsulfinyl group; a C1-C6 alkylsulfonyl group; a halo C1-C6 alkylsulfonyl group; a mono-C1-C6 alkylamino group; a di-C1-C6 alkylamino

group in which the alkyl groups may be same or different; a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group; a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a phenyl group; a substituted phenyl group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; a heterocyclic group; or a substituted heterocyclic group having one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and

a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; and

Z^1 and Z^2 may be same or different, and each of Z^1 and Z^2 represents C-Y (wherein Y has the same meaning as described above) or nitrogen atom;

provided that, when both R^1 and R^2 represent hydrogen atoms, R^3 represents a methyl group, X represents an iodine atom, m represents 1, Y_n represents a 2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl] group, p represents 1, and q represents 0, then A is not a methyl group and ethyl group).

2. The optically active phthalamide derivative or a salt thereof according to claim 1, wherein R^1 and R^2 may be same or different, and each of R^1 and R^2 represents a hydrogen atom or C1-C6 alkyl group; R^3 represents a methyl group or ethyl group; A represents a C1-C6 alkyl group, a C3-C6 alkenyl group, a C3-C6 alkynyl group, a C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkylthio C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkylsulfinyl C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl C1-C6 alkyl group, or a mono-C1-C6 alkylcarbamoyl group; p represents an integer between 1 and 4; X may be same or different and represents a halogen atom, a nitro group, a halo C1-C6 alkyl group, or a halo C1-C6 alkoxy group; m represents an integer between 0 and 2; and Y may be same or different and represents a halogen atom, a cyano group, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl

group, a C2-C6 alkenyl group, a halo C2-C6 alkenyl group, a C2-C6 alkynyl group, a halo C2-C6 alkynyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, or a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different, and Y may form a condensed ring together with carbon atoms adjacent thereto on a phenyl ring, and such a condensed ring may have one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, a mono-C1-C6 alkylamino group, a di-C1-C6 alkylamino group in which the alkyl groups may be same or different, a mono(halo C1-C6 alkyl)amino group, and a di(halo C1-C6 alkyl)amino group in which the alkyl groups may be same or different; and n represents an integer between 1 and 4.

3. The optically active phthalamide derivative or a salt thereof according to claim 1, wherein R¹ and R² may be same or different, and each of R¹ and R² represents a hydrogen atom or a C1-C6 alkyl group; R³

represents a methyl group; A represents a C1-C6 alkyl group, a C3-C6 alkenyl group, a C3-C6 alkynyl group, a C1-C6 alkoxy C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkylthio C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkylsulfinyl C1-C6 alkyl group, or a C1-C6 alkylsulfonyl C1-C6 alkyl group; p represents an integer between 1 and 4; q represents 1 or 2; X may be same or different and represents a halogen atom, a nitro group, a halo C1-C6 alkyl group, or a halo C1-C6 alkoxy group; m represents an integer between 0 and 2; and Y may be same or different and represents a halogen atom, a cyano group, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C2-C6 alkenyl group, a halo C2-C6 alkenyl group, a C2-C6 alkynyl group, a halo C2-C6 alkynyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, or a halo C1-C6 alkylsulfonyl group, and Y may form a condensed ring together with carbon atoms adjacent thereto on a phenyl ring, and such a condensed ring may have one or more substituents that may be same or different and are selected from the group consisting of a halogen atom, a C1-C6 alkyl group, a halo C1-C6 alkyl group, a C1-C6 alkoxy group, a halo C1-C6 alkoxy group, a C1-C6 alkylthio group, a halo C1-C6 alkylthio group, a C1-C6 alkylsulfinyl group, a halo C1-C6 alkylsulfinyl group, a C1-C6 alkylsulfonyl group, and a halo C1-C6 alkylsulfonyl group; and n represents an integer

between 1 and 4.

4. An optically active phthalamide derivative selected from the group consisting of

(S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl)-N²-(1-methyl-2-methylsulfonyl)ethyl)phthalamide,

(S)-3-chloro-N¹-(2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl)-N²-(1-methyl-2-methylsulfonyl)ethyl)phthalamide,

(S)-3-bromo-N¹-(2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl)-N²-(1-methyl-2-methylsulfonyl)ethyl)phthalamide, and

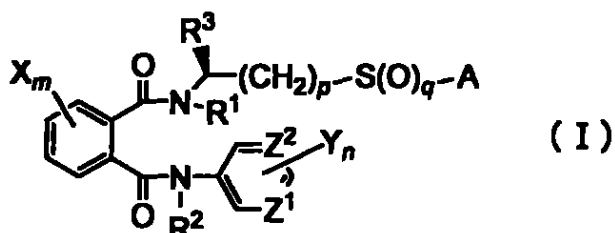
(S)-3-iodo-N¹-(2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl)-N²-(1-methyl-2-methylsulfinylethyl)phthalamide, or a salt thereof.

5. An agrohorticultural insecticide, which comprises, as an active ingredient, the optically active phthalamide derivative or a salt thereof according to any one of claims 1 to 4.

6. A method of using an agrohorticultural insecticide, which comprises treating a target plant or soil with an effective amount of the agrohorticultural insecticide according to claim 5, so as to control insect pests from useful plants.

ABSTRACT

The present invention relates to an optically active phthalamide derivative represented by the following formula (I):



(wherein each of R^1 and R^2 represents H, optionally substituted C1-C6 alkyl, or C1-C6 alkoxy carbonyl; R^3 represents C1-C6 alkyl; A represents H, C1-C6 alkyl, C3-C6 alkenyl, C3-C6 alkynyl, optionally substituted phenoxy C1-C6 alkyl, or the like; p represents 0, 1, 2, 3, or 4; q represents 0, 1, or 2; X represents halogen, CN, NH_2 , C1-C6 alkyl, C2-C6 alkenyl, C1-C6 alkylthio, or the like; m represents 0, 1, 2, 3, or 4; Y represents halogen, CN, NH_2 , C1-C6 alkyl, optionally substituted phenyl, or the like; n represents 1, 2, 3, 4, or 5; and each of Z^1 and Z^2 represents C-Y or N; and further X and Y may form a condensed ring together with carbon atoms adjacent thereto on a phenyl ring), a salt thereof, an agrohorticultural insecticide comprising the above derivative as an active ingredient, and a method of use thereof. The optically active phthalamide derivative of the present invention has superior control activity as an agrohorticultural insecticide, and has excellent effects even when the insecticide is used in admixture

with other insecticides.

**DERIVADO DE FTALIMIDA OPTICAMENTE ACTIVO, INSECTICIDA
AGRICOLA U HORTICOLA Y METODO DE USO DEL MISMO**

Campo de la invención

5 La presente invención se refiere a un derivado de ftalimida ópticamente activo, a un insecticida agrohortícola que contiene el compuesto como un ingrediente activo y a un método para usar el mismo.

10 **Antecedentes de la invención**

 Se ha conocido anteriormente que cierto tipo de derivado de ftalimida es útil como un insecticida agrohortícola (véase JP-A-11-240857, por ejemplo). Además, también se ha conocido que un derivado de ftalimida que tiene
15 un esqueleto que es similar al de la presente invención es útil como un insecticida agrohortícola (véase JP-A-2001-131141, por ejemplo). Sin embargo, estas publicaciones anteriores han descrito sólo un cuerpo racémico y una parte de sustancias ópticamente activas que tienen cierto
20 sustituyente. Así, la sustancia ópticamente activa que tiene un sustituyente de la presente invención es un compuesto nuevo y aún no se ha conocido que tenga rendimiento superior como un insecticida.

25

Breve descripción de la invención

Problemas a ser resueltos por la invención

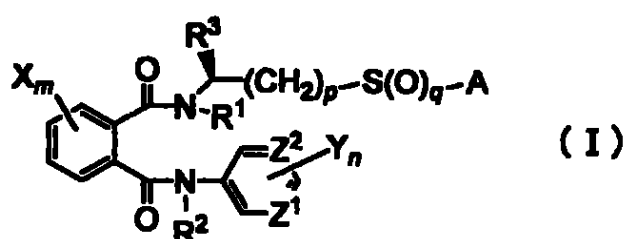
En la producción de cultivos en los campos agrícola y hortícola, el daño causado por plagas de insectos es aún
5 serio. Por razones tales como la emergencia de plagas de insectos que son resistentes a los insecticidas existentes, se ha deseado el desarrollo de un nuevo insecticida agrohortícola. Además, por razones tales como el envejecimiento de la población de granjeros, se han deseado
10 varios tipos de métodos que ahorren trabajo. Al mismo tiempo, también se ha deseado el desarrollo de insecticidas agrohortícolas adecuados para estos métodos de ahorro de trabajo.

Medios para resolver el problema

Como resultado de intensos estudios dirigidos hacia el desarrollo de un insecticida agrohortícola nuevo, los presentes inventores han encontrado que el derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I)
20 de la presente invención es un compuesto nuevo que no había sido descrito en ninguna publicación, y que cuando se le comparó con los compuestos descritos en las publicaciones mencionadas arriba, exhibió superiores efectos e insecticidas a una dosis baja. Además, también han encontrado que el
25 derivado de ftalimida ópticamente activo de la presente

invención puede ser un insecticida agrohortícola superior que exhiba excelente actividad para ser absorbido de raíces de plantas y translocalizado o sistematizado en las plantas completas, en particular, cuando el suelo o similar sea tratado con este insecticida. Así, los presentes inventores han completado la presente invención.

Es decir, la presente invención se refiere a un derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) indicada a continuación:



15 (en donde R¹ y R² pueden ser el mismo o diferente, y cada uno de R¹ y R² representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1-C6; un grupo alquilo de C1-C6 sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un

20 átomo de halógeno, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6 y un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; o un grupo alcoxycarbonilo de C1-C6;

25 R³ representa un grupo alquilo de C1-C6;

A representa un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo alquenilo de C3-C6; un grupo haloalquenilo de C3-C6; un grupo alquinilo de C3-C6; un grupo haloalquinilo de C3-C6; un grupo
5 alcoxi de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo
10 haloalquilsulfonilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo alquilcarbonilo de C1-C6; un grupo monoalquilcarbamoilo de C1-C6; un grupo dialquilcarbamoilo de C1-C6; en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenoxialquilo de C1-C6; un grupo fenoxialquilo de C1-C6
15 sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un
20 grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo mono-alquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden
25 ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de

C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilalquilo de C1-C6; o un grupo fenilalquilo de C1-C6 sustituido que tiene, en el anillo del mismo, uno o más
5 sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo
10 alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo
15 monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes;

p representa un entero de entre 0 y 4;

q representa un entero de entre 0 y 2;

20 X puede ser el mismo o diferente y representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo nitro, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alquenilo de C2-C6, un grupo haloalquenilo de C2-C6, un grupo alquinilo de C2-C6, un grupo haloalquinilo de
25 C2-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-

C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, o un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, y

m representa un entero de entre 0 y 4 y

X puede formar un anillo condensado junto con átomos de carbono adyacentes al mismo en un anillo de fenilo, y este anillo condensado puede tener uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se selecciona del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo alcoxi de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-C6; un grupo haloalquiltio de C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo monoalquilamino de C1-C6; un grupo dialquilamino de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo monohaloalquilamino de C1-C6; un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tenga uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o

diferentes y se selecciona de un grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6, en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6, y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo heterocíclico; y un grupo heterocíclico sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos

o diferentes;

Y puede ser el mismo o diferente y representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un grupo ciano; un grupo amino; un grupo nitro; un grupo alquilo de C1-C6; un
5 grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo alquenilo de C2-C6; un grupo haloalquenilo de C2-C6; un grupo alquinilo de C2-C6; un grupo haloalquinilo de C2-C6; un grupo cicloalquilo de C3-C6; un grupo halocicloalquilo de C3-C6; un grupo alcoxi de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-C6; un
10 grupo haloalquiltio de C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo monoalquilamino de C1-C6; un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los
15 mismos o diferentes; un grupo trialquilsililo de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tenga uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno,
20 un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo
25 haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-

C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6, y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos
5 o diferentes; un grupo heterocíclico; o un grupo heterocíclico sustituido que tenga uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de
10 C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-
15 C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6, y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; y

20 n representa un entero de entre 1 y 5 y

Y puede formar un anillo condensado junto con átomos de carbono adyacentes al mismo en un anillo de fenilo, y este anillo condensado puede tener uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del
25 grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo

de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo alcoxi de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-C6; un grupo haloalquiltio de C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo monoalquilamino de C1-C6; un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo monohaloalquilamino de C1-C6; un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo heterocíclico; un grupo heterocíclico sustituido que tenga uno o más

sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes y

Z^1 y Z^2 pueden ser los mismos o diferentes, y cada uno de Z^1 y Z^2 representan C-Y (en donde Y tiene el mismo significado descrito arriba) o átomo de nitrógeno;

siempre que, cuando R^1 y R^2 representen átomos de hidrógeno, R^3 represente un grupo metilo, X represente un átomo de yodo, m represente 1, y n represente un grupo 2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo], p represente 1 y q represente 0, entonces A no sea un grupo metilo y un grupo etilo);

una sal del mismo, un insecticida agrohortícola que comprende estas sustancias como ingredientes activos y un método para usar el mismo.

El derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) de la presente invención exhibe excelentes efectos de control como un insecticida agrohortícola. Además, incluso cuando se usa mezclado con
5 otros insecticidas agrohortícolas, acaricidas, nematocidas, funguicidas, herbicidas, reguladores de crecimiento de plantas, plaguicidas bióticos, y similares, exhibe excelentes efectos de control.

10

Descripción detallada de la invención

En la fórmula (I) que representa el derivado de ftalimida ópticamente activo de la presente invención, el término "átomo de halógeno" se usa para indicar un átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de yodo o átomo de flúor. El
15 término "grupo alquilo de C1-C6" se usa para indicar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de este grupo alquilo de C1-C6 pueden incluir un grupo metilo, grupo etilo, grupo n-propilo, grupo isopropilo, grupo n-butilo, grupo isobutilo, grupo s-butilo,
20 grupo t-butilo, grupo n-pentilo, grupo neopentilo y grupo n-hexilo. El término "grupo haloalquilo de C1-C6" se usa para indicar un grupo alquilo lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono, el cual es sustituido con uno o más átomos de halógeno que pueden ser los mismos o diferentes.
25 Ejemplos de este grupo haloalquilo de C1-C6 puede incluir un

grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo perfluoroetilo, un grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo 1-bromoetilo y un grupo 2,3-dibromopropilo. El término "grupo alcoxi de C1-C6" se usa para indicar un grupo alcoxi lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de este grupo alcoxi de C1-C6 pueden incluir un grupo metoxi, grupo etoxi, grupo n-propoxi, grupo isopropoxi, grupo n-butoxi, grupo s-butoxi, grupo t-butoxi, grupo n-pentiloxi, grupo isopentiloxi, grupo neopentiloxi y grupo n-hexiloxi.

El término "grupo haloalcoxi de C1-C6" se usa para indicar un grupo alquilo de C1-C6 lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono, el cual es sustituido con uno o más átomos de halógeno que pueden ser los mismos o diferentes. Ejemplos de este grupo haloalcoxi de C1-C6 pueden incluir un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi y un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi. El término "grupo alcoxycarbonilo de C1-C6" se usa para indicar un grupo alcoxycarbonilo lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de este grupo alcoxycarbonilo de C1-C6 pueden incluir un grupo metoxycarbonilo, grupo etoxycarbonilo, grupo n-propoxycarbonilo, grupo isopropoxycarbonilo, grupo n-butoxycarbonilo y grupo t-butoxycarbonilo. El término "grupo alquiltio de C1-C6" se

usa para indicar un grupo alquiltio lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de este grupo alquiltio de C1-C6 pueden incluir un grupo metilitio, grupo etiltio, grupo n-propiltio, grupo isopropiltio, grupo n-butiltio, grupo s-butiltio, grupo t-butiltio, grupo n-pentiltio, grupo isopentiltio y grupo n-hexiltio. El término "grupo alquilsulfinilo de C1-C6" se usa para indicar un grupo alquilsulfinilo lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de este grupo alquilsulfinilo de C1-C6 pueden incluir un grupo metilsulfinilo, grupo etilsulfinilo, grupo n-propilsulfinilo, grupo isopropilsulfinilo, grupo n-butilsulfinilo, grupo s-butilsulfinilo, grupo t-butilsulfinilo, grupo n-pentilsulfinilo, grupo isopentilsulfinilo, y grupo n-hexilsulfinilo. El término "grupo alquilsulfonilo de C1-C6" se usa para indicar un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado que contiene 1 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de ese grupo alquilsulfonilo de C1-C6 pueden incluir un grupo metilsulfonilo, grupo etilsulfonilo, grupo n-propilsulfonilo, grupo isopropilsulfonilo, grupo n-butilsulfonilo, grupo s-butilsulfonilo, grupo t-butilsulfonilo, grupo n-pentilsulfonilo, grupo isopentilsulfonilo y grupo n-hexilsulfonilo.

Ejemplos de un "grupo heterocíclico" pueden incluir un grupo piridilo, un grupo N-óxido de piridina, un grupo pirimidinilo, un grupo furilo, un grupo tetrahidrofurilo, un

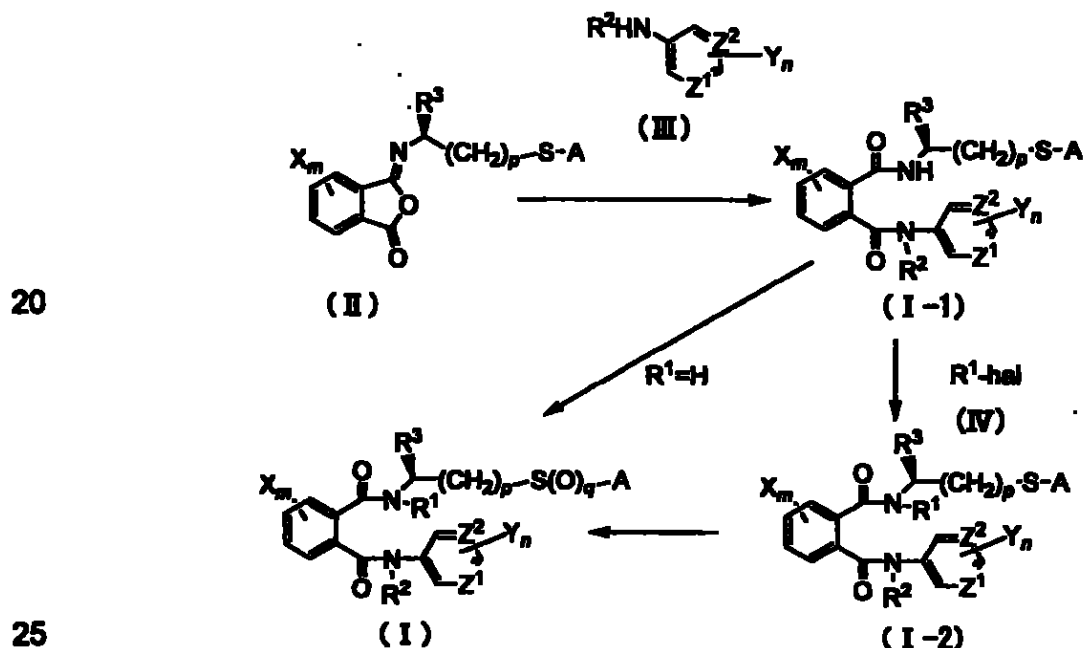
grupo tienilo, un grupo tetrahidrotienilo, un grupo tetrahidropiranilo, un grupo tetrahidrotiopiranilo, un grupo oxazolilo, un grupo isoxazolilo, un grupo oxadiazolilo, un grupo tiazolilo, un grupo isotiazolilo, un grupo tiadiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo triazolilo y un grupo pirazolilo. Ejemplos de un "anillo condensado" pueden incluir naftaleno, tetrahidronaftaleno, indeno, indano, quinolina, quinazolina, indol, indolina, cromano, isocromano, benzodioxano, benzodioxol, benzofurano, dihidrobenzofurano, benzotiofeno, dihidrobenzotiofeno, benzoxazol, benzotiazol, bencimidazol e imidazol.

Ejemplos de una sal del derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) de la presente invención pueden incluir: sales de ácidos inorgánicos tales como clorhidrato, sulfato, nitrato o fosfato; sales de ácidos orgánicos tales como acetato, fumarato, maleato, oxalato, metnsulfonato, bencensulfonato o paratoluensulfonato y sales formadas con ion sodio, ion potasio o ion calcio.

En el derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) de la presente invención, R^1 y R^2 son en manera particularmente preferible átomos de hidrógeno y R^3 es de manera particularmente preferible un grupo metilo. A es de preferencia un grupo alquilo de C1-C6, y en forma particularmente preferible un grupo metilo o grupo

etilo. p Es de preferencia 1 ó 2, y de manera particularmente preferible 1. q Es un entero de entre 0 y 2, de preferencia 1 ó 2, y de manera particularmente preferible 2. X es de preferencia un átomo de halógeno, y de manera particularmente preferible un átomo de cloro, átomo de bromo o átomo de yodo. m Es de preferencia 1 ó 2, de manera particularmente preferible 1. Y es de preferencia un grupo alquilo de C1-C6, átomo de halógeno, grupo haloalquilo de C1-C6 o grupo haloalcoxi de C1-C6. n Es de preferencia 2 ó 3. z¹ y z² son de manera particularmente preferible CH.

La estereoquímica absoluta del derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) de la presente invención es una forma (S). Se puede producir mediante el método de producción mostrado en la siguiente fórmula, por ejemplo:



en donde R^1 , R^2 , R^3 , A, X, Y, Z^1 , Z^2 , p, q, m y n tienen los mismos significados que los descritos arriba, y hal representa un átomo de halógeno.

Un derivado de ftalisoimida representado por la
5 fórmula (II) se deja reaccionar con un derivado de anilina representado por la fórmula (III) en presencia o ausencia de un ácido o base en un solvente inerte, para obtener así un derivado de ftalimida representado por la fórmula (I-1). El derivado de ftalimida (I-1) se deja después reaccionar con un
10 haluro representado por la fórmula (IV) en presencia de un agente deshidrohalogenante y un solvente inerte, para obtener así un derivado de ftalimida representado por la fórmula (I-2). El derivado de ftalimida (I-2) se deja después reaccionar con un agente de oxidación en presencia de un
15 solvente inerte, para producir así un derivado de ftalimida representado por la fórmula (I). Cuando R^1 es un átomo de hidrógeno, el derivado de ftalimida representado por la fórmula (I) puede producirse al permitir que el derivado de ftalimida representado por la fórmula (I-1) reaccione con un
20 agente oxidante en presencia de un solvente inerte, sin el procedimiento de producir el derivado de ftalimida representado por la fórmula (I-2).

(1) Fórmula (II) $\rightarrow$ Fórmula (I-1)

En la presente invención, un producto de interés
25 puede producirse mediante el método descrito en J. Med.

Chem., 1967, vol. 10, pág. 982. Cualquier solvente inerte se usa en la presente invención, a menos que inhiba significativamente el progreso de la reacción. Ejemplos de ese solvente inerte pueden incluir tetrahidrofurano, éter dietílico, éter metil-t-butílico, dioxano, cloroformo, cloruro de metileno, clorobenceno, tolueno, acetonitrilo, acetato de etilo y acetato de butilo. Ejemplos de un ácido usado en la presente reacción pueden incluir: ácidos orgánicos tales como ácido acético o ácido trifluoroacético; y ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico. Este ácido se puede usar según sea adecuado en la escala de entre una cantidad catalítica y una cantidad molar excesiva con respecto a derivados de ftalisoimida representado por la fórmula (II). Ejemplos de una base pueden incluir: bases orgánicas tales como trietilamina o piridina; y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o hidróxido de sodio. Esta base se puede usar según sea adecuado en la escala entre una cantidad catalítica y una cantidad molar excesiva con respecto al derivado de ftalisoimida representado por la fórmula (II). La temperatura de reacción puede estar en la escala de entre 0° y el punto de ebullición de un solvente inerte usado. El tiempo de reacción es diferente dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de reacción, etc. Está en la escala entre varios

minutos y 48 horas. Luego de concluir la reacción, un producto de interés puede aislarse de la mezcla de reacción que lo contenga de acuerdo con métodos comunes. El producto obtenido se purifica mediante recristalización, cromatografía en columna o similares, si es necesario, para producir así un producto de interés.

(2) Fórmula (I-1) → Fórmula (I-2)

Se usa cualquier solvente inerte en la presente invención, a menos que inhiba significativamente el progreso de la reacción. Ejemplos de este solvente inerte pueden incluir: hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno o xileno; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como fluorobenceno, clorobenceno o diclorobenceno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo o tetracloruro de carbono; éteres de cadena o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano o tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida o dimetilacetamida; ácidos tales como ácido acético; sulfóxido de dimetilo y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Estos solventes inertes pueden usarse individualmente o en combinación de dos o más tipos. Ejemplos de un agente deshidrohalogenante pueden incluir: bases orgánicas tales como trietilamina o piridina; y bases inorgánicas tales como carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o hidróxido de sodio. Ya que la

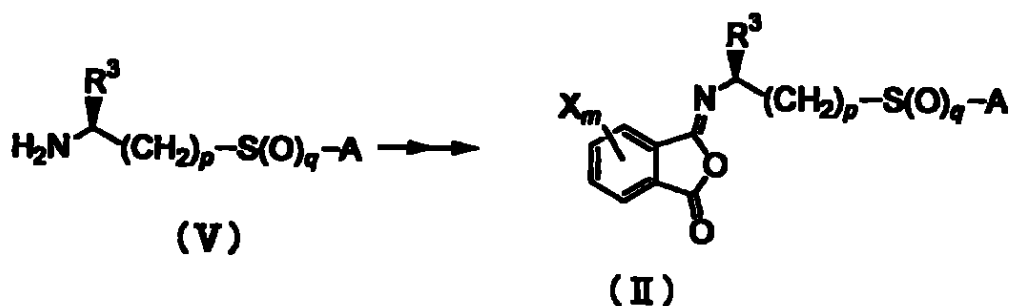
presente reacción es una reacción equimolar, todos los reactivos pueden usarse en una cantidad equimolar. Sin embargo, también es posible usar ciertos reactivos a una cantidad excesiva. La temperatura de reacción puede ser
5 entre la temperatura ambiente y la temperatura de reflujo de un solvente inerte usado. El tiempo de reacción es diferente dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de reacción, etc. Se puede seleccionar según sea adecuado a partir de la escala entre varios minutos y 48 horas. Después
10 de concluir la reacción, un producto de interés puede aislarse de la mezcla de reacción que lo contenga de acuerdo con métodos comunes. El producto obtenido se purifica mediante recristalización, cromatografía en columna o similares, si es necesario, para producir así un producto de
15 interés. Además, también es posible someter el producto de interés obtenido a la siguiente reacción sin aislamiento del producto de la mezcla de reacción.

(3) Fórmula (I-1) o (I-2) → Fórmula (I)

Ejemplos de un solvente inerte usado en la presente
20 reacción pueden incluir: hidrocarburos halogenados tales de cloruro de metileno o cloroformo; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno o xileno; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como fluorobenceno, clorobenceno o diclorobenceno; ácidos tales como ácido acético y alcoholes
25 tales como metanol, etanol o propanol. Ejemplos de un agente

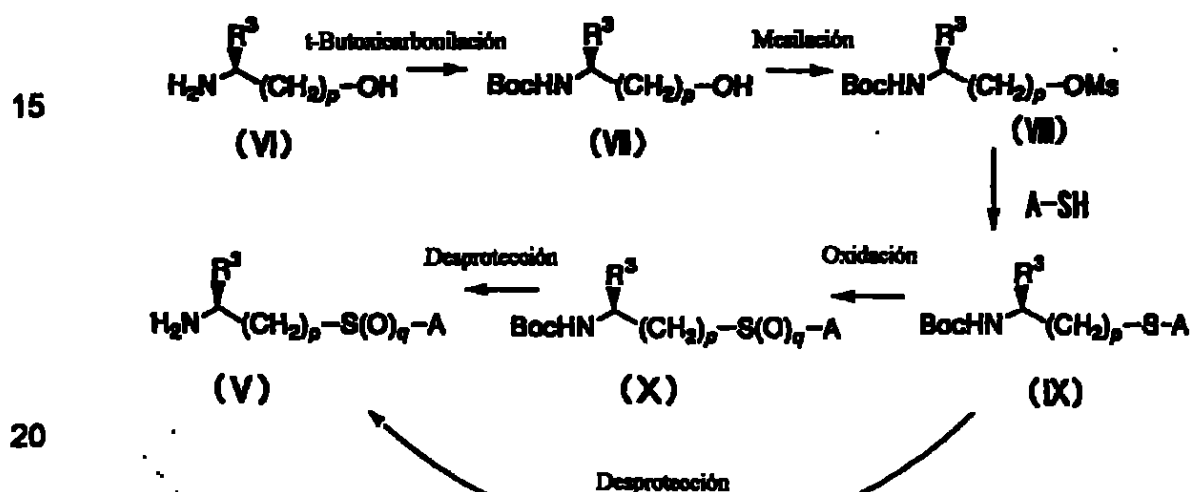
oxidante pueden incluir ácido metacloroperbenzoico, ácido peracético, metaperiodato de potasio, persulfato hidrógeno de potasio (oxones) y peróxido de hidrógeno. Este agente oxidante puede usarse en una cantidad de entre 0.5 y 3 5 equivalentes con respecto al derivado de ftalimida representado por la fórmula (I-1) o (I-2). La temperatura de reacción puede estar en la escala entre -50°C y el punto de ebullición de un solvente inerte usado. El tiempo de reacción es diferente dependiendo de la escala de reacción, 10 la temperatura de reacción, etc. Se puede seleccionar según sea adecuado de la escala entre varios minutos y 24 horas. Después de concluir la reacción, un producto de interés puede ser aislado de la mezcla de reacción que lo contenga de acuerdo con métodos comunes. El producto obtenido puede 15 purificarse mediante recristalización, cromatografía en columna o similares, si es necesario, para producir así el producto de interés.

El derivado de ftaloisoimida representado por la fórmula (II) que se usa como un compuesto de materia prima de 20 la presente invención se puede producir a partir de una amina ópticamente activa representada por la fórmula (V) de acuerdo con los métodos de producción descritos en JP-A-11-240857 y JP-A-2001-131141, como se muestra en la siguiente fórmula:



en donde R^3 , A, X, p, q y m tienen los mismos significados que los descritos arriba.

La amina ópticamente activa representada por la fórmula (V) puede producirse a partir de un amino alcohol de acuerdo con métodos conocidos (por ejemplo, Tetrahedron Lett., 1989, vol. 30, pág. 2653), mediante el método de producción indicado a continuación, por ejemplo.



en donde R^3 , A, p y q tienen los mismos significados que los descritos arriba; Boc representa un grupo t-butoxicarbonilo y Ms representa un grupo mesilo.

Un amino alcohol ópticamente activo representado por la fórmula (VI) es sometido a t-butoxicarbonilación, para obtener así un carbamato representado por la fórmula (VII). El carbamato es luego sometido a mesilación, para obtener así un mesilato representado por la fórmula (VIII). El mesilato obtenido es luego dejado reaccionar con un tiol, para obtener así un sulfuro representado por la fórmula (IX). Cuando q es 0, el sulfuro obtenido se desprotege directamente, para de esta manera producir una amina ópticamente activa de interés representada por la fórmula (V). En contraste, cuando q es 1 ó 2, el átomo de azufre del sulfuro representado por la fórmula (IX) se oxida para obtener un sulfóxido de sulfona representado por la fórmula (X), seguido por la desprotección del producto obtenido, para producir de esta manera una amina ópticamente activa de interés representada por la fórmula (V).

El insecticida agrohortícola que contiene un derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) de la presente invención como un ingrediente activo, es adecuado para controlar varias plagas de insectos tales como plagas de insectos agrohortícolas, plagas de insectos en granos almacenados, plagas de insectos domésticas, plagas de insectos sanitarias, nematodos, etc., los cuales son dañinos para cultivos de arroz, árboles frutales, vegetales, otros cultivos, flores, plantas de

ornato, etc. Tienen un marcado efecto insecticida, por ejemplo, en LEPIDÓPTEROS incluyendo piral de frutos del verano (*Adoxophes orana fasciata*), piral del té más pequeña (*Adoxophyes* sp.), polilla de la fruta de Manchurria (*Grapholita inopinata*), polilla de la fruta oriental (*Grapholita molesta*), arriate de la vaina de soya (*Leguminovora glycinivorella*), enrollador foliar de la mora (*Olethreutes mori*), enrollador foliar del té (*Caloptilia thevivora*), *Caloptilia* sp. (*Caloptilia zachrysa*), minador de las hojas de la manzana (*Phyllonorycter ringoniella*), minador de la corteza de la pera (*Spulerrina astaurota*), mariposa pequeña de la col (*Piers rapae crucivora*), oruga de las yemas del tabaco (*Heliothis* sp.), polilla bacalao (*Laspeyresia pomonella*), polilla de espalda diamantada (*Plutella xylostella*), polilla del fruto de la manzana (*Argyresthia conjugella*), polilla del fruto del durazno (*Carposina niponensis*), perforador del tallo del arroz (*Chilo suppressalis*), enrollador foliar del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), polilla del tabaco (*Ephestia elutella*), piral de la mora (*Glyphodes pyloalis*), perforador del arroz amarillo (*Scirpophag incertulas*), paparda del arroz (*Parnara guttata*), gusano soldado del arroz (*Pseudaletia separata*), perforador rosado (*Sesamia inferens*), oruga podadora común (*Spodoptera litura*), gusano soldado de la remolacha (*Spodoptera exigua*), etc.; HEMÍPTEROS incluyendo saltahojas áster (*Macrosteles*

fascifrons), saltahojas del arroz verde (*Nephotettix cincticeps*), saltahojas del arroz café (*Nilaparvata lugens*), saltahojas del arroz de lomo blanco (*Sogatella furcifera*), psila de los cítricos (*Diaphorina citri*), mosca blanca de la vid (*Aleurolibus taonabae*), mosca blanca del camote (*Bemisia tabaci*), mosca blanca del invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*), áfido del nabo (*Lipaphis erysimi*), áfido del durazno verde (*Myzus persicae*), cochinilla india (*Ceroplastes ceriferus*), cochinilla de los cítricos algodonosos (*Pulvinaria aurantii*), cochinilla del alcanfor (*Pseudaonidia duplex*), cochinilla de San José (*Comstockaspis perniciosa*), cochinilla punta de flecha (*Unapsis yanonensis*), etc.; TILÉNQUIDOS incluyendo nematodo de lesión de la raíz (*Pratylenchus sp.*), escarabajo de la soya (*Anomala rufocuprea*), escarabajo japonés (*Popillia japonica*), escarabajo del tabaco (*Lasioderma serricorne*), escarabajo del polvo (*Lyctus brunneus*), mariquita de veintiocho puntos (*Epilachna vigintiotopunctata*), gorgojo del frijol azuki (*Callosobruchus chinensis*), gorgojo de los vegetales (*Listroderes costirostris*), gorgojo del maíz (*Sitophilus zeamais*), gorgojo del trnco (*Anthonomus grandis grandis*), gorgojo del agua del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), escarabajo foliar de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*), escarabajo foliar del arroz (*Oulema oryzae*), pulguilla rayada (*Phyllotreta striolata*), escarabajo de los

brotes del pino (*tomicus piniperda*), escarabajo de la papa de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), escarabajo del frijol mexicano (*Epilachna varivestis*), gusano de la raíz del maíz (*Diabrotica* sp.), etc.; DÍPTEROS incluyendo

5 (*Dacus*(*Zeugodacus*)*cucurbitae*), mosca de la fruta oriental (*Dacus*(*Bactrocera*)*dorsalis*), minador del arroz (*Agnomyza oryzae*), gusanillo de la cebolla (*Delia antiqua*), mosca del frijol (*Delia platura*), mosca de la agalla de la vaina de la soya (*Asphondylia* sp.), mosca doméstica (*Musca domestica*),

10 mosquito doméstico (*Culex pipiens pipiens*), etc.; TILÉNQUIDOS incluyendo nematodo de lesión de la raíz del café (*Pratylenchus coffeae*), nematodo del quiste de la papa (*globoidea rostochiensis*), nematodo del nudo de la raíz (*Meloidogyne* sp.), nematodo de los cítricos (*Tylenchulus*

15 *semipenetrans*), *Aphelenchus* sp. (*Aphelenchus avenae*), foliar del crisantemo (*Aphelenchoides ritzemabosi*), etc. y ACARINOS incluyendo ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), ácaro araña rojo de los árboles frutales (*Panonychus ulmi*), ácaro araña carmín (*Tetranychus cinnabarinus*), ácaro araña

20 Kanzawa (*Tetranychus kanzawai kishida*), ácaro araña de dos puntos (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro del tostado del té rosa (*Acaphylla theae*), ácaro del tostado del cítrico rosa (*Aculops pelekassi*), ácaro del té púrpura (*Calacarus carinatus*), ácaro del tostado de la pera (*Epitrimerus pyri*),

25 etc.

El insecticida agrohortícola que contiene un derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) de la presente invención como un ingrediente activo, exhibe un efecto controlador significativo contra

5 todas las especies de termitas dañinas para casas, materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables, tales como, rinotermítidos incluyendo termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki) y *Reticulitermes speratus* (Kolbe);

10 *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes tibialis* y *Reticulitermes flavipes* que habitan en Norteamérica; *Reticulitermes lucifugus* y *Reticulitermes santonesis* que habitan en la costa del mar mediterráneo; *Incisitermes minor* (Hagen); termítidos incluyendo *Odontotermes formosanus*

15 (Shiraki); kalotermítidos incluyendo *Cryptotermes domesticus* (Haviland); y termópsidos incluyendo *Hodotermopsis japonica* (Holmgren), etc. También exhibe un efecto controlador significativo contra hormigas dañinas para plantas agrícolas o humanos al entrar en casas o instalaciones públicas tales

20 como parques, en una dosis baja, las hormigas incluyen formicidas incluyendo *Monomorium pharaoni* Linnes, *Monomorium nipponense* Wheeler, *Camponotus kiusiuensis* Santschi, *Formica japonica* Motschulsky y *Lasius fuliginosus* (Latreille); hormigas (*Solenopsis richteri*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis*

25 *geminata* (F)) que habitan en Norteamérica.

El insecticida agrohortícola, el cual contiene un derivado ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) de la presente invención como un ingrediente activo, tiene un marcado efecto controlador de las plagas de insectos, plagas sanitarias y/o nematodos ejemplificados arriba, las cuales son dañinas para cultivos de campos de arroz, cultivos en tierras altas, árboles frutales, vegetales y otros cultivos, flores y plantas de ornato, y similares. Por lo tanto, el efecto deseado del insecticida agrohortícola de la presente invención puede ser exhibido al aplicar el insecticida a la instalación de vivero, campo de arroz, campo de tierras altas, árboles frutales, vegetales, otros cultivos, semillas de flores y plantas de ornato, agua de campos de cultivo de arroz, tallos y hojas, o suelo en una temporada en la cual las plagas de insectos, plagas sanitarias o nematodos se espere que aparezcan, antes de su aparición o en el momento en el que se confirme su aparición. Particularmente, una aplicación preferible para usar el insecticida agrohortícola de la presente invención es la aplicación para la cual se utilizan tanto la "penetración como la translocación o sistematización", en donde el presente insecticida agrohortícola se aplica al suelo de vivero de cultivos, plantas de ornato o similares; el suelo del orificio del recogimiento en un transplante; las raíces vegetales; el agua de irrigación o el agua de cultivo de un

cultivo de agua; para de esta manera absorber los derivados de ftalimida ópticamente activos de la presente invención de las raíces a través o no a través del suelo. Más aún, en años recientes se ha desarrollado la tecnología IPM 5 (Administración Integral de Plagas) que usa productos genéticamente modificados (productos resistentes a herbicidas, productos resistentes a plagas en los cuales un gen generador de proteínas insecticidas ha sido incorporado, productos resistentes a enfermedades en los cuales un gen que 10 genera una sustancia que induce resistencia a enfermedades ha sido incorporado, productos con sabor mejorado, productos con calidad de almacenamiento mejorada, productos con rendimiento mejorado, etc.), feromonas de insectos (agentes que alteran la comunicación usados para *Tortricidae* o *Mamestra*, etc.), o 15 insectos enemigos naturales. El insecticida agrohortícola de la presente invención puede usarse mezclado con esta técnica, o se puede usar en sistematización con la misma.

Las plantas a las cuales el insecticida agrohortícola de la presente invención puede ser aplicado no 20 están limitadas particularmente. Estas plantas incluyen los siguientes ejemplos.

Ejemplos de tales plantas pueden incluir cereales (por ejemplo, arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, etc.), frijoles (soya, frijoles adzuki, habas caballares, 25 chícharos, habas rojas, frijoles rojos, cacahuates, etc.),

huertos frutales/frutos (manzanas, frutos cítricos, pomos, uvas, duraznos, albaricoques, cerezas, nueces, castañas, almendras, plátanos, fresas, etc.), cultivos de hojas/frutos (col, tomate, espinaca, brócoli, lechuga, cebolla, cebolla
5 verde, pimiento morrón, berenjena, pimiento campana, etc.), cultivos de raíz (zanahoria, papa, camote, aroide, rábano Japonés, raíz de loto, nabo, bardana, ajo, etc.), productos procesados (algodón, cáñamo, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha de azúcar, oliva, goma, café, tabaco, té,
10 etc.), pepos (calabaza, pepino, *Cucumis melo*, sandía, melón, etc.), plantas de pastura (césped, sorgo, fleo, trébol, alfalfa, etc.), forrajes (césped, césped doblado, etc.), plantas de ornato tales como perfume (lavanda, romero, timo, perejil, pimienta, jengibre, etc.), plantas de florescencia
15 (crisantemo, rosa, clavel, orquídea, etc.), árboles de jardín (ginkgo, cerezo, laurel japonés, etc.), y árboles del bosque (*Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, pino, thuja, cedro japonés, ciprés japonés, etc.).

Además, las plantas a las cuales se puede aplicar
20 el insecticida agrohortícola de la presente invención incluyen plantas transgénicas o cultivos de plantas. Las plantas transgénicas o cultivos de plantas (es decir, aquellas obtenidas mediante ingeniería genética) incluyen todas las plantas que, en la modificación genética,
25 recibieron material genético que imparte rasgos útiles

particularmente adecuados a estas plantas. Ejemplos de plantas transgénicas que pueden mencionarse son las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, frijoles de soya, papas, algodón, tabaco, colza de
5 semillas oleaginosas y también plantas frutales (con los frutos manzanas, peras, frutos cítricos y uvas), y se da énfasis particular a maíz, frijoles de soya, papa, algodón, tabaco y colza de semillas oleaginosas. Ejemplos de estos rasgos son mejor crecimiento de la planta, tolerancia
10 incrementada a altas o bajas temperaturas, tolerancia incrementada a sequía o al contenido de sal en agua o suelo, rendimiento de florecencia incrementado, cosecha más fácil, maduración acelerada, rendimientos de cultivo más altos, mejor calidad y/o un valor nutricional más alto de los
15 productos cosechados, mejor estabilidad bajo almacenamiento y/o capacidad de procesamiento de los productos cosechados. Ejemplos adicionales y particularmente enfatizados de estos rasgos son una mejor defensa de las plantas contra plagas de animales y microbios, tales como contra insectos, ácaros,
20 hongos, bacterias y/o virus fitopatógenos, y también tolerancia incrementada de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos. Los rasgos que se enfatizan particularmente son la defensa incrementada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y gusanos por toxinas
25 formadas en las plantas, en particular aquellas formadas en

las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA (a), CryIA (b), CryIA (c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c CryAb, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de los mismos)

5 (referidas abajo en la presente como "plantas Bt"). Los rasgos que también son particularmente enfatizados son la defensa incrementada de las plantas contra hongos, bacterias y virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicitores y también genes de

10 resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Los rasgos que se enfatizan de manera particularmente adicional son la tolerancia incrementada de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o

15 fosfinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes en cuestión que imparten los rasgos deseados también pueden estar presentes en combinación unos con otros en las plantas transgénicas. Ejemplos de "plantas Bt" que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón,

20 variedades de frijol de soya y variedades de papa las cuales se venden con los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, frijoles de soya), KnockOut® (por ejemplo maíz), Nucotn® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (papa). Ejemplos de

25 plantas tolerantes a herbicidas que pueden mencionarse son

variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de frijol de soya que se venden con los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, frijoles de soya), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza de semillas oleaginosas), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas criadas de una manera convencional para tolerancia a herbicidas) que pueden mencionarse incluyen las variedades vendidas con el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz). Por supuesto, estas declaraciones también aplican a cultivos de plantas que tengan estos rasgos genéticos u otros aún por ser desarrollados, plantas que en el futuro serán desarrolladas y/o comercializadas. Las declaraciones anteriores también aplican a semillas ("semilla" siendo usado en el sentido descrito abajo) que tengan estos rasgos genéticos o rasgos genéticos aún por ser desarrollados, plantas que en el futuro serán desarrolladas y/o comercializadas.

20 Para controlar varios tipos de plagas de insectos, el insecticida agrohortícola de la presente invención se aplica en una cantidad efectiva para controlar plagas de insectos o nematodos, directamente, o en forma de ser diluido con agua o similares, o en forma de ser suspendido en agua o
25 similares, a plantas respecto a las cuales se pronostique la

infestación de estas plagas de insectos o nematodos. Cuando el presente insecticida agrohortícola se aplica a huertos frutales, cereales, vegetales y similares, infestados con plagas de insectos o nematodos, por ejemplo, se aplica a 5 hojas o tallos de los mismos, o también se puede aplicar mediante tratamientos que incluyan: tratamientos de semillas tales como inmersión de semillas en el agente, o recubrimiento con polvo de semillas, y tratamientos de suelo en los cuales el suelo se trata con el agente, para permitir 10 así que las plantas absorban el agente de las raíces de las mismas, tales como la mezcla del agente en todas las capas del suelo, tratamiento de surcos, mezcla del agente en el suelo del lecho, tratamiento de vivero celular, tratamiento de hoyos de plantación, tratamiento de cama, recubrimiento 15 superior, tratamiento en cajas de arroz o aplicación sumergida. Además, la adición del agente a la solución en cultivo en solución (pendiente), fumigación o inyección del agente en troncos de los árboles, también se puede aplicar.

Más aún, el insecticida agrohortícola de la 20 presente invención puede aplicarse en una cantidad efectiva para controlar plagas de insectos o nematodos, directamente, o en forma de ser diluido con agua o similares, o en forma de ser suspendido en agua o similares, a plantas respecto a las cuales se pronostique la infestación de estas plagas de 25 insectos o nematodos. Por ejemplo, el presente insecticida

agrohortícola se aplica a plagas de insectos en granos almacenados, plagas de insectos domésticas, plagas de insectos sanitarias, plagas de insectos de bosque o similares. De otra manera, también se puede usar mediante
5 métodos tales como la aplicación a materiales de construcción de casas, fumigación o cebado.

Ejemplos de un método de tratamiento de semilla pueden incluir: un método que comprende diluir o no diluir una formulación líquida o sólida con agua y luego sumergir
10 las semillas en la solución obtenida, para de esta manera permitir que un ingrediente activo pase al interior de las semillas; un método que comprende mezclar una formulación sólida o líquida con semillas o recubrimiento en polvo, para de esta manera permitir que un ingrediente activo se fije
15 sobre la superficie de las semillas; un método que comprende mezclar un ingrediente activo con un vehículo adhesivo tal como una resina o polímero y luego recubrir las semillas con el producto resultante y un método de aplicar el agente alrededor de las semillas al mismo tiempo que la plantación.

20 El término "semilla" que se somete a los tratamientos de semilla anteriores significa un cuerpo vegetal que está en la etapa inicial de cultivo para la reproducción de plantas. Ejemplos de esta semilla pueden incluir una semilla, un bulbo, un tubérculo, un tubérculo de
25 semilla, una yema, un propágulo, un bulbillo y un cuerpo

vegetal usado para reproducción vegetativa en cultivo de corte.

El término "suelo" o "portador de cultivo" para plantas en el caso de aplicar el método de uso de la presente
5 invención significa un medio de soporte para el cultivo de plantas, y particularmente, un medio de soporte en el cual se dejen extender las raíces de las plantas. El material del suelo o portador de cultivo no está limitado específicamente, siempre y cuando puedan crecer plantas sobre el mismo. Así,
10 este suelo o portador de cultivo puede ser lo que se llama suelo o tierra, una estera de plantación en elevación, agua o similares. Ejemplos de un material específico pueden incluir arena, pómez, vermiculita, diatomita, agar, una sustancia gelatinosa, un polímero, una lana de roca, una lana de
15 vidrio, una viruta de madera y una corteza.

Ejemplos de un método para aplicar el agente a los tallos u hojas de plantas, plagas de insectos en granos almacenados, plagas de insectos domésticas, plagas de insectos sanitarias, plagas de insectos de bosque o
20 similares, pueden incluir: un método que comprende diluir una formulación líquida tal como una emulsión o fluible o una formulación sólida tal como un polvo humectante o gránulo dispersable en agua con agua, según sea adecuado, y luego aplicar la solución obtenida al objetivo, un método de
25 aplicar un polvo y fumigación.

Ejemplos de un método de aplicar el agente al suelo pueden incluir: un método que comprende diluir o no diluir una formulación líquida y luego aplicar la solución obtenida a la porción inferior de un cuerpo vegetal o un lecho de vivero para desarrollar plántulas; un método que comprende aplicar un gránulo a la porción inferior de un cuerpo vegetal o a un lecho de vivero para desarrollar plántulas; un método que comprende aplicar el agente que está en forma de un polvo, un polvo humectante, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar, al suelo antes de la siembra o transplante, para mezclar así el agente en el suelo como un todo y un método que comprende aplicar el agente que está en forma de polvo, un polvo humectante, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar, a cavidades o surcos de plantado antes de la siembra o plantación de cuerpos vegetales.

Con respecto a un método de aplicar el agente a una caja de vivero usada para arroz con cáscara, una formulación puede ser diferente dependiendo del periodo de aplicación del agente, tal como aplicación durante la siembra, aplicación durante el periodo de reverdecimiento o aplicación durante el transplante. El agente se puede aplicar en una formulación tal como un polvo, un gránulo dispersable en agua o un gránulo. El agente también se puede aplicar al mezclarlo con moldeado. Se puede aplicar el mezclado del moldeado con un

polvo, un gránulo dispersable en agua o un gránulo. Por ejemplo, el agente puede mezclarse en suelo del lecho de semillas, suelo de cubierta o el moldeado como un todo. El agente puede aplicarse simplemente al colocar el moldeado y
5 varios tipos de formulaciones de manera alternante en una forma de capa.

Como un método para aplicar el agente al cultivo de arroz, el agente que está en formulación sólida, tal como una formulación gigante, una formulación de empaque, un gránulo o
10 un gránulo dispersable en agua, o la formulación que está en una forma líquida, tal como un material fluible o una emulsión, se aplica generalmente en el cultivo de arroz relleno con agua. Además, durante el periodo de plantación de arroz, el agente que está en una formulación adecuada
15 puede aplicarse a o inyectarse en el suelo, directamente o después de haber sido mezclado con fertilizante. Más aún, el agente que está en forma de una emulsión o un material fluible se aplica a la fuente de suministro de agua al cultivo de arroz, tal como una espita de agua o equipo de
20 irrigación, para de esta manera aplicar el agente junto con el suministro de agua de una manera que ahorre trabajo.

Para cultivos de campo, el agente se puede aplicar a semillas o a un portador de cultivo que esté adyacente a cuerpos vegetales, durante los periodos de siembra y
25 crecimiento de plántulas. En el caso de plantas que sean

sembradas directamente en el campo, se prefiere la aplicación directa del agente a semillas, y la aplicación del agente a las porciones inferiores de las plantas durante el cultivo. Además, también son posibles un método de aplicar el agente
5 que está en una forma de gránulo y un método de aplicar el agente que ha sido diluido o no diluido con agua en un estado líquido. Se prefiere también un método que comprende mezclar el agente que está en una forma de gránulo con un portador de cultivo antes de la siembra y luego sembrar las semillas
10 sobre el portador.

Como un método para aplicar el agente durante la siembra y periodos de plantación y desarrollo de plantas de cultivo que serán transplantadas, se prefieren un método de aplicar directamente el agente a semillas, un método de
15 aplicar el agente que está en un estado líquido a un lecho de vivero para desarrollar plantas y un método de aplicar el agente que está en forma de gránulo. Además, también se prefieren un método de aplicar el agente que está en una forma de gránulo en cavidades de plantado durante la
20 plantación fija, y un método de mezclar el agente con un portador de cultivo alrededor del lugar al cual serán transplantadas las plantas.

El insecticida agrohortícola de la presente invención se prepara generalmente en formulaciones adecuadas
25 de acuerdo con una manera convencional para la preparación de

agroquímicos.

Es decir, el derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I) y, opcionalmente, un adyuvante se mezclan con un vehículo inerte adecuado en una
5 proporción adecuada y se prepara en una formulación adecuada tal como un material fluible, emulsión, concentrado soluble, polvo humectante, gránulos, polvo, tabletas, empaque o similar a través de disolución, dispersión, suspensión, mezclado, impregnación, adsorción o adherencia.

10 El vehículo inerte que puede usarse en la presente invención puede ser ya sea sólido o líquido. Como un material que puede usarse como el portador sólido, se pueden ejemplificar harina de soya, harina de cereal, harina de madera, harina de corteza, aserrín, tallos de tabaco en
15 polvo, cáscaras de nuez en polvo, salvado, celulosa en polvo, residuo de extracción de vegetales, polímeros o resinas sintéticos en polvo, arcillas (por ejemplo caolín, bentonita y arcilla ácida), talcos (por ejemplo talco y pirofilita), polvos o escamas de sílice (por ejemplo tierra diatomácea,
20 arena de sílice, mica y carbón blanco [ácido silícico sintético y de alta dispersión, también llamado sílice hidratada finamente dividida o ácido silícico hidratado, algunos de los productos disponibles comercialmente contienen silicato de calcio como el componente principal]), carbón
25 activado, azufre en polvo, pómez, tierra diatomácea

calcinada, ladrillo molido, cenizas volátiles, arena, carbonato de calcio, fosfato de calcio y otros polvos inorgánicos o minerales, portadores plásticos tales como polietileno, polipropileno, cloruro de polivinilideno y
5 similares, fertilizantes químicos (por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio) y composta. Estos portadores pueden usarse solos o como una mezcla de los mismos.

Un material que puede usarse como el vehículo
10 líquido se selecciona de materiales que tienen solubilidad en ellos mismos o los cuales están fuera de esta solubilidad pero son capaces de dispersar un ingrediente activo con la ayuda de un adyuvante. Los siguientes son ejemplos típicos del vehículo líquido y pueden usarse solos o como una mezcla
15 de los mismos: agua, alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol y etilenglicol), cetonas (por ejemplo acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, diisobutilcetona y ciclohexanona), éteres (por ejemplo éter etílico, dioxano, Cellosolve, éter diisopropílico y
20 tetrahidrofurano), hidrocarburo alifático (por ejemplo, queroseno y aceites minerales), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, solvente nafta y alquilnaftalenos), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y
25 clorobenceno), ésteres (por ejemplo acetato de etilo, ftalato

de diisopropilo, ftalato de dibutilo y ftalato de dioctilo), amidas (por ejemplo, dimetilformamida, dietilformamida y dimetilacetamida), nitrilos (por ejemplo acetonitrilo) y sulfóxido de dimetilo.

5 Los siguientes son ejemplos típicos del adyuvante, los cuales se usan dependiendo de propósitos y se usan solos o en combinación en algunos casos, o no se tienen que usar en absoluto.

 Para emulsionar, dispersar, disolver y/o humedecer
10 un compuesto como ingrediente activo, se puede usar un agente tensioactivo. Como el agente tensioactivo, se pueden ejemplificar éteres alquílicos de polioxietileno, éteres alquilarílicos de polioxietileno, ésteres de ácidos grasos superiores de polioxietileno, resonatos de polioxietileno,
15 monolauratos de polioxietilensoribtan, monooleato de polioxietilensorbitan, alquilarilsulfonatos, productos de condensación de ácido naftalensulfónico, ligninsulfonatos y sulfato de alcohol superior.

 Además, para estabilizar la dispersión de un
20 compuesto como ingrediente activo, adherirlo y/o unirlo, los adyuvantes ejemplificados abajo también se pueden usar, en particular, también se pueden usar adyuvantes tales como caseína, gelatina, almidón, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, goma arábica, alcoholes polivinílicos,
25 aguarrás, aceite de salvado, bentonita y ligninsulfonatos.

Para mejorar la capacidad de flujo de un producto sólido, se pueden usar los siguientes adyuvantes, en particular, se pueden usar adyuvantes tales como ceras, estearatos, fosfatos de alquilo, etc.

5 Los adyuvantes tales como productos de condensación de ácido naftalensulfónico y policondensados de fosfatos pueden usarse como un aditivo peptizante para productos dispersables, y adyuvantes tales como aceites de silicón se pueden usar también como un agente que desespumante.

10 Adyuvantes tales como 1,2-bencisotiazolin-3-ona, 4-cloro-3,5-xilenol, p-hidroxibenzoato de butilo pueden añadirse también como un conservador.

Además, si es necesario, agentes de esparcimiento funcionales, sinergistas tales como inhibidores metabólicos
15 como butóxido de piperonilo, agentes anti-congelamiento tales como propilenglicol, antioxidantes tales como BHT, absorbedores de ultravioleta y similares pueden también añadirse.

El contenido del compuesto como ingrediente activo
20 puede ser variado según se requiera, y el compuesto como ingrediente activo puede usarse en una proporción seleccionada adecuadamente en la escala de 0.01 a 90 partes en peso por 100 partes del insecticida agrohortícola. Por ejemplo, en polvos, gránulos, emulsión o polvo humectante, el
25 contenido adecuado del compuesto como ingrediente activo es

de 0.01 a 50% en peso.

El insecticida agrohortícola de la presente invención se usa para controlar una variedad de plagas de insectos en la siguiente manera: se aplica un cultivo en el
5 cual se espera que aparezcan las plagas de insectos, o a un sitio en el que la aparición o crecimiento de las plagas de insectos sea indeseable, como tal o después de haber sido diluido adecuadamente con o suspendido en agua o similar, en una cantidad efectiva para controlar las plagas de insectos.

10 La dosis de aplicación del insecticida agrohortícola de la presente invención es variada dependiendo de factores diferentes tales como un propósito, plagas de insecto que serán controladas, un estado de crecimiento de una planta, tendencia de aparición de plagas de insectos,
15 clima, condiciones ambientales, una forma de preparación, un método de aplicación, un sitio de aplicación y momento de aplicación. Se puede seleccionar adecuadamente en la escala de 0.001 g a 10 kg, de preferencia 0.01 g a 1 kg, (en términos del compuesto como ingrediente activo) por 10 áreas
20 dependiendo de los propósitos.

El insecticida agrohortícola de la presente invención se puede usar mezclado con otros insecticidas agrohortícolas, acaricidas, nematocidas, funguicidas, plaguicidas bióticos o similares para expandir así tanto el
25 espectro de especies de plagas de insectos controlables como

el periodo de tiempo cuando la aplicación efectiva sea posible o para reducir la dosis. Además, el insecticida agrohortícola de la presente invención se puede usar mezclado con herbicidas, reguladores de crecimiento de plantas, fertilizantes o similares, dependiendo de las situaciones de aplicación.

Como los demás insecticidas agrohortícolas, acaricidas y nematocidas, los cuales se usan para el propósito anterior, se pueden ejemplificar insecticidas, acaricidas y nematocidas agrohortícolas, tales como Etion, Triclorfon, Metamidofos, Acefato, Diclorvos, Mevinfos, Monocrotofos, Malation, Dimetoato, Formotion, Mecarbam, Vamidotion, Tiometon, Disulfoton, Oxideprofos, Naled, Metilparation, Fenitrothion, Cianofos, Propafos, Fention, Protiofos, Profenofos, Isofenfos, Temefos, Fentoato, Dimetilvinfos, Clorfenvinfos, Teraclorvinfos, Foxim, Isoxation, Piraclofos, Metidation, Clorpirifos, Clorpirifosmetilo, Piridafention, Diazinon, Pirimifosmetilo, Fosadona, Fosmet, Dioxabenzofos, Quinalfos, Terbufos, Etoprofos, Cadusafos, Mesulfenfos, DPS (NK-0795), Fosfocarb, Fenamifos, Isoamidofos, Fosthiazato, Isazofos, Etoprofos, Fention, Fostietano, Diclofention, Tionazin, Sulprofos, Fensulfotion, Diamidafos, Piretrin, Alletrin, Pralletrin, Resmetrrin, Permetrin, Teflutrín, Bifentrin, Fenpropatrin, Cipermetrrin, α -Cipermetrin, Cihalotrin, λ -Cihalotrin, Deltametrin,

Acrinatrín, Fenvalerato, Esfenvalerato, Cicloprotrín,
 Etofenprox, Halfenprox, Silafluofen, flucitrínato,
 Fluvalínato, Mehomil, Oxamíl, Tiodicarb, Aldicarb, Alanicarb,
 Cartap, Metolcarb, Xililcarb, Propoxur, Fenoxicarb,
 5 Fenobucarb, Etifencarb, Fenotiocarb, Bifenazato, Carbaril,
 Pirimicarb, Carbofuran, Carbosulfan, Furatiocarb, Benfuracab,
 Aldoxicarb, Diafentiuron, Diflubenzuron, Teflubenzuron,
 Hexaflumuron, Novaluron, Lufenuron, Flufenoxuron,
 Clorfluazuron, óxido de Fenbutatín, hidróxido de
 10 triciclohexiltín, oleato de sodio, oleato de potasio,
 Metopreno, Hidropreno, Binapacril, Amitraz, Dicofol, Kersen,
 Crorobencilato, Bromopropilato, Tetradifon, Bensultap,
 Benzoximato, Tebufenozida, Metoxifenozida, Piridalilo,
 Cromafenozida, Propargita, Acequinosil, Endosulfan,
 15 Diofenolan, Clorfenapil, Fenpiroximato, Tolfenpirad,
 Fipronil, Tebufenpirad, Triazamato, Etoxazol, Hexitiazox,
 sulfato de nicotina, Nitenpiram, Acetamiprid, Tiacloprid,
 Imidacloprid, Tiametoxam, Clotianidín, Dinotefuran,
 Fluazinam, Piriproxifen, Hidrametilnon, Pirimidifen,
 20 Piridaben, Ciromazin, TPIC (isocianurato de tripropilo),
 Pimetrozin, Clofentezin, Buprofezin, Tiociclam, Fenazaquin,
 Quinometionato, Indoxacarb, complejos de Polinactín,
 Milbemectín, Abamectín, Enamectín-benzoato, Spinosad, BT
 (*Bacillus thuringiensis*), Azadirachtín, Rotenona, almidón de
 25 hidroxipropilo, clorhidrato de Levamisol, Metam-sodio,

tartrato de Morantel, Dazomet, Triclamida, *Pasteuria penetrans*, *Monacrosporium-phymatophagum*, etc.

Como los funguicidas agrohortícolas usados para el mismo propósito que el anterior, se pueden ejemplificar

5 funguicidas agrohortícolas tales como azufre, azufre de caliza, sulfato de cobre básico, Iprobenfos, Edifenfos, Tolclofos-metilo, Tiram, Policarbamato, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Tiofanato, Tiofanato metilo, Benomilo, acetato de Iminoctadin, albecilato de Iminocutadin, Mepronil,

10 Flutolanil, Pencicuron, Furametpil, Tifluzamida, Metalaxil, Oxadixil, Carpropamid, Diclofluanid, Flusulfamida, Clorotalonil, Kresoxim-metilo, Fenoxanil, Himexazo, Etridiazol, Fluoroimida, Procimidona, Vinclozolin, Iprodiona, Triadimefon, Triflumizol, Bitertanol, Ipconazol, Fluconazol,

15 Propiconazol, difenoconazol, Miclobutanil, Tetraconazol, Hexaconazol, Tebuconazol, Imibenconazol, Procloraz, Pefurazoato, Ciproconazol, Isoprothiolano, Fenarimol, Pirimetanil, Mepanipirim, Piifenox, Fluazinam, Triforina, Diclomezina, Azoxistrobin, Trifloxistrobin, Orisastrobin,

20 Tiadiazin, Captan, Tiadinil, Probenazol, Acibenzolar-S-metilo (CGA-245704), Ftalida, Triciclazol, Piroquilon, Quinometionat, ácido oxolínico, Ditianon, Ciazofamid, Diclocimet, Kasugamicina, Validamicina, Polioxina, Blasticidina, Estreptomicina, etc.

25 De manera similar, como los herbicidas, se pueden

- ejemplificar herbicidas tales como Glifosato, Sulfosato, Glifosinato, Bialafos, Butamifos, Esprocarb, Prosulcarb, Bentiocarb, Piributicarb, Asulam, Linulon, Dimron, Isouron, Bensulfuron metilo, Ciclosulfamuron, Cinosulfuron,
- 5 Pirazosulfuron etilo, Azimsulfuron, Imazosulfuron, Tenilclor, Alaclor, Pretilaclor, Clomeprop, Eobenzanid, Mefenacet, Flufenacet, Fentrazamida, Pendimetalin, Bifenox, Acifluorfen, Lactfen, Cihalofof-butilo, Ioxinilo, Bromobutida, Aloxidim, Setoxidim, Napropamida, Indanofan, Pirazolato, Benzofenap,
- 10 Piraflufen-etilo, Imazapil, Sulfentrazona, Cafenstrol, Bentoxazon, Oxadiazon, Paraquat, Diquat, Piriminobac, Simazina, Atrazina, Dimetametrin, Triaziflam, Benfuresato, Flutiacet-metilo, Quizalofo-etilo, Bentazona, Oxaziclomefona, Azafenidin, Benzobiciclon, peróxido de calcio, etc.
- 15 En cuanto a los plaguicidas bióticos, el mismo efecto que el anterior se puede esperar usando el insecticida agrohortícola de la presente invención mezclado con, por ejemplo, formulaciones virales obtenidas a partir de virus de la poliedrosis nuclear (NPV), virus de la granulosis (GV),
- 20 virus de la poliedrosis citoplásmica (CPV), virus entomopox (EPV), etc.; plaguicidas microbianos utilizados como insecticidas o nematocidas, tales como *Monocrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai*, *Pasteuria penetrans*, etc.; plaguicidas microbianos utilizados
- 25 como funguicidas, tales como *Trichoderma lignorum*,

Agrobacterium radiobactor, *Erwinia carotovora* no patógeno, *Bacillus subtilis*, etc. y plaguicidas bióticos utilizados como herbicidas, tales como *Xanthomonas campestris*, etc.

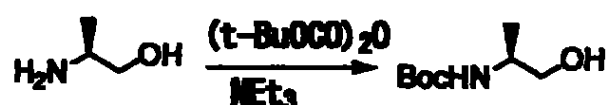
Además, el insecticida agrohortícola de la presente
5 invención se puede usar en combinación con plaguicidas bióticos incluyendo enemigos naturales tales como avispa parasítica (*Encarsia formosa*), avispa parasítica (*Aphidius colemani*), mosca de la agalla (*Aphidoletes aphidimyza*), avispa parasítica (*Diglyphus isaea*), ácaro parasítico
10 (*Dacnusa sibirica*), ácaro predador (*Phytoseiulus persimilis*), ácaro predador (*Amblyseius cucumeris*), bicho predador (*Orius sauteri*), etc.; plaguicidas microbianos tales como *Beauveria brongniartii*, etc. y feromonas tales como acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo,
15 acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona, (Z)-13-icosen-10-ona, 14-metil-1-octadeceno, etc.

Ejemplos

20 La presente invención se describirá más en los siguientes ejemplos representativos. Sin embargo, estos ejemplos no están diseñados para limitar el alcance de la presente invención.

Ejempl 1Producción de (S)-3-yodo-N¹-(2-metil-4-trifluorometoxifenil)-
N²-(1-metil-2-metiltioetil)ftalimida (compuesto No. I-42)

(1-1) Producción de (S)-(2-hidroxi-1-
5 metietil)carbamato de t-butilo

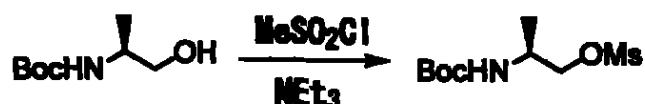


Se añadieron 13.8 g de trietilamina a 100 ml de
10 tetrahidrofurano que contenía 10.0 g (133 mmoles) de L-
alaninol. Posteriormente, 30.0 g (137 mmoles) de dicarbonato
de di-t-butilo se añadieron por goteo a la mezcla obtenida
mientras se enfriaba en agua helada. La temperatura de la
solución de reacción se regresó a la temperatura ambiente, y
15 después se agitó durante 12 horas. Posteriormente, la
solución de reacción se vertió en agua helada, seguida por
extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se secó
sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo
presión reducida, para obtener así 24.0 g de (S)-(2-hidroxi-
20 1-metietil)carbamato de t-butilo.

Rendimiento: Cuantitativo

Propiedades físicas: [¹H-RMN, CDCl₃, δ (ppm)] 4.62
(br, 1H), 3.77 (br, 1H), 3.64 (br, 1H), 3.49 (br, 1H), 2.54
(br, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.14 (d, 3H).

(1-2) Producción de metansulfonato de (S)-2-(t-butoxicarbonilamino)propilo



5

Se añadieron 14.5 g (144 mmoles) de trietilamina a 180 ml de una solución de tetrahidrofurano que contenía 24.0 g (137 mmoles) de (S)-(2-hidroxi-1-metileti)carbamato de t-butilo. Posteriormente, 16.4 g (143 mmoels) de cloruro de metansulfonilo se añadieron por goteo a la mezcla obtenida mientras se enfriaba en agua helada. La temperatura de la solución de reacción se regresó a la temperatura ambiente, y luego se agitó durante 5 horas. Posteriormente la solución de reacción se vertió en agua, seguida por extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada acuosa de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El producto resultante se concentró después bajo presión reducida, para obtener así 34.0 g de metnsulfonato de (S)-2-(t-butoxicarbonilamino)propilo.

20

Rendimiento: 98.1%

Propiedades físicas: [^1H -RMN, CDCl_3 , δ (ppm)] 4.61 (br, 1H), 4.22(dd, 1H), 4.14(dd, 1H), 3.96(br, 1H), 3.03(s, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.23(d, 3H).

25

(1-3) Producción de (S)-(1-metil-2-metiltioetil)carbamato de t-butilo



5

Se añadieron 34.0 g (134 mmoles) de metansulfonato de (S)-2-(t-butoxicarbonilamino)propilo a 100 ml de una solución de etanol que contenía 73.0 g (156 mmoles) de una solución acuosa de metilmercaptano de sodio (15%).

- 10 Posteriormente, la mezcla obtenida se calentó a reflujo durante 5 horas. La temperatura de la solución de reacción se regresó a la temperatura ambiente y después se concentró bajo presión reducida para eliminar etanol. Después, se añadió agua al residuo, seguida por la extracción con acetato
- 15 de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida para obtener así 21.0 g de (S)-(1-metil-2-metiltioetil)carbamato de t-butilo.

Rendimiento: 76.4%

- 20 Propiedades físicas: [^1H -RMN, CDCl_3 , δ (ppm)] 4.59 (br, 1H), 3.84 (br, 1H), 2.65 (dd, 1H), 2.54 (dd, 1H), 2.14 (s, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.21 (d, 3H).

25

(1-4) Producción de (S)-1-metil-2-metiltioetilamina

5 Se añadieron por goteo 32.0 g de ácido clorhídrico concentrado (35%) a 150 ml de una solución de acetato de etilo que contenía 21.0 g (102 mmoles) de (S)-(1-metil-2-metiltioetil)carbamato de t-butilo. La mezcla obtenida se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Posteriormente

10 se añadió agua a la solución de reacción, seguida por lavado con acetato de etilo. La capa de agua se convirtió para ser básica con la adición de hidróxido de sodio, y luego se extrajo con éter metílico de t-butilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró

15 bajo presión reducida, para obtener así 5.5 g de (S)-1-metil-2-metiltioetilamina.

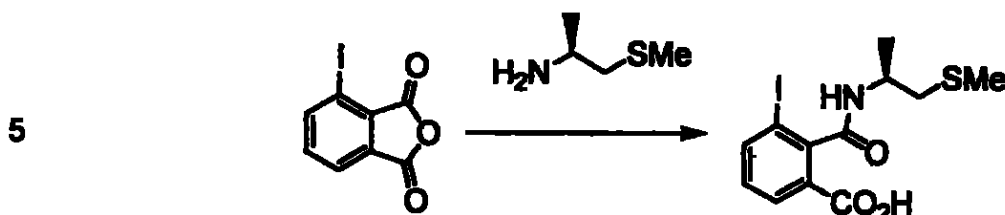
Rendimiento: 51.4%

Propiedades físicas: [^1H -RMN, CDCl_3 , δ (ppm)]

4.90(br, 2H), 3.07(m, 1H), 2.58(dd, 1H), 2.36(dd, 1H),

20 2.10(s, 3H), 1.15(d, 3H).

(1-5) Producción de ácido (S)-3-yodo-N-(1-metil-2-metiltioetil)ftalámico

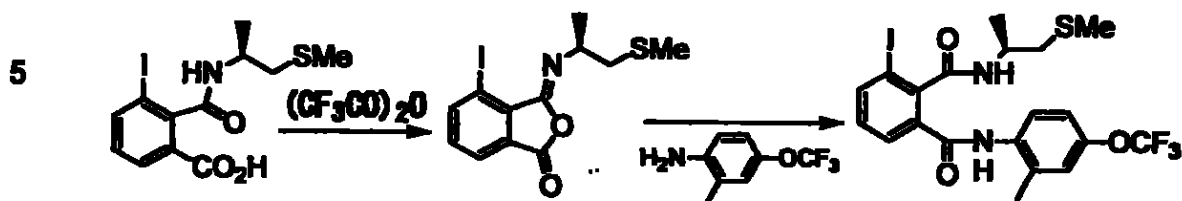


Cincuenta mililitros de una solución de acetonitrilo que contenía 5.5 g (52.4 mmoles) de (S)-1-metil-2-metiltioetilamina se añadieron por goteo a 150 ml de una solución de acetonitrilo que contenía 14.4 g (52.6 mmoles) de anhídrido 3-yodoftálico a una velocidad lenta. La mezcla obtenida se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Posteriormente, los cristales precipitados se filtraron y luego se lavaron con acetonitrilo, para obtener así 7.0 g de ácido (S)-3-yodo-N-(1-metil-2-metiltioetil)ftalámico.

Rendimiento: 35.2%

Propiedades físicas: [^1H -RMN, CDCl_3 , δ (ppm)]
 8.01(dd, 2H), 7.15(t, 1H), 6.00(d, 1H), 4.43(m, 1H), 2.88(dd, 1H), 2.68(dd, 1H), 2.17(s, 3H), 1.37(d, 3H).

(1-6) Producción de (S)-3-yodo-N¹-(2-metil-4-trifluorometoxifenil)-N²-(1-metil-2-metiltioetil)ftalamida
(compuesto No. I-42)



Se añadieron 0.67 g (3.2 mmoles) de un anhídrido trifluoroacético a 8 ml de una suspensión en éter t-butilmetílico que contenía 0.8 g (2.1 mmoles) de ácido (S)-3-yodo-N-(1-metil-2-metiltioetil)ftalámico. La mezcla obtenida se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después la solución de reacción se vertió lentamente en agua helada en la cual habían sido disueltos 0.88 g (6.4 mmoles) de carbonato de potasio, seguida por

15 extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El producto resultante se concentró después bajo presión reducida para obtener así una isoimina cruda. El producto crudo se disolvió después en 10

20 ml de acetonitrilo. Posteriormente se añadieron 0.40 g (2.2 mmoles) de 2-metil-4-trifluorometoxianilina y 2 gotas de ácido trifluoroacético a la solución de reacción, y la mezcla obtenida se agitó después a temperatura ambiente durante 12 horas. Los cristales precipitados se filtraron y luego se

25 lavaron con acetonitrilo, para obtener así 1.0 g de (S)-3-yodo-N¹-(2-

metil-4-trifluorometoxifenil)-N²-(1-metil-2-metiltioetil)ftalamida.

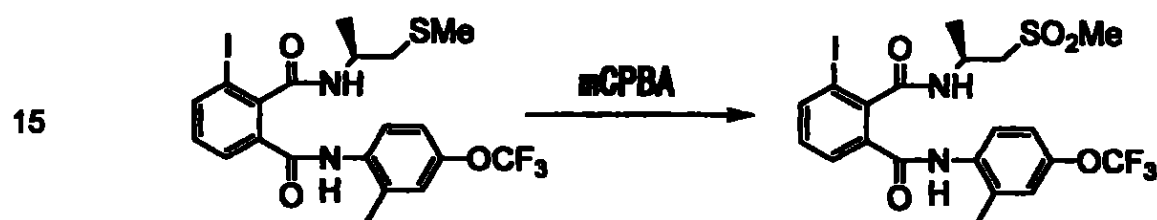
Rendimiento: 88.2%

Propiedades físicas: [¹H-RMN, CDCl₃, δ (ppm)]
 8.32(br, 1H), 8.13(d, 1H), 7.97(d, 1H), 7.79(d, 1H), 7.22(t,
 5 1H), 7.08(d, 1H), 7.06(s, 1H), 6.20(d, 1H), 4.33(m, 1H),
 2.60(m, 2H), 2.33(s, 3H), 1.96(s, 3H), 1.27(d, 3H).

Rotación específica: [α]_D²⁰ = +2.61° (c=1.04, CHCl₃).

Ejemplo 2

10 Producción de (S)-3-yodo-N¹-(2-metil-4-trifluorometoxifenil)-
N²-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida (compuesto No. I-
44)



Mientras se enfriaba en agua helada, 0.40 g (2.3
 mmoles) de ácido m-cloroperbenzoico se añadieron a 10 ml de una
 20 solución de cloroformo que contenía 0.38 g (0.70 mmoles) de (S)-3-yodo-
 N¹-(2-metil-4-trifluorometoxifenil)-N²-(1-metil-2-
 metiltioetil)ftalamida. La mezcla obtenida se agitó a temperatura
 ambiente durante 3 horas. Posteriormente se añadió a la
 solución de reacción una solución acuosa de carbonato de
 25 potasio, seguida por extracción con cloroformo. La capa

orgánica se lavó con una solución acuosa de sulfito de sodio y luego se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El producto resultante se concentró después bajo presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna con gel de sílice, para obtener así
5 0.26 g de (S)-3-yodo-N¹-(2-metil-4-trifluorometoxifenil)-N²-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida.

Rendimiento: 64.9%

Propiedades físicas: [¹H-RMN, CDCl₃, δ (ppm)] 8.07(br, 1H), 7.97(m, 2H), 7.70(d, 1H), 7.21(t, 1H), 7.70(m, 2H), 6.64(d, 1H), 4.61(m, 1H),
10 3.37(dd, 1H), 3.17(dd, 1H), 2.78(s, 3H), 2.32(s, 3H), 1.51(d, 3H).

Rotación específica: [α]_D²⁰ = +3.80° (c=1.03, CHCl₃).

Compuestos representativos como compuestos de ftalimida ópticamente activos representados por la fórmula (I) de la presente
15 invención, los cuales pueden producirse de la misma manera que en los ejemplos, se muestran en las Tablas 1 a 3. Sin embargo, la presente invención no está limitada a estos compuestos. En las tablas, el término "propiedades físicas" significa un punto de fusión o logP. El símbolo "Me" representa un grupo metilo, "Et" representa un grupo
20 etilo, "Pr" representa un grupo propilo, "-n" representa normal y "-i" representa iso.

En la Tabla 4, se muestran los datos de RMN y rotación específica con respecto a algunos compuestos, las propiedades físicas de los cuales no se describen en las
25 Tablas 1 a 3.

Fórmula (I-3)

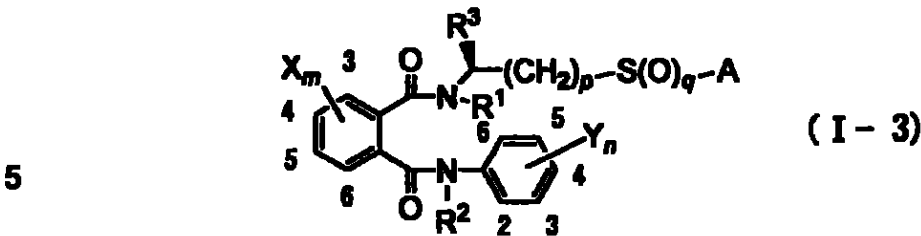


Tabla 1 (R¹=R²=H, R³=Me, p=1)

	No.	X _m	A	q	Y _n	Propiedades físicas Punto de fusión (°C)
10	1-1	3-I	Me	0	4-CF(CF ₃) ₂	138
	1-2	3-I	Me	1	4-CF(CF ₃) ₂	
	1-3	3-I	Me	2	4-CF(CF ₃) ₂	
	1-4	3-I	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-5	3-I	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	110-129
	1-6	3-I	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-7	3-I	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-8	3-I	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
15	1-9	3-I	Pr-n	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	103-108
	1-10	3-I	Pr-n	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-11	3-I	Pr-n	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-12	3-I	Pr-i	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-13	3-I	Pr-i	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	112-115
	1-14	3-I	Pr-i	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-15	3-I	Me	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-16	3-I	Me	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
20	1-17	3-I	Me	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	109-131
	1-18	3-I	Me	0	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-19	3-I	Me	1	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-20	3-I	Me	2	2-OMe-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-21	3-I	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	87-92
	1-22	3-I	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-23	3-I	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-24	3-I	Et	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
25	1-25	3-I	Et	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	85-88

Tabla 1 (continuación)

	No.	Xm	A	q	Yn	Propiedades físicas Punto de fusión (°C)
5	1-26	3-I	Et	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	Amórfo
	1-27	3-I	Pr-i	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-28	3-I	Pr-i	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-29	3-I	Pr-i	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-30	3-I	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
10	1-31	3-I	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	90-95
	1-32	3-I	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	203-215
	1-33	3-I	Me	0	2-Me-4-CF ₃	
	1-34	3-I	Me	1	2-Me-4-CF ₃	
	1-35	3-I	Me	2	2-Me-4-CF ₃	
15	1-36	3-I	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	198-202
	1-37	3-I	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	
	1-38	3-I	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	
	1-39	3-I	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	
	1-40	3-I	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	
20	1-41	3-I	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	197-206
	1-42	3-I	Me	0	2-Me-4-OCF ₃	
	1-43	3-I	Me	1	2-Me-4-OCF ₃	
	1-44	3-I	Me	2	2-Me-4-OCF ₃	
	1-45	3-I	Et	0	2-Me-4-OCF ₃	
25	1-46	3-I	Et	1	2-Me-4-OCF ₃	179-180
	1-47	3-I	Et	2	2-Me-4-OCF ₃	
	1-48	3-I	Me	0	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-49	3-I	Me	1	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-50	3-I	Me	2	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-51	3-I	Et	0	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-52	3-I	Et	1	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-53	3-I	Et	2	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-54	3-I	Me	0	2-Br-4-OCF ₃	
	1-55	3-I	Me	1	2-Br-4-OCF ₃	
	1-56	3-I	Me	2	2-Br-4-OCF ₃	
	1-57	3-I	Et	0	2-Br-4-OCF ₃	
	1-58	3-I	Et	1	2-Br-4-OCF ₃	
	1-59	3-I	Et	2	2-Br-4-OCF ₃	
	1-60	3-I	Me	0	2-Cl-3,4-(-CF ₂ OCF ₂ O-)	
	1-61	3-I	Me	1	2-Cl-3,4-(-CF ₂ OCF ₂ O-)	
	1-62	3-I	Me	2	2-Cl-3,4-(-CF ₂ OCF ₂ O-)	

Tabla 1 (continuación)

	No.	Xm	A	q	Yn	Propiedades físicas Punto de fusión (°C)
5	1-63	3-I	Me	0	2,4-Cl ₂	
	1-64	3-I	Me	1	2,4-Cl ₂	151-159
	1-65	3-I	Me	2	2,4-Cl ₂	
	1-66	3-I	Me	0	2,3,4-Cl ₃	203-205
	1-67	3-I	Me	1	2,3,4-Cl ₃	
10	1-68	3-I	Me	2	2,3,4-Cl ₃	212-213
	1-69	3-I	Me	0	2-Cl-4-CF ₃	
	1-70	3-I	Me	1	2-Cl-4-CF ₃	
	1-71	3-I	Me	2	2-Cl-4-CF ₃	
	1-72	3-Br	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-73	3-Br	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	123-132
	1-74	3-Br	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-75	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-76	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	74-96
	1-77	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
15	1-78	3-F	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-79	3-F	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	160
	1-80	3-F	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-81	3-F	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-82	3-F	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	93-103
	1-83	3-F	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-84	3-NO ₂	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-85	3-NO ₂	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	191-194
	1-86	3-NO ₂	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-87	H	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
20	1-88	H	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	93-104
	1-89	H	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-90	3-OCF ₃	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-91	3-OCF ₃	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-92	3-OCF ₃	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-93	3,4-Cl ₂	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-94	3,4-Cl ₂	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-95	3,4-Cl ₂	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-96	3-I	Et	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-97	3-I	Et	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-98	3-I	Et	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-99	3-I	Me	0	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	

Tabla 1 (continuación)

No.	Xm	A	q	Yn	Propiedades físicas logP (pH2.3)
1-100	3-I	Me	1	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	
1-101	3-I	Me	2	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	
1-102	3-I	Et	0	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	
1-103	3-I	Et	1	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	
1-104	3-I	Et	2	2-Et-4-CH(CF ₃) ₂	
1-105	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.71
1-106	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.97
1-107	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.47
1-108	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.36
1-109	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	
1-110	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.15
1-111	3-I	Et	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.53
1-112	3-I	Et	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
1-113	3-I	Et	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.28
1-114	3-I	Et	0	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	4.28
1-115	3-I	Et	1	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	
1-116	3-I	Et	2	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	3.09
1-117	3-I	Et	0	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	4.26
1-118	3-I	Et	1	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	
1-119	3-I	Et	2	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	3.07
1-120	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-Br	3.65
1-121	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-Br	
1-122	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-Br	2.49
1-123	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-OCF ₃	3.90
1-124	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-OCF ₃	
1-125	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-OCF ₃	2.77
1-126	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₃	3.90
1-127	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₃	
1-128	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₃	2.74
1-129	3-I	Et	0	2-Me-3,4-Br ₂	3.89
1-130	3-I	Et	1	2-Me-3,4-Br ₂	
1-131	3-I	Et	2	2-Me-3,4-Br ₂	2.67
1-132	3-I	Et	0	2-Me-3-F-4-I	3.77
1-133	3-I	Et	1	2-Me-3-F-4-I	
1-134	3-I	Et	2	2-Me-3-F-4-I	2.59
1-135	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.03
1-136	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.50

Tabla 1 (continuación)

						Propiedades físicas
						logP (pH2.3)
No.	Xm	A	q	Yn		
5	1-137	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.97
	1-138	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-OCF ₃	3.59
	1-139	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-OCF ₃	
	1-140	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-OCF ₃	2.60
	1-141	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.41
	1-142	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.78
	1-143	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.27
	1-144	3-I	Me	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.20
	1-145	3-I	Me	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
	1-146	3-I	Me	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.10
10	1-147	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-Br	3.30
	1-148	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-Br	
	1-149	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-Br	2.29
	1-150	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-I	3.42
	1-151	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-I	
	1-152	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-I	2.40
	1-153	3-I	Me	0	2-Me-3,4-Br ₂	3.55
	1-154	3-I	Me	1	2-Me-3,4-Br ₂	
	1-155	3-I	Me	2	2-Me-3,4-Br ₂	2.49
	1-156	3-I	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₃	3.58
15	1-157	3-I	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₃	
	1-158	3-I	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₃	
	1-159	3-I	Et	0	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	4.41
	1-160	3-I	Et	1	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	
	1-161	3-I	Et	2	2,3-Cl ₂ -4-OCF ₃	3.18
	1-162	3-I	Et	0	2-Cl-3-Br-4-OCF ₃	4.42
	1-163	3-I	Et	1	2-Cl-3-Br-4-OCF ₃	
	1-164	3-I	Et	2	2-Cl-3-Br-4-OCF ₃	3.19
	1-165	3-Br	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.93
	1-166	3-Br	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.42
20	1-167	3-Br	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.86
	1-168	3-Br	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.31
	1-169	3-Br	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.72
	1-170	3-Br	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.21
	1-171	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.26
	1-172	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.59
	1-173	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.06

Tabla 1 (continuación)

						Propiedades físicas
						logP (pH2.3)
No.	Xm	A	q	Yn		
5	1-174	3-Br	Et	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.43
	1-175	3-Br	Et	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
	1-176	3-Br	Et	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.19
	1-177	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-Br	3.54
	1-178	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-Br	
	1-179	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-Br	2.39
	1-180	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₃	3.80
	1-181	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₃	
	1-182	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₃	2.66
	1-183	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-I	3.66
10	1-184	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-I	
	1-185	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-I	2.51
	1-186	3-Br	Et	0	2-Me-3,4-Br ₂	3.78
	1-187	3-Br	Et	1	2-Me-3,4-Br ₂	
	1-188	3-Br	Et	2	2-Me-3,4-Br ₂	2.59
	1-189	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-OCF ₃	3.81
	1-190	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-OCF ₃	
	1-191	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-OCF ₃	2.69
	1-192	3-Br	Et	0	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	4.16
	1-193	3-Br	Et	1	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	
15	1-194	3-Br	Et	2	2-Cl-4-OCF ₃ -5-F	2.96
	1-195	3-Br	Et	0	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	4.18
	1-196	3-Br	Et	1	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	
	1-197	3-Br	Et	2	2-Br-4-OCF ₃ -5-F	2.99
	1-198	3-Br	Et	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.63
	1-199	3-Br	Et	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.90
	1-200	3-Br	Et	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.39
	1-201	3-Cl	Et	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.54
	1-202	3-Cl	Et	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.86
	1-203	3-Cl	Et	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	3.34
20	1-204	3-Cl	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	4.23
	1-205	3-Cl	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	2.69
	1-206	3-Cl	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-207	3-Cl	Et	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	4.21
	1-208	3-Cl	Et	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.56
	1-209	3-Cl	Et	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.01
	1-210	3-Cl	Et	0	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	4.37

Tabla 1 (continuación)

	No.	Xm	A	q	Yn	Propiedades físicas
						Punto de fusión (°C) logP (pH2.3)
5	1-211	3-Cl	Et	1	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	
	1-212	3-Cl	Et	2	2-Me-3-Cl-4-CF ₂ CF ₃	3.14
	1-213	3-Cl	Me	0	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	3.88
	1-214	3-Cl	Me	1	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	
	1-215	3-Cl	Me	2	2-Me-3-F-4-CF ₂ CF ₃	2.82
10	1-216	3-Cl	Me	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	4.36
	1-217	3-Cl	Me	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-218	3-Cl	Me	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	3.26
	1-219	3-Br	Me	0	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	4.42
	1-220	3-Br	Me	1	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-221	3-Br	Me	2	2-Et-4-CF(CF ₃) ₂	3.31
	1-222	3-I	Me	0	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-223	3-I	Me	1	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-224	3-I	Me	2	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-225	3-I	Me	0	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂	
15	1-226	3-I	Me	1	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-227	3-I	Me	2	2-Br-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-228	3-I	Me	0	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-229	3-I	Me	1	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-230	3-I	Me	2	2-CN-4-CF(CF ₃) ₂	196-198
	1-231	3-I	Me	0	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-232	3-I	Me	1	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-233	3-I	Me	2	2-F-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-234	3-CH=CH- CH=CH-4	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-235	3-CH=CH- CH=CH-4	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
20	1-236	3-CH=CH- CH=CH-4	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-237	3-I	Me	0	2-I-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-238	3-I	Me	1	2-I-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-239	3-I	Me	2	2-I-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-240	3-Br	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-241	3-Br	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	133-144
	1-242	3-Br	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-243	3-Br	Et	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-244	3-Br	Et	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	205-209
25						

Tabla 1 (continuación)

						Propiedades físicas
						Punto de fusión (°C)
No.	Xm	A	q	Yn		
5	1-245	3-Br	Et	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	110-122
	1-246	3-Br	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-247	3-Br	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-248	3-Br	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-249	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
10	1-250	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	113-126
	1-251	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-252	3-Cl	Et	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-253	3-Cl	Et	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-254	3-Cl	Et	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
15	1-255	3-Cl	Et	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	121-129
	1-256	3-Cl	Et	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-257	3-Cl	Et	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	
	1-258	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-259	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
20	1-260	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-261	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-262	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-263	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-264	3-Cl	Me	0	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
25	1-265	3-Cl	Me	1	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-266	3-Cl	Me	2	2-Me-3-F-4-CF(CF ₃) ₂	
	1-267	3-Cl	Me	0	2-Me-4-OCF ₃	
	1-268	3-Cl	Me	1	2-Me-4-OCF ₃	
	1-269	3-Cl	Me	2	2-Me-4-OCF ₃	
	1-270	3-Cl	Me	0	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-271	3-Cl	Me	1	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-272	3-Cl	Me	2	2-Cl-4-OCF ₃	
	1-273	3-Cl	Me	0	2-Br-4-OCF ₃	
	1-274	3-Cl	Me	1	2-Br-4-OCF ₃	
	1-275	3-Cl	Me	2	2-Br-4-OCF ₃	
	1-276	3-I	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-277	3-I	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-278	3-I	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-279	3-I	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-280	3-I	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	
	1-281	3-I	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃)CF ₂ CF ₃	

Tabla 1 (continuación)

					Propiedades físicas
No.	Xm	A	q	Yn	Punto de fusión (°C)
1-282	3-I	Me	0	2-Me-4-O-(2-(3-Cl-5-CF ₃) piridil)	201-202
1-283	3-I	Me	1	2-Me-4-O-(2-(3-Cl-5-CF ₃) piridil)	
1-284	3-I	Me	2	2-Me-4-O-(2-(3-Cl-5-CF ₃) piridil)	
1-285	3-Cl	Me	0	2-Me-4-O-(2-(3-Cl-5-CF ₃) piridil)	
1-286	3-Cl	Me	1	2-Me-4-O-(2-(3-Cl-5-CF ₃) piridil)	
1-287	3-Cl	Me	2	2-Me-4-O-(2-(3-Cl-5-CF ₃) piridil)	140-143
1-288	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-289	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-290	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-291	3-Br	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-292	3-Br	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	197
1-293	3-Br	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-294	3-F	Me	0	2-Me-4-OCHF ₂	160-173
1-295	3-F	Me	1	2-Me-4-OCHF ₂	165-167
1-296	3-F	Me	2	2-Me-4-OCHF ₂	174-175
1-297	3-F	Me	0	2-Me-4-OCF ₃	177-179
1-298	3-F	Me	1	2-Me-4-OCF ₃	
1-299	3-F	Me	2	2-Me-4-OCF ₃	201-210
1-300	3-F	Me	0	2-Me-4-F	204-208
1-301	3-F	Me	1	2-Me-4-F	188-190
1-302	3-F	Me	2	2-Me-4-F	212-218
1-303	3-F	Me	0	2-F-3-CF ₃	201-206
1-304	3-F	Me	1	2-F-3-CF ₃	112-114
1-305	3-F	Me	2	2-F-3-CF ₃	165-172
1-306	3-F	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	166-177
1-307	3-F	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	148-158
1-308	3-F	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	75-82
1-309	3-F	Me	0	2,4-Cl ₂	121-125
1-310	3-F	Me	1	2,4-Cl ₂	70-77
					164

Tabla 1 (continuación)

	No.	Xm	A	q	Yn	Propiedades físicas Punto de fusión (°C)
5	1-311	3-F	Me	2	2,4-Cl ₂	195-199
	1-312	3-F	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	143-160
	1-313	3-F	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	197
	1-314	3-F	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	173-176
	1-315	3-F	Me	0	2-Cl-4-OCF ₃	140
10	1-316	3-F	Me	1	2-Cl-4-OCF ₃	161-162
	1-317	3-F	Me	2	2-Cl-4-OCF ₃	164-165
	1-318	3-F	Me	0	2-Me-4-Cl	183-185
	1-319	3-F	Me	1	2-Me-4-Cl	192-196
	1-320	3-F	Me	2	2-Me-4-Cl	210-211
	1-321	3-F	Me	0	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	141-142
	1-322	3-F	Me	1	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	166-168
	1-323	3-F	Me	2	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	203-206
	1-324	3-F	Me	0	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	182-184
	1-325	3-F	Me	1	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	191-208
15	1-326	3-F	Me	2	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	200-209
	1-327	3-CF ₃	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	211
	1-328	3-CF ₃	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	208-209
	1-329	3-CF ₃	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	238-243
	1-330	3-Cl	Me	0	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	95-98
	1-331	3-Cl	Me	1	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	128-132
	1-332	3-Cl	Me	2	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	95-97
	1-333	3-I	Me	0	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	156-158
	1-334	3-I	Me	1	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	117-121
	1-335	3-I	Me	2	2-Cl-3-CF(CF ₃)CF ₂ O-4	158-160
20	1-336	3-Cl	Me	0	2-Me-4-S-(2-(5-CF ₃)piridil)	130-132
	1-337	3-Cl	Me	1	2-Me-4-S-(2-(5-CF ₃)piridil)	
	1-338	3-Cl	Me	2	2-Me-4-S-(2-(5-CF ₃)piridil)	

Fórmula (I-4)

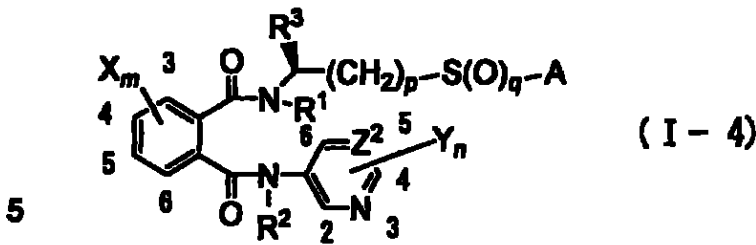


Tabla 3 (R¹=R²=H, R³=Me, p=1)

	No.	X _m	A	q	Y _n	Z ²	Propiedades físicas Punto de fusión (°C)
10	2-1	3-I	Me	0	4-CF(CF ₃) ₂	CH	91-96
	2-2	3-I	Me	1	4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-3	3-I	Me	2	4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-4	3-I	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-5	3-I	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-6	3-I	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-7	3-I	Me	0	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-8	3-I	Me	1	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
15	2-9	3-I	Me	2	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂	CH	186
	2-10	3-I	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
	2-11	3-I	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
	2-12	3-I	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
	2-13	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-14	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-15	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-16	3-F	Me	0	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
20	2-17	3-F	Me	1	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	99-104
	2-18	3-F	Me	2	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	CH	
	2-19	3-F	Me	0	2-Me-4-OCH(CF ₃) ₂	CH	
	2-20	3-F	Me	1	2-Me-4-OCH(CF ₃) ₂	CH	
	2-21	3-F	Me	2	2-Me-4-OCH(CF ₃) ₂	CH	
	2-22	3-F	Me	0	2,4-Cl ₂	CH	
	2-23	3-F	Me	1	2,4-Cl ₂	CH	
	2-24	3-F	Me	2	2,4-Cl ₂	CH	
25	2-25	3-F	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	138-148
	2-26	3-F	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
	2-27	3-F	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
	2-28	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	

Tabla 3 (continuación)

		No.	Xm	A	q	Yn	Z ²	Propiedades físicas
								Punto de fusión (°C)
								logP (pH2.3)
5		2-29	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	109-119
		2-30	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
		2-31	3-Br	Me	0	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
		2-32	3-Br	Me	1	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
		2-33	3-Br	Me	2	2-Me-4-CH(CF ₃) ₂	CH	
10		2-34	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₃	CH	2.76
		2-35	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₃	CH	
		2-36	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₃	CH	
		2-37	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	CH	3.33
		2-38	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	CH	
		2-39	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	CH	
		2-40	3-Cl	Me	0	2-Me-4-CF ₃	N	2.55
		2-41	3-Cl	Me	1	2-Me-4-CF ₃	N	
		2-42	3-Cl	Me	2	2-Me-4-CF ₃	N	
		2-43	3-Br	Me	0	2-Me-4-CF ₃	N	2.60
		2-44	3-Br	Me	1	2-Me-4-CF ₃	N	
		2-45	3-Br	Me	2	2-Me-4-CF ₃	N	
		2-46	3-I	Me	0	2-Me-4-CF ₃	N	2.70
		2-47	3-I	Me	1	2-Me-4-CF ₃	N	
		2-48	3-I	Me	2	2-Me-4-CF ₃	N	

15

20

25

Tabla 4

No.		Datos RMN ^1H -RMN[CDCl_3 /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica $[\alpha]_D^{25}$ (CHCl_3)
5	1-3		+32.50° (c=1.06)
	1-5	8.26 (d, 1H), 8.13 (br, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.59 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.73 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.52 (d, 3H)	-0.39° (c=1.03)
	1-6	8.48 (br, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.00 (dd, 1H), 7.82 (dd, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.13 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 2.64 (dd, 1H), 2.56 (dd, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.34 (m, 2H), 1.26 (d, 3H), 1.08 (t, 3H)	-4.26° (c=0.99)
	1-8	8.26 (d, 1H), 8.18 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.64 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.30 (dd, 1H), 3.08 (dd, 1H), 2.82 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.52 (d, 3H), 1.22 (t, 3H)	-4.48° (c=0.46)
10	1-9	8.47 (br, 1H), 8.40 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.15 (d, 1H), 4.31 (m, 1H), 2.59 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 2.44 (m, 2H), 1.25 (d, 3H), 0.87 (t, 3H)	-2.25° (c=1.01)
	1-11	8.28 (br, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.22 (t, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.09 (dd, 1H), 2.84 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.73 (m, 2H), 1.50 (d, 3H), 0.96 (t, 3H)	+3.70° (c=1.04)
15	1-12	8.48 (br, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.13 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 2.74 (m, 1H), 2.60 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.25 (d, 3H), 1.10 (dd, 6H)	-12.26° (c=1.28)
	1-14	8.29 (d, 1H), 8.23 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.66 (d, 1H), 4.68 (m, 1H), 3.27 (dd, 1H), 3.03 (dd, 1H), 2.93 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 1.53 (d, 3H), 1.22 (dd, 6H)	-9.68° (c=1.03)
20	1-15	8.48 (br, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.16 (d, 1H), 4.33 (m, 1H), 2.71 (q, 2H), 2.58 (dd, 2H), 1.89 (s, 3H), 1.27 (t, 3H), 1.26 (d, 3H)	-5.75° (c=1.01)

25

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-17 8.23 (br, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.59 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.72 (s, 3H), 2.70 (q, 2H), 1.50 (d, 3H), 1.26 (t, 3H)	+4.39° (c=1.06)
	1-18 8.77 (br, 1H), 8.58 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.20-7.26 (m, 2H), 7.08 (s, 1H), 6.05 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 2.64 (dd, 1H), 2.55 (dd, 1H), 1.95 (s, 3H), 1.24 (d, 3H)	-3.31° (c=1.07)
10	1-20 8.52-8.55 (m, 2H), 8.00 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.20-7.27 (m, 2H), 7.10 (s, 1H), 6.43 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.45 (dd, 1H), 3.21 (dd, 1H), 2.87 (s, 3H), 1.53 (d, 3H)	-3.06° (c=0.93)
	1-21 8.38 (br, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.21-7.29 (m, 3H), 6.09 (d, 1H), 4.33 (m, 1H), 3.99 (m, 1H), 2.58 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.89 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	-2.45° (c=1.03)
15	1-23 8.17 (d, 1H), 8.03 (br, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.25-7.30 (m, 2H), 7.24 (t, 1H), 6.53 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.34 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.52 (d, 3H)	-3.48° (c=1.06)
	1-24 8.39 (br, 1H), 8.28 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.20-7.28 (m, 3H), 6.15 (d, 1H), 4.31 (m, 1H), 3.99 (m, 1H), 2.60 (m, 2H), 2.28-2.35 (m, 5H), 1.25 (d, 3H), 1.08 (t, 3H)	-4.35° (c=0.99)
20	1-26 8.12-8.15 (m, 2H), 7.97 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.25-7.28 (m, 2H), 7.22 (t, 1H), 7.63 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.29 (dd, 1H), 3.07 (dd, 1H), 2.79 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 1.52 (d, 3H), 1.20 (t, 3H)	-4.86° (c=1.05)
	1-27 8.42 (br, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.19-7.28 (m, 3H), 6.16 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 3.99 (m, 1H), 2.65-2.79 (m, 2H), 2.53 (dd, 1H), 2.35 (s, 3H), 1.25 (d, 3H), 1.10 (dd, 6H)	-12.09° (c=1.12)

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN [CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-29 8.19 (br, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.20-7.26 (m, 3H), 6.66 (d, 1H), 4.67 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.27 (dd, 1H), 3.02 (dd, 1H), 2.90 (m, 1H), 2.34 (s, 3H), 1.54 (d, 3H), 1.20 (t, 6H)	-10.45° (c=1.14)
	1-30 8.46 (br, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.12 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 2.57 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.91 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	
10	1-32 8.25 (d, 1H), 8.18 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.65 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.76 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.50 (d, 3H),	+2.97° (c=1.01)
	1-33 8.37-8.45 (m, 2H), 8.01 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.45-7.52 (m, 2H), 7.26 (t, 1H), 6.12 (d, 1H), 4.34 (m, 1H), 2.59 (dd, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.95 (s, 3H), 1.26 (d, 3H)	+4.99° (c=1.02)
15	1-35 8.22 (d, 1H), 8.14 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.62 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.79 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.50 (d, 3H)	+27.26° (c=0.96)
	1-36 8.32 (br, 1H), 8.17 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.12 (d, 1H), 4.84-5.15 (m, 1H), 4.35 (m, 1H), 2.61 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	+1.95° (c=1.09)
20	1-38 8.12 (br, 1H), 7.91-7.98 (m, 2H), 7.69 (d, 1H), 7.20 (t, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.88-5.09 (m, 1H), 4.60 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.76 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	-0.16° (c=1.02)
	1-39 8.30 (br, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.23 (t, 1H), 7.07 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.11 (d, 1H), 5.90 (tt, 1H), 4.34 (m, 1H), 2.60 (br, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.97 (br, 3H), 1.27 (d, 3H)	+2.25° (c=1.04)

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-41 8.14 (br, 1H), 7.88-7.99 (m, 2H), 7.68 (d, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.90 (tt, 1H), 4.60 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.76 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	
	1-42 8.32 (br, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.20 (d, 1H), 4.33 (m, 1H), 2.60 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.96 (s, 3H), 1.27 (d, 3H)	+2.61° (c=1.04)
10	1-44 8.07 (br, 1H), 7.97 (m, 2H), 7.70 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.70 (m, 2H), 6.64 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.37 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	+3.80° (c=1.03)
	1-45 8.36 (br, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.05-7.08 (m, 2H), 6.24 (d, 1H), 4.31 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.40 (m, 2H), 2.32 (s, 1H), 1.25 (d, 3H), 1.12 (t, 3H)	+0.26° (c=1.23)
15	1-47 7.96-8.03 (m, 3H), 7.73 (d, 1H), 7.23 (t, 1H), 7.06-7.10 (m, 2H), 6.58 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.09 (dd, 1H), 2.86 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.53 (d, 3H), 1.25 (t, 3H)	
	1-48 8.64 (br, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.16-7.31 (m, 3H), 6.06 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.63 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	
20	1-50 8.46 (d, 1H), 8.37 (br, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.45 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.24 (dd, 1H), 2.95 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	
	1-51 8.64 (br, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.07 (d, 1H), 4.34 (m, 1H), 2.66 (m, 2H), 2.44 (m, 2H), 1.27 (d, 3H), 1.15 (t, 3H)	-5.01° (c=1.03)

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ^1H -RMN [CDCl_3 /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl_3)
5	1-53 8.47 (d, 1H), 8.39 (br, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 7.20 (d, 1H), 6.47 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.44 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 3.02 (q, 2H), 1.55 (d, 3H), 1.33 (t, 3H)	+7.35° (c=0.79)
	1-54 8.58 (br, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.19-7.26 (m, 2H), 6.07 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.64 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	-3.08° (c=1.10)
10	1-56 8.43 (d, 1H), 8.33 (br, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.21-7.27 (m, 2H), 6.42 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.50 (dd, 1H), 3.25 (dd, 1H), 2.95 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	+10.11° (c=1.07)
	1-57 8.57 (br, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.19-7.26 (m, 2H), 6.08 (d, 1H), 4.35 (m, 1H), 2.44-2.75 (m, 4H), 1.27 (d, 3H), 1.15 (t, 3H)	-4.51° (c=1.02)
15	1-59 8.43 (d, 1H), 8.34 (br, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.21-7.27 (m, 2H), 6.45 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.45 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 3.03 (m, 2H), 1.56 (d, 3H), 1.33 (t, 3H)	
	1-60 8.76 (br, 1H), 8.68 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.25 (t, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.01 (d, 1H), 4.38 (m, 1H), 2.64 (dd, 1H), 2.01 (s, 3H), 1.31 (d, 3H)	-8.47° (c=1.00)
20	1-62 8.62 (d, 1H), 8.45 (br, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.26 (t, 1H), 7.14 (d, 1H), 6.41 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.25 (dd, 1H), 2.97 (s, 3H), 1.56 (d, 3H)	
	1-63 8.64 (br, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.16-7.31 (m, 3H), 6.06 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.63 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-0.19° (c=1.24)

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-65 8.37 (d, 1H), 8.34 (br, 1H), 8.01 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.29 (dd, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.44 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.23 (dd, 1H), 2.95 (s, 3H), 1.54 (d, 3H)	+9.91° (c=1.06)
	1-66	-4.37° (c=1.01)
	1-72 8.53 (br, 1H), 8.38 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.38-7.48 (m, 3H), 6.12 (d, 1H), 4.34 (m, 1H), 2.57 (dd, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.89 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	+0.20° (c=1.04)
10	1-74 8.25 (d, 1H), 8.17 (br, 1H), 7.71-7.77 (m, 2H), 7.43-7.49 (m, 2H), 7.40 (t, 1H), 6.60 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	-0.36° (c=1.20)
	1-75 8.55 (br, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.41-7.51 (m, 3H), 6.17 (d, 1H), 4.35 (m, 1H), 2.57 (dd, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	+13.42° (c=0.23)
15	1-77 8.23 (d, 1H), 8.19 (br, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.44-7.50 (m, 3H), 6.66 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.50 (d, 3H)	-0.61° (c=1.02)
	1-78 8.73 (br, 1H), 8.28 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.42-7.56 (m, 3H), 7.28 (t, 1H), 6.25 (d, 1H), 4.38 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	+8.70° (c=1.18)
20	1-80 8.28 (br, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.43-7.52 (m, 4H), 7.22-7.29 (m, 1H), 6.80 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.49 (d, 3H)	-2.70° (c=1.00)
	1-81 8.66 (br, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.23-7.30 (m, 3H), 6.27 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.27 (d, 3H)	+9.33° (c=1.01)

Tabla 4 (continuación)

No.		Datos RMN ¹ H-RMN.[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-83	8.11 (br, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.47-7.55 (m, 2H), 7.24-7.30 (m, 3H), 6.69 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.21 (dd, 1H), 2.73 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.51 (d, 3H)	-4.64° (c=1.07)
	1-84	9.04 (br, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.25-7.33 (m, 2H), 4.10 (m, 1H), 2.38 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 1.67 (s, 3H), 1.07 (d, 3H)	
10	1-86	8.35 (br, 1H), 8.25-8.31 (m, 2H), 8.08 (d, 1H), 8.72 (t, 1H), 8.48 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 6.92 (d, 1H), 4.60 (m, 1H), 3.28 (m, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.44 (d, 3H)	+17.48° (c=1.03)
	1-87	9.03 (br, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.90 (m, 1H), 7.42-7.60 (m, 5H), 6.25 (d, 1H), 4.35 (m, 1H), 2.64 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.03 (s, 3H), 1.27 (d, 3H)	+17.09° (c=0.81)
15	1-89	8.50 (br, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.44-7.62 (m, 5H), 6.84 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.26 (m, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.47 (d, 3H)	
	1-90	8.67 (br, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.42-7.50 (m, 3H), 6.17 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.57 (br, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.26 (d, 3H)	+2.13° (c=1.02)
20	1-92	8.22 (d, 1H), 8.16 (br, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.45-7.51 (m, 3H), 6.62 (d, 1H), 4.66 (m, 1H), 3.33 (dd, 1H), 3.18 (dd, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	
	1-93	8.86 (br, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.38-7.50 (m, 4H), 7.04 (d, 1H), 4.18 (m, 1H), 2.54 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.16 (d, 3H)	

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN [CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación especifica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-95 10.17 (br, 1H), 8.68 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 4.44 (m, 1H), 3.25-3.38 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.23 (d, 3H)	
	1-96 8.48 (br, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.15 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 2.71 (q, 2H), 2.61 (m, 2H), 2.35 (m, 2H), 1.27 (t, 3H), 1.26 (d, 3H), 1.08 (t, 3H)	-3.28° (c=0.69)
10	1-98 8.22 (br, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.08 (dd, 1H), 2.83 (q, 2H), 2.70 (q, 2H), 1.52 (d, 3H), 1.27 (t, 3H), 1.21 (t, 3H)	-4.23° (c=0.99)
	1-99 8.42 (br, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.23-7.29 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 6.22 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 2.68 (q, 2H), 2.58 (m, 2H), 1.89 (s, 3H), 1.26 (d, 3H), 1.25 (t, 3H)	-1.48° (c=1.05)
15	1-101 8.18 (br, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.25-7.29 (m, 2H), 7.20 (t, 1H), 6.73 (d, 1H), 4.59 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.14 (dd, 1H), 2.69 (s, 3H), 2.66 (q, 2H), 1.51 (d, 3H), 1.25 (t, 3H)	-2.58° (c=1.07)
	1-102 8.41 (br, 1H), 8.21 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.19-7.29 (m, 3H), 6.17 (d, 1H), 4.31 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 2.68 (q, 2H), 2.62 (m, 2H), 2.36 (m, 2H), 1.26 (d, 3H), 1.25 (t, 3H), 1.08 (t, 3H)	-5.44° (c=1.16)
20	1-104 8.17 (br, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 6.69 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.20 (dd, 1H), 3.07 (dd, 1H), 2.80 (q, 2H), 2.66 (q, 2H), 1.52 (d, 3H), 1.25 (t, 3H), 1.20 (t, 3H)	-3.63° (c=1.01)
	1-222 8.82 (br, 1H), 8.69 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.76 (d, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.04 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.62 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-3.15° (c=1.10)

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-224 8.65 (d, 1H), 8.55 (br, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.72 (d, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.26 (t, 1H), 6.43 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.25 (dd, 1H), 2.94 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	+7.94° (c=1.11)
	1-225 8.71 (br, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.02 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.63 (m, 2H), 1.96 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	-9.28° (c=1.04)
10	1-227 8.59 (d, 1H), 8.48 (br, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.82 (s, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.25 (t, 1H), 6.42 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 3.50 (dd, 1H), 3.25 (dd, 1H), 2.93 (s, 3H), 1.56 (d, 3H)	+8.56° (c=1.02)
	1-231 8.82 (br, 1H), 8.60 (t, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.37-7.43 (m, 2H), 7.23 (t, 1H), 6.05 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.63 (br, 2H), 1.94 (s, 3H), 1.30 (d, 3H)	
15	1-233 8.49-8.55 (m, 2H), 8.01 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.51 (d, 1H), 4.61 (m, 1H), 3.48 (dd, 1H), 3.23 (dd, 1H), 2.89 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	+7.48° (c=1.43)
	1-234 8.60 (s, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.00-8.10 (m, 1H), 7.80-7.90 (m, 2H), 7.60-7.70 (m, 3H), 7.45 (d, 1H), 7.40 (s, 1H), 6.80 (d, 1H), 4.50 (m, 1H), 2.60 (d, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.90 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	
20	1-236 8.32 (d, 1H), 8.24 (br, 1H), 8.01 (m, 1H), 7.82-7.89 (m, 2H), 7.61-7.68 (m, 3H), 7.46 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 6.96 (d, 1H), 4.78 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.69 (s, 3H), 1.44 (d, 3H)	
	1-237 8.50 (br, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.00-8.06 (m, 2H), 7.76 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.08 (d, 1H), 4.38 (m, 1H), 2.65 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 1.30 (d, 3H)	

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN [CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-240 8.55 (br, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.40 (t, 1H), 6.22 (d, 1H), 4.33 (m, 1H), 2.61 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.35 (m, 2H), 1.25 (d, 3H), 1.09 (t, 3H)	-6.78° (c=1.23)
	1-242 8.30 (br, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.70-7.77 (m, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.40 (t, 1H), 6.71 (d, 1H), 4.65 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.09 (dd, 1H), 2.84 (q, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.52 (d, 3H), 1.23 (t, 3H)	-2.83° (c=0.99)
10	1-243 8.49 (br, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.23-7.27 (m, 2H), 6.24 (d, 1H), 4.32 (m, 1H), 3.99 (m, 1H), 2.61 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.31-2.39 (m, 2H), 1.25 (d, 3H), 1.09 (t, 3H)	-6.42° (c=1.06)
	1-245 8.17 (br, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.69-7.75 (m, 2H), 7.39 (t, 1H), 7.24-7.29 (m, 2H), 6.62 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.29 (dd, 1H), 3.08 (dd, 1H), 2.81 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 1.52 (d, 3H), 1.22 (t, 3H)	-3.29° (c=1.05)
15	1-246 8.50 (br, 1H), 8.20 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.36 (t, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 6.27 (d, 1H), 4.33 (m, 1H), 3.99 (m, 1H), 2.57 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 1.89 (s, 3H), 1.25 (d, 3H)	-3.41° (c=1.10)
	1-248 8.35 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.32 (t, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 6.85 (d, 1H), 4.57 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.31 (dd, 1H), 3.11 (dd, 1H), 2.65 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.47 (d, 3H)	-1.66° (c=1.96)
20	1-249 8.51 (br, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.41-7.58 (m, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 6.22 (d, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 2.58 (dd, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.91 (s, 3H), 1.26 (d, 3H)	-1.51° (c=1.06)
	1-251 8.32 (br, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.37-7.63 (m, 3H), 7.22-7.27 (m, 2H), 6.80 (d, 1H), 4.60 (m, 1H), 4.01 (m, 1H), 3.33 (dd, 1H), 3.13 (dd, 1H), 2.68 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.48 (d, 3H)	-3.24° (c=1.08)

Tabla 4 (continuación)

No.		Datos RMN ¹ H-RMN.[CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-252	8.59(br, 1H), 8.33(d, 1H), 7.75(d, 1H), 7.56(d, 1H), 7.41-7.49(m, 3H), 6.27(d, 1H), 4.33(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.39(s, 3H), 2.30-2.37(m, 2H), 1.24(d, 3H), 1.08(t, 3H)	-3.86° (c=1.04)
	1-254	8.36(br, 1H), 8.18(d, 1H), 7.66(d, 1H), 7.41-7.58(m, 4H), 6.76(d, 1H), 4.64(m, 1H), 3.30(dd, 1H), 3.05(dd, 1H), 2.83(q, 2H), 2.38(s, 3H), 1.51(d, 3H), 1.21(t, 3H)	-3.86° (c=1.03)
10	1-255	8.56(br, 1H), 8.18(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.53(d, 1H), 7.43(t, 1H), 7.24(d, 1H), 7.23(s, 1H), 6.30(d, 1H), 4.32(m, 1H), 3.99(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.34(s, 3H), 2.31-2.40(m, 2H), 1.24(d, 3H), 1.09(t, 3H)	-4.18° (c=1.02)
	1-257	8.10-8.17(m, 2H), 7.69(d, 1H), 7.43-7.60(m, 3H), 7.30(s, 1H), 6.60(d, 1H), 4.66(m, 1H), 4.01(m, 1H), 3.30(dd, 1H), 3.05(dd, 1H), 2.82(q, 2H), 2.35(s, 3H), 1.53(d, 3H), 1.22(t, 3H)	-6.23° (c=1.17)
15	1-260	8.24(br, 1H), 8.23(d, 1H), 7.66(d, 1H), 7.56(d, 1H), 7.42-7.48(m, 3H), 6.70(d, 1H), 4.63(m, 1H), 3.34(dd, 1H), 3.17(dd, 1H), 2.75(s, 3H), 2.38(s, 3H), 1.48(d, 3H)	+0.48° (c=1.00)
	1-263	8.14(d, 1H), 8.13(br, 1H), 7.66(d, 1H), 7.56(d, 2H), 7.46(t, 1H), 7.26(d, 1H), 7.25(s, 1H), 6.64(d, 1H), 4.63(m, 1H), 4.01(m, 1H), 3.34(dd, 1H), 3.17(dd, 1H), 2.73(s, 3H), 2.35(s, 3H), 1.49(d, 3H)	+2.42° (c=1.02)
20	1-264	8.70(br, 1H), 8.17(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.58(d, 1H), 7.49(t, 1H), 7.46(t, 1H), 6.13(d, 1H), 4.37(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.28(d, 3H), 1.94(s, 3H), 1.27(d, 3H)	+2.72° (c=1.04)
	1-266	8.49(br, 1H), 7.95(d, 1H), 7.65(d, 1H), 7.55(d, 1H), 7.46(t, 1H), 7.43(t, 1H), 6.72(d, 1H), 4.62(m, 1H), 3.36(dd, 1H), 3.19(dd, 1H), 2.80(s, 3H), 2.26(d, 3H), 1.50(d, 3H)	+1.76° (c=1.23)

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN [CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-267 8.42 (br, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.08 (d, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.17 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.62 (dd, 1H), 2.58 (dd, 1H), 2.34 (s, 3H), 1.98 (s, 3H), 1.26 (d, 3H)	+6.04° (c=1.05)
	1-269 8.04 (br, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.09 (br, 1H), 6.58 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	
10	1-270 8.67 (br, 1H), 8.49 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.08 (d, 1H), 4.39 (m, 1H), 2.67 (dd, 1H), 2.61 (dd, 1H), 2.02 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	-0.30° (c=1.01)
	1-272 8.46 (d, 1H), 8.39 (br, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.49 (t, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.21 (d, 1H), 6.46 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.48 (dd, 1H), 3.24 (dd, 1H), 2.96 (s, 3H), 1.54 (d, 3H)	+12.19° (c=1.06)
15	1-273 8.58 (br, 1H), 8.44 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.24 (d, 1H), 6.08 (d, 1H), 4.39 (m, 1H), 2.68 (dd, 1H), 2.62 (dd, 1H), 2.03 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	-1.81° (c=1.10)
	1-275 8.43 (d, 1H), 8.33 (br, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.46-7.53 (m, 2H), 7.23 (s, 1H), 6.42 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.49 (dd, 1H), 3.26 (dd, 1H), 2.97 (s, 3H), 1.55 (d, 3H)	
20	1-278 8.27 (d, 1H), 8.16 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.23 (t, 1H), 6.63 (d, 1H), 4.62 (m, 1H), 3.35 (dd, 1H), 3.17 (dd, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.50 (d, 3H)	+2.41° (c=2.04)
	1-281 8.08-8.20 (m, 2H), 7.97 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.22-7.27 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 6.70 (d, 1H), 4.60 (m, 1H), 4.00 (m, 1H), 3.34 (dd, 1H), 3.16 (dd, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.49 (d, 3H)	-0.39° (c=1.01)

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN [CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	1-282 8.30 (s, 1H), 8.26 (d, 1H), 8.19 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.23 (t, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.02 (s, 1H), 6.19 (d, 1H), 4.36 (m, 1H), 2.67 (dd, 1H), 2.59 (dd, 1H), 2.35 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.29 (d, 3H)	+3.73° (c=1.06)
	1-284 8.24 (d, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.95-8.00 (m, 3H), 7.71 (d, 1H), 7.22 (t, 1H), 7.03 (s, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.60 (d, 1H), 4.65 (m, 1H), 3.39 (dd, 1H), 3.20 (dd, 1H), 2.84 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.57 (d, 3H)	-1.98° (c=1.01)
10	1-285 8.39 (s, 1H), 8.26 (d, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.46 (t, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.01 (s, 1H), 6.23 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.69 (dd, 1H), 2.61 (dd, 1H), 2.37 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.31 (d, 3H)	+4.93° (c=1.02)
	1-287 8.24 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.44 (t, 1H), 7.03 (s, 1H), 7.02 (d, 1H), 6.59 (d, 1H), 4.65 (m, 1H), 3.38 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.56 (d, 3H)	
15	1-288 8.78 (br, 1H), 8.77 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.50 (t, 1H), 6.09 (d, 1H), 4.39 (m, 1H), 2.64 (s, 3H), 2.59 (d, 2H), 1.90 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-4.10° (c=1.02)
	2-4 8.80 (d, 1H), 8.63 (br, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.84 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.26 (t, 1H), 6.04 (d, 1H), 4.37 (m, 1H), 2.63 (s, 3H), 2.58 (d, 2H), 1.87 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-10.27° (c=1.04)
20	2-6 8.63 (d, 1H), 8.41 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.64 (m, 1H), 3.38 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.61 (s, 3H), 1.51 (d, 3H)	
	2-10 8.70 (d, 1H), 8.62 (br, 1H), 8.01 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.25 (t, 1H), 6.06 (d, 1H), 4.31-4.48 (m, 2H), 2.61 (s, 3H), 2.56-2.61 (m, 2H), 1.87 (s, 3H), 1.28 (d, 3H)	-7.39° (c=1.01)

25

Tabla 4 (continuación)

No.	Datos RMN ¹ H-RMN [CDCl ₃ /TMS, δ (ppm)]	Rotación específica [α] _D ²⁰ (CHCl ₃)
5	2-12 8.52 (d, 1H), 8.30 (br, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.24 (t, 1H), 6.65 (d, 1H), 4.63 (m, 1H), 4.39 (m, 1H), 3.37 (dd, 1H), 3.18 (dd, 1H), 2.76 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 1.52 (d, 3H)	
	2-15 8.57 (d, 1H), 8.49 (br, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.48 (t, 1H), 6.71 (d, 1H), 4.65 (m, 1H), 3.36 (dd, 1H), 3.19 (dd, 1H), 2.78 (s, 3H), 2.62 (s, 3H), 1.50 (d, 3H)	+2.66° (c=1.03)

10

Ejemplos

Los ejemplos típicos de la presente invención se describen abajo pero no se deben interpretar como limitativos del alcance de la invención.

15 Según se usa en los ejemplos, los términos "parte" y "partes" son en peso.

Ejemplo de formulación 1

	Cada compuesto listado en las Tablas 1 y 2	10 partes
20	Xylene	70 partes
	N-metilpirrolidona	10 partes
	Mezcla de polioxietilen nonilfenilo	10 partes
	éter y alaquilbencensulfonato de calico	

Se preparó una emulsión al mezclar uniformemente
25 los ingredientes anteriores para llevar a cabo la disolución.

Ejemplo de Formulación 2

Cada compuesto listado en las Tablas 1 y 2	3 partes
Polvo de arcilla	82 partes
Polvo de tierra diatomácea	15 partes

5 Se preparó un polvo al mezclar uniformemente y
moler los ingredientes de arriba.

Ejemplo de Formulación 3

Cada compuesto listado en las Tablas 1 y 2	5 partes
10 Polvo mezclado de bentonita y arcilla	90 partes
Ligninsulfonato de calcio	5 partes

 Se prepararon gránulos al mezclar uniformemente los
ingredientes de arriba y al amasar la mezcla resultante junto
con una cantidad adecuada de agua, seguido por granulación y
15 secado.

Ejemplo de Formulación 4

Cada compuesto listado en las Tablas 1 y 2	20 partes
Mezcla de caolín y caolín sintética y	
20 Ácido silícico de alta dispersión	75 partes
Mezcla de éter polioxietilen nonilfenílico y	
alquilbencensulfonato de calcio	5 partes

 Se preparó un polvo humectante al mezclar
uniformemente y moler los ingredientes de arriba.

Ejempl de prueba 1

Actividad insecticida sobre polilla de la col (*Plutella*
xylostella)

Un disco de hoja de col (variedad: Shikidori)
5 cortado a un diámetro de 7 cm se sumergió durante
aproximadamente 30 segundos en una solución química preparada al diluir
una preparación que contenía cada compuesto listado en las Tablas 1 y 2
como un ingrediente activo para ajustar la concentración a 50 ppm.
Después de secarlo, se colocó en una caja de Petri de plástico con un
10 diámetro de 9 cm y se inoculó con diez de las terceras larvas
recién nacidas de polillas de la col. Ocho días después de
la inoculación, las larvas muertas y vivas se contaron. La
mortalidad se calculó de acuerdo con la siguiente ecuación y
la actividad insecticida se juzgó de acuerdo con el criterio
15 mostrado abajo. La prueba se llevó a cabo con tres réplicas bajo las
condiciones de 25°C, 50-60% de HR y fotoperíodo de 16L-8D.

		Número de larvas vivas en grupo no tratado	—	Número de larvas vivas en grupo tratado	
20	Mortalidad (%)	$\frac{\text{Número de larvas vivas en grupo no tratado}}{\text{Número de larvas vivas en grupo no tratado}} \times 100$			

Criterio:

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

Como resultado, los siguientes compuestos fueron clasificados A: compuestos Nos. 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-56, 1-57, 1-59, 1-60, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-68, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-92, 1-93, 1-95, 1-96, 1-98, 1-99, 1-101, 1-102, 1-104, 1-105, 1-222, 1-224, 1-225, 1-227, 1-231, 1-233, 1-234, 1-236, 1-237, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248, 1-249, 1-250, 1-251, 1-252, 1-253, 1-254, 1-255, 1-256, 1-257, 1-260, 1-263, 1-264, 1-266, 1-267, 1-269, 1-270, 1-272, 1-273, 1-275, 1-278, 1-281, 1-282, 1-283, 1-284, 1-285, 1-287, 1-288, 1-290, 1-291, 1-293, 1-306, 1-307, 1-308, 1-315, 1-317, 1-321, 1-323, 1-327, 1-328, 1-329, 1-330, 1-331, 1-332, 1-333, 1-334, 1-335, 2-4, 2-5, 2-6, 2-10, 2-12, 2-13, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 220, 2-21, 2-27, 2-28, 2-30 y 2-32.

Ejemplo de prueba 2

Actividad insecticida sobre oruga podadera común (*Spodoptera litura*)

Un disco de hoja de col (variedad: Shikidori)

cortado a un diámetro de 7 cm se sumergió durante aproximadamente 30 segundos en una solución química preparada al diluir una preparación que contenía cada compuesto listado en las Tablas 1 y 2 como un ingrediente activo para ajustar la concentración a 50 ppm. Después de secarlo, se colocó en una caja de Petri de plástico con un diámetro de 9 cm y se inoculó con diez de las segundas larvas recién nacidas de oruga podadera común. Ocho días después de la inoculación, las larvas muertas y vivas se contaron. La mortalidad se calculó y la actividad insecticida se juzgó de la misma forma que en el Ejemplo de prueba 1. La prueba se llevó a cabo con tres réplicas bajo las condiciones de 25°C, 50-60% de HR y fotoperíodo de 16L-8D.

Como resultado, los siguientes compuestos fueron clasificados A: compuestos Nos. 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-56, 1-57, 1-59, 1-60, 1-62, 1-63, 1-64, 1-65, 1-66, 1-68, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-92, 1-93, 1-95, 1-96, 1-98, 1-99, 1-101, 1-102, 1-104, 1-105, 1-222, 1-225, 1-227, 1-231, 1-233, 1-234, 1-237, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248, 1-249,

1-250, 1-251, 1-252, 1-253, 1-254, 1-255, 1-256, 1-257, 1-260, 1-263, 1-264, 1-266, 1-269, 1-270, 1-272, 1-273, 1-275, 1-278, 1-281, 1-282, 1-283, 1-284, 1-285, 1-287, 1-288, 1-290, 1-291, 1-293, 1-306, 1-307, 1-308, 1-321, 1-327, 1-328, 1-329, 1-331, 1-332, 1-333, 1-334, 1-335, 2-4, 2-5, 2-6, 2-10, 2-12, 2-13, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-28 y 2-30.

Ejemplo de prueba 3

Actividad insecticida sobre piral del té más pequeño

10

(Adxophyes sp.)

Hojas de té se sumergieron durante aproximadamente 30 segundos en una solución química preparada al diluir una preparación que contenía cada compuesto listado en las Tablas 1 y 2 como un ingrediente activo para ajustar la concentración a 50 ppm. Después de secar, las hojas de té se colocaron en una caja de Petri de plástico con un diámetro de 9 cm y se inocularon con larvas de piral del té más pequeñas. Ocho días después de la inoculación, las larvas muertas y vivas se contaron. La mortalidad se calculó y la actividad insecticida se juzgó de la misma forma que en el Ejemplo de prueba 1. La prueba se llevó a cabo con tres réplicas bajo las condiciones de 25°C, 50-60% de HR y fotoperíodo de 16L-8D.

Como resultado, los siguientes compuestos fueron clasificados A: compuestos Nos. 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8,

1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-38, 1-42, 1-44, 1-45, 1-47, 1-48, 1-50, 1-51, 1-53, 1-54, 1-56, 1-60, 1-62, 1-64, 1-66, 1-68, 1-72, 1-73, 1-74, 175, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-90, 1-92, 1-93, 1-95, 1-96, 1-98, 1-99, 1-104, 1-105, 1-222, 1-224, 1-225, 1-227, 1-231, 1-233, 1-234, 1-236, 1-237, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248, 1-249, 1-250, 1-251, 1-252, 1-253, 1-254, 1-255, 1-256, 1-257, 1-260, 1-263, 1-264, 1-266, 1-267, 1-269, 1-270, 1-278, 1-281, 1-282, 1-283, 1-284, 1-285, 1-287, 1-288, 1-290, 1-291, 1-293, 1-307, 1-308, 1-327, 1-328, 1-329, 1-330, 1-332, 1-333, 1-334, 1-335, 2-10, 2-12, 2-13, 2-15, 2-16, 2-17, 2-28 y 2-30.

15

Prueba comparativa 1

Actividad sistémica del agente en col china

Una plántula de col china (variedad: Aichi) cultivada en una maceta de papel llenada con moldeado hortícola se colocó en un contenedor plástico cilíndrico. Un agente que contenía, como un ingrediente activo, cada uno de los compuestos mostrados en la tabla y un compuesto comparativo 1 (el compuesto con No. de compuesto 216 descrito en JP-A-2001-131141), se diluyó con agua hasta concentraciones de 0.03, 0.1, 0.3, 1 y 3 ppm, para preparar

así 10 mL de cada uno de un agente de solución. El pie de la planta de cada plántula de col china se empapó en la solución obtenida. La col china se inoculó con las terceras larvas recién nacidas de oruga podadera común (*Spodoptera litura*).
5 Cuatro días después de la inoculación se contó el número de larvas sobrevivientes. La mortalidad se calculó de acuerdo con la expresión indicada abajo, y después se evaluó de acuerdo con el criterio indicado abajo. Los resultados se muestran en la Tabla 5. La prueba se llevó a cabo con tres
10 réplicas bajo las condiciones de 25°C, 50-60% de HR y fotoperíodo de 16L-8D

15

Mortalidad (%)

Número de larvas vivas en grupo no tratado

—

Número de larvas vivas en grupo tratado

Número de larvas vivas en grupo no tratado

×

100

Criterio:

10 --- Mortalidad 91%-100%	9 --- Mortalidad 81%-90%
8 --- Mortalidad 71%-80%	7 --- Mortalidad 61%-70%
20 6 --- Mortalidad 51%-60%	5 --- Mortalidad 41%-50%
4 --- Mortalidad 31%-40%	3 --- Mortalidad 21%-30%
2 --- Mortalidad 11%-20%	1 --- Mortalidad 1%-10%
0 --- Mortalidad 0%	

Tabla 5

	Compuesto	concentración (ppm)	Evaluación de mortalidad (4 días después)
5	1-4	3	10
		1	10
		0.3	5
		0.1	4
		0.03	0
10	1-5	3	10
		1	10
		0.3	10
		0.1	4
		0.03	3
15	1-77	3	10
		1	10
		0.3	5
		0.1	3
		0.03	0
20	1-74	3	10
		1	10
		0.3	10
		0.1	3
		0.03	2
25	Compuesto Comparativo 1	3	10
		1	4
		0.3	2
		0.1	0
		0.03	0
	No tratado		0

Cuando se compara con el compuesto comparativo, el compuesto de la presente invención claramente exhibe superioridad.

Prueba comparativa 2

Control de mariposa pequeña de la col (Pieris rapae) en col mediante aplicación en orificio de trasplante durante trasplante

Un agente que contenía, como un ingrediente activo

(AI), cada uno de los compuestos mostrados en la tabla y un compuesto comparativo 1 (el compuesto con No. de compuesto 216 descrito en JP-A-2001-131141), se colocó en un orificio de transplante sobre la tierra, y las plántulas de col 5 (variedad: YR Seitoku) se transplantaron en el orificio tratado (al final de Abril). Veintisiete días después del transplante, el número de larvas de oruga podadera común se contó. El valor de control se calculó de acuerdo a la expresión indicada abajo, y 10 se evaluó después de acuerdo con el criterio indicado en la Prueba comparativa 1 arriba. Un grupo de prueba consistía de 20 barras de col. Los resultados son mostrados en la Tabla 6.

15

Número de
parásitos
en grupo no
tratado

—

Número de
parásitos
en grupo
tratado

Valor de
control

Número de parásitos en grupo no
tratado

x 100

20

25

Tabla 6

5 Compuesto	Dosis (mgAI/planta)	Evaluación de valor de control (27 días después)
1-4	10	10
1-5	10	10
1-77	10	10
1-74	10	10
10 compuesto comparativo 1	10	5
No tratado		0

Cuando se compare con el compuesto comparativo, el compuesto de la presente invención exhibió claramente superioridad.

Prueba comparativa 3

Control de oruga podadera común (*Spodoptera litura*) en col mediante aplicación orificio de transplante durante transplante

Un agente que contenía, como un ingrediente activo (AI), cada uno de los compuestos mostrados en la tabla y un compuesto comparativo 1 (el compuesto con No. de compuesto 216 descrito en JP-A-2001-131141), se colocó en un orificio de transplante sobre la tierra, y las plántulas de col

(variedad: YR Seitoku) se transplantaron en el orificio tratado (al final de Abril). Treinta días después del transplante, la tercera hoja a partir de la hoja superior se cortó y se colocó en una caja de Petri con diez de las 5 terceras larvas recién nacidas de oruga podadera común. Cuatro días después de la inoculación, se contaron el número de lavaras sobrevivientes. La mortalidad se calculó y se evaluó en la misa forma que en la Prueba comparativa 1 arriba. La prueba se llevó a cabo con dos réplicas. Los 10 resultados son mostrados en la Tabla 7.

Tabla 7

	Compuesto	Dosis (mgAI/barra)	Evaluación de mortalidad
			(30 días después)
15	1-4	10	10
	1-5	10	10
	1-77	10	10
	1-74	10	10
	Compuesto comparativo 1	10	2
20	No tratado		0

Cuando se comparó con el compuesto comparativo, el compuesto de la presente invención exhibió claramente superioridad.

Prueba comparativa 4

**Control de oruga podadera común (*Spodoptera litura*) en col
mediante aplicación por rocío en caja de vivero**

Un agente que contenía, como un ingrediente activo
5 (AI), cada uno de los compuestos mostrados en la tabla y un
compuesto comparativo 1 (el compuesto con No. de compuesto
216 descrito en JP-A-2001-131141), se diluyó en
concentraciones prescritas. Una plántula de col (variedad:
YR Seitoku) en la caja de vivero se roció con la solución
10 obtenida a una velocidad de 4 mL/planta. Poco después de
rociarla, la planta de col se transplantó al campo. Veinte
días después del transplante, la tercera hoja a partir de la
hoja superior se cortó y se colocó en una caja de Petri con
diez de las terceras lavas recién nacidas de oruga podadera
15 común. Cuatro días después de la inoculación, se contaron el
número de larvas sobrevivientes. La mortalidad se calculó y
se evaluó en la misma forma que en la Prueba comparativa 1
arriba. La prueba se llevó a cabo con dos réplicas. Los
resultados son mostrados en la Tabla 8.

20

25

Tabla 8

	Compuesto	Dosis		Evaluación de mortalidad (20 días después)
		(mgAI/barra)	(ppm)	
5	1-4	1.56	400	10
		0.78	200	10
		0.39	100	8
	1-5	1.56	400	10
		0.78	200	10
		0.39	100	9
10	Compuesto comparativo 1	1.56	400	9
		0.78	200	0
		0.39	100	0
	No tratado			0

15 Cuando se comparó con el compuesto comparativo, el compuesto de la presente invención claramente exhibió superioridad.

Prueba comparativa 5

20 Control de Myzus persicae - sistémico

 Un agente que contenía, como un ingrediente activo, cada uno representativo, de los compuestos de la presente invención (Nos. de compuesto 1-77 y 1-74), compuesto comparativo 2 (Compuesto No. 101 descrito en JP-A-2001-25. 131141) y compuesto comparativo 3 (Compuesto No. 97 descrito

en JP-A-2001-131141) se diluyó en concentraciones prescritas.

La preparación que contenía el ingrediente activo se mezcla en agua. La concentración establecida se basa en la cantidad de ingrediente activo por unidad de volumen de agua (mg/l = ppm). El agente diluido se rellenó en un contenedor con una planta de chícharo infestada (*Pisum sativum*) con pulgón gris del melocotón (*Myzus persicae*). Después de 6 días, se determinó la mortalidad. La Tabla 9 muestra los resultados. 100% significa que todos los pulgones han sido matados; 0% significa que ninguno de los pulgones ha sido matado.

Tabla 9

Compuesto	Dosis	Mortalidad (%)
	(ppm)	
1-77	20	90
	4	85
	0.8	0
1-74	100	70
Compuesto comparativo 2	20	0
	4	0
	0.8	0
Compuesto comparativo 3	100	0
No tratado		0

Cuando se comparó con los compuestos comparativos, los compuestos de la presente invención claramente exhibieron superioridad.

5

Prueba comparativa 6

Control de *Spodoptera exigua*

Un agente que contenía, como un ingrediente activo, cada uno de compuesto de la presente invención (Compuesto No. 1-77) y compuesto comparativo 2 (Compuesto No. 101 descrito en JP-A-2001-131141) se diluyó en concentraciones prescritas.

Se trataron hojas de col (*Brassica oleracea*) al ser sumergidas en la preparación del compuesto activo de la concentración deseada y se infestaron con orugas del gusano soldado de la remolacha (*Spodoptera exigua*) mientras las hojas aún estaban húmedas.

Después de 7 días, se determinó la mortalidad. La tabla 10 muestra los resultados. 100 % significa que todas las orugas han sido matadas; 0 % significa que ninguna de las orugas ha sido matada.

20

25

Tabla 10

	Compuesto	Dosis	Mortalidad (%)
		(ppm)	
5	1-77	4	100
		0.8	100
		0.16	100
		0.032	0
		0.0064	0
10	Compuesto comparativo 2	4	100
		0.8	100
		0.16	0
		0.032	0
		0.0064	0
15	No tratado		0

En esta prueba, el compuesto de la presente invención mostró eficacia sorprendentemente más alta que su racemato.

20

Prueba comparativa 7

Control de *Phaedon cochleariae*

Un agente que contenía, como un ingrediente activo, cada uno del compuesto de la presente invención (Compuesto No. 1-77) y compuesto comparativo 2 (Compuesto No. 101
25 descrito en JP-A-2001-131141) se diluyó en concentraciones

prescritas.

Se trataron hojas de col (*Brassica oleracea*) al ser sumergidas en el agente diluido y se infestaron con larvas de escarabajo mostaza (*Phaedon cochleariae*) mientras las hojas aún estaban húmedas.

5 Después de 7 días, se determinó la mortalidad. La tabla 11 muestra los resultados. 100% significa que todas las larvas de escarabajo se han matado; 0% significa que ninguna de las larvas de escarabajo han sido matadas.

10

Tabla 11

15

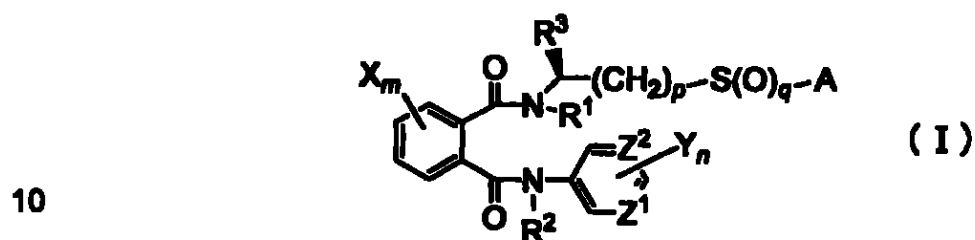
20

Compuesto	Dosis	Mortalidad (%)
	(ppm)	
1-77	100	100
	20	100
	4	100
	0.8	0
	0.16	0
Compuesto comparativo 2	100	100
	20	100
	4	0
	0.8	0
	0.16	0
No tratado		0

25 En esta prueba, el compuesto de la presente invención mostró eficacia sorprendentemente más alta que su racemato.

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de ftalimida ópticamente activo,
5 caracterizado porque es representado por la fórmula (I) o una sal del mismo:



(en donde R¹ y R² pueden ser el mismo o diferente, y
cada uno de R¹ y R² representa un átomo de hidrógeno; un grupo
alquilo de C1-C6; un grupo alquilo de C1-C6 sustituido que
15 tiene uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o
diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un
átomo de halógeno, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo
alquiltio de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6 y un
grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo
20 pueden ser los mismos o diferentes; o un grupo
alcoxycarbonilo de C1-C6;

R³ representa un grupo alquilo de C1-C6;

A representa un átomo de hidrógeno; un grupo
alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo
25 alquenilo de C3-C6; un grupo haloalquenilo de C3-C6; un grupo

alquinilo de C3-C6; un grupo haloalquinilo de C3-C6; un grupo
alcoxi de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-
C6-alquilo de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-C6-alquilo de
C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un
5 grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo
alquilsulfonilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo
haloalquilsulfonilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo
alquilcarbonilo de C1-C6; un grupo monoalquilcarbamoilo de
C1-C6; un grupo dialquilcarbamoilo de C1-C6; en los cuales
10 los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un
grupo fenoxialquilo de C1-C6; un grupo fenoxialquilo de C1-C6
sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser
los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que
consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6,
15 un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un
grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un
grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-
C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo
alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-
20 C6, un grupo mono-alquilamino de C1-C6, un grupo
dialquilamino de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden
ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de
C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los
grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo
25 fenilalquilo de C1-C6; o un grupo fenilalquilo de C1-C6

sustituido que tiene, en el anillo del mismo, uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes;

15 p representa un entero de entre 0 y 4;

 q representa un entero de entre 0 y 2;

 X puede ser el mismo o diferente y representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo nitro, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alquenilo de C2-C6, un grupo haloalquenilo de C2-C6, un grupo alquinilo de C2-C6, un grupo haloalquinilo de C2-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-

20

25

C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, o un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, y

5 m representa un entero de entre 0 y 4 y

X puede formar un anillo condensado junto con átomos de carbono adyacentes al mismo en un anillo de fenilo, y este anillo condensado puede tener uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se selecciona del

10 grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo alcoxi de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-C6; un grupo haloalquiltio de C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfinilo de C1-

15 C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo monoalquilamino de C1-C6; un grupo dialquilamino de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo monohaloalquilamino de C1-C6; un grupo dihaloalquilamino de

20 C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tenga uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se selecciona de un grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo

25 haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo

haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo

5 monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6, en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6, y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo heterocíclico; y

10 un grupo heterocíclico sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo

15 alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos

20 alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes;

Y puede ser el mismo o diferente y representa un

25 átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un grupo ciano; un

grupo amino; un grupo nitro; un grupo alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo alquenilo de C2-C6; un grupo haloalquenilo de C2-C6; un grupo alquinilo de C2-C6; un grupo haloalquinilo de C2-C6; un grupo cicloalquilo de C3-C6; un grupo halocicloalquilo de C3-C6; un grupo alcoxi de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-C6; un grupo haloalquiltio de C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo monoalquilamino de C1-C6; un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo trialquilsililo de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tenga uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6, y un grupo dihaloalquilamino de

C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo heterocíclico; o un grupo heterocíclico sustituido que tenga uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del

5 grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-

10 C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6, y un grupo dihaloalquilamino de

15 C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; y

n representa un entero de entre 1 y 5 y

Y puede formar un anillo condensado junto con átomos de carbono adyacentes al mismo en un anillo de fenilo,

20 y este anillo condensado puede tener uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-C6; un grupo alcoxi de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-C6; un grupo alquiltio de

25 C1-C6; un grupo haloalquiltio de C1-C6; un grupo

alquilsulfinilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6; un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo monoalquilamino de C1-C6; un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo monohaloalquilamino de C1-C6; un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo fenilo; un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes; un grupo heterocíclico; un grupo heterocíclico sustituido que tenga uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un

grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, un grupo monoalquilamino de C1-C6, un grupo dialquilamino de C1-C6 en el cual los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes y

Z^1 y Z^2 pueden ser los mismos o diferentes, y cada uno de Z^1 y Z^2 representan C-Y (en donde Y tiene el mismo significado descrito arriba) o átomo de nitrógeno;

siempre que, cuando R^1 y R^2 representen átomos de hidrógeno, R^3 represente un grupo metilo, X represente un átomo de yodo, m represente 1, Y_n represente un grupo 2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo], p represente 1 y q represente 0, entonces A no sea un grupo metilo y un grupo etilo).

2. El derivado de ftalimida ópticamente activo o una sal del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R^1 y R^2 pueden ser el mismo o diferente, y cada uno de R^1 y R^2 representa un átomo de hidrógeno o grupo alquilo de C1-C6; R^3 representa un grupo metilo o grupo etilo; A representa un grupo alquilo de C1-C6; un grupo

alquenilo de C3-C6; un grupo alquinilo de C3-C6; un grupo
alcoxi de C1-C6-alquilo de C1-C6; un grupo alquiltio de C1-
C6-alquilo de C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6-
alquilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-C6-alquilo
5 de C1-C6 o un grupo monoalquilcarbamoilo de C1-C6; p
representa un entero de entre 1 y 4; X puede ser el mismo o
diferente y representa un átomo de halógeno, un grupo nitro,
un grupo haloalquilo de C1-C6 o un grupo haloalcoxi de C1-C6;
m representa un entero de entre 0 y 2 y Y puede ser el mismo
10 o diferente y representa un átomo de halógeno; un grupo
ciano; un grupo alquilo de C1-C6; un grupo haloalquilo de C1-
C6; un grupo alquenilo de C2-C6; un grupo haloalquenilo de
C2-C6; un grupo alquinilo de C2-C6; un grupo haloalquinilo de
C2-C6; un grupo alcoxi de C1-C6; un grupo haloalcoxi de C1-
15 C6; un grupo alquiltio de C1-C6; un grupo haloalquiltio de
C1-C6; un grupo alquilsulfinilo de C1-C6; un grupo
haloalquilsulfinilo de C1-C6; un grupo alquilsulfonilo de C1-
C6; un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo
monoalquilamino de C1-C6 o un grupo dihaloalquilamino de C1-
20 C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o
diferentes, y Y puede formar un anillo condensado junto con
átomos de carbono adyacentes al mismo en un anillo de fenilo,
y este anillo condensado puede tener uno o más sustituyentes
que pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan del
25 grupo que consiste en un átomo de halógeno; un grupo alquilo

de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6; un grupo dialquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes, un grupo monohaloalquilamino de C1-C6 y un grupo dihaloalquilamino de C1-C6 en los cuales los grupos alquilo pueden ser los mismos o diferentes y n representa un entero de entre 1 y 4.

3. El derivado de ftalimida ópticamente activo o una sal del mismo de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R^1 y R^2 pueden ser el mismo o diferente, y cada uno de R^1 y R^2 representa un átomo de hidrógeno o grupo alquilo de C1-C6; R^3 representa un grupo metilo; A representa un grupo alquilo de C1-C6, un grupo alquenilo de C3-C6, un grupo alquinilo de C3-C6; un grupo alcoxi de C1-C6-alquilo de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6-alquilo de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6-alquilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-C6-alquilo de C1-C6; p representa un entero de entre 1 y 4; q representa 1 ó 2; X puede ser el mismo o diferente y representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo haloalquilo de C1-C6 o un grupo haloalcoxi de C1-C6; m representa un entero de entre 0 y 2 y Y puede ser el

mismo o diferente y representa un átomo de halógeno, un grupo
 ciano, un grupo alquilo de C1-C6, un grupo haloalquilo de C1-
 C6, un grupo alquenilo de C2-C6, un grupo haloalquenilo de
 C2-C6, un grupo alquinilo de C2-C6, un grupo haloalquinilo de
 5 C2-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo haloalcoxi de C1-
 C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo haloalquiltio de
 C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un grupo
 haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo de C1-
 C6 o un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, y Y puede formar
 10 un anillo condensado junto con átomos de carbono adyacentes
 al mismo en un anillo de fenilo, y este anillo condensado
 puede tener uno o más sustituyentes que pueden ser los mismos
 o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en un
 átomo de halógeno; un grupo alquilo de C1-C6, un grupo
 15 haloalquilo de C1-C6, un grupo alcoxi de C1-C6, un grupo
 haloalcoxi de C1-C6, un grupo alquiltio de C1-C6, un grupo
 haloalquiltio de C1-C6, un grupo alquilsulfinilo de C1-C6, un
 grupo haloalquilsulfinilo de C1-C6, un grupo alquilsulfonilo
 de C1-C6 y un grupo haloalquilsulfonilo de C1-C6, y n
 20 representa un entero de entre 1 y 4.

4. Un derivado de ftalimida ópticamente activo,
 caracterizado porque se selecciona del grupo que consiste en

(S)-3-yodo-N¹-(2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-
 (trifluorometil)etil]fenil)-N²-(1-metil-2-
 25 metilsulfoniletil)ftalimida,

(S)-3-cloro-N¹-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N²-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalimida,

(S)-3-bromo-N¹-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N²-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalimida y

(S)-3-yodo-N¹-{2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N²-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalimida, o una sal del mismo.

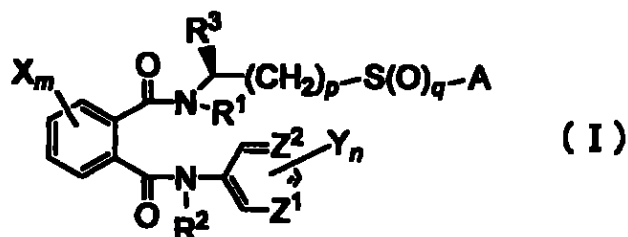
10 5. Un insecticida agrohortícola, caracterizado porque comprende, como un ingrediente activo, el derivado de ftalimida ópticamente activo o una sal del mismo de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.

15 6. Un método para usar un insecticida agrohortícola, caracterizado porque comprende tratar una planta o suelo objetivo con una cantidad efectiva del insecticida agrohortícola de conformidad con la reivindicación 5, para controlar así plagas de insectos en plantas útiles.

RESUMEN DE LA INVENCIÓN

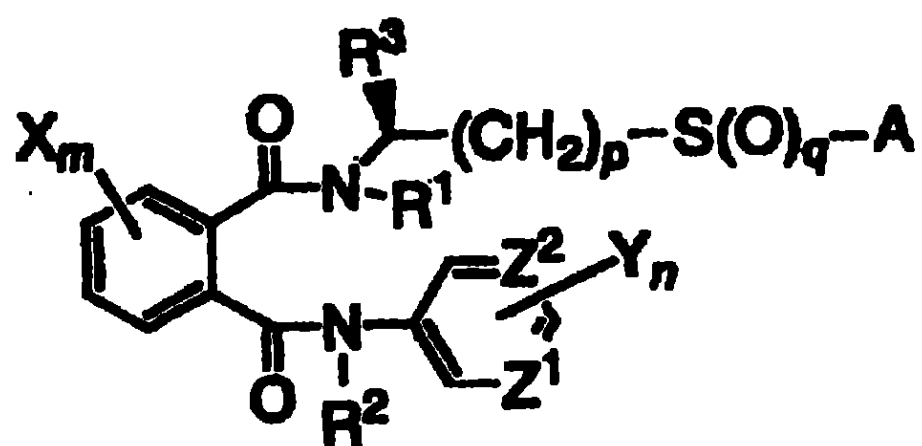
Se describe un derivado de ftalimida ópticamente activo representado por la fórmula (I):

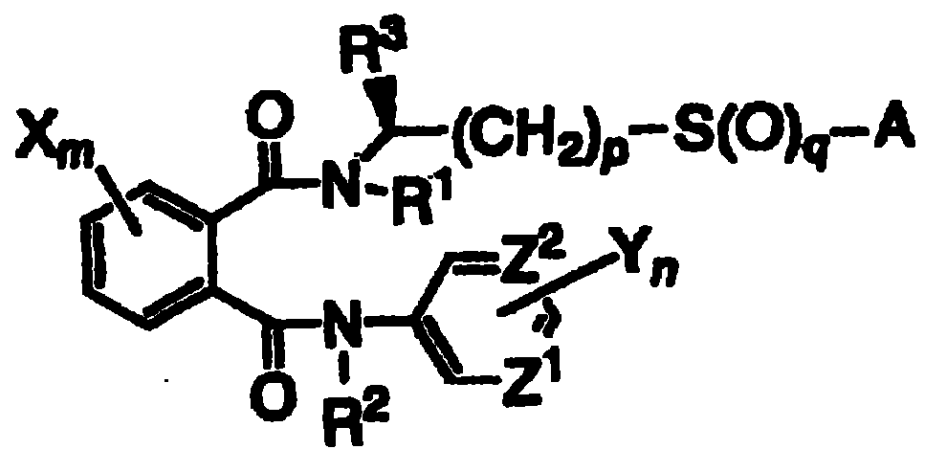
5



(en donde R¹ y R² representan cada uno H o alquilo de C₁₋₆ o alcóxicarbonilo de C₁₋₆ sustituido opcionalmente; R³ representa alquilo de C₁₋₆; A representa H, alquilo de C₁₋₆; de C₁₋₆ alquénilo de C₃₋₆; alquínilo de C₃₋₆; fenoxialquilo de C₁₋₆ sustituido opcionalmente, etc.; p es 0-4; q es 0-2; X representa halógeno, CN, NH₂, alquilo de C₁₋₆, alquénilo de C₂₋₆, alquiltio de C₁₋₆, etc.; m es 0-4; Y representa halógeno; CN, NH₂, alquilo de C₁₋₆, fenilo sustituido opcionalmente, etc.; n es 1-5 y Z¹ y Z² representan cada uno C-Y o N; siempre que, X y Y se puedan unir cada uno a un átomo de carbono en el anillo de fenilo para formar un anillo fusionado) y una

sal del derivado; y un insecticida agrícola u hortícola que contiene el derivado como un ingrediente activo. El derivado de ftalimida ópticamente activo tiene excelente actividad de control cuando se usa en un insecticida agrícola u hortícola. Produce un excelente efecto incluso cuando se usa en combinación con otros insecticidas.





PCT

REPORTE DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

(Artículo 18 y Reglas 43 y 44 del PCT)

Referencia de archivo del solicitante o apoderado: W2528-000000	PARA UNA ACCIÓN ADICIONAL	Véase la Notificación de transmisión del reporte de examen preliminar internacional (Forma PCT/ISA/220), así como, cuando sea aplicable, ítem 5 abajo
No. de solicitud internacional: PCT/JP2005/015208	Fecha de presentación internacional (día/mes/año): 22/08/2005	Fecha de prioridad (la más inicial) (día/mes/año): 23/08/2004
Solicitante: NIHON NOHYAKU CO., LTD.		

Este reporte de búsqueda internacional ha sido preparado por esta Autoridad de Búsqueda Internacional y se transmite al solicitante de acuerdo al Artículo 18. Una copia se transmite a la Oficina Internacional.

Este reporte de búsqueda internacional consiste de un total de 3 hojas.

☐ También está acompañado de una copia de cada documento de la técnica previa citado en este reporte.

1. Base del reporte

a. Con respecto al idioma, la búsqueda internacional se llevó a cabo con base en la solicitud internacional en el idioma en el cual fue presentada, a menos que se indique de otra forma bajo este ítem.

☐ La búsqueda internacional se llevó a cabo con base en una traducción de la solicitud internacional presentada ante esta autoridad (Regla 23.1(b)).

b. ☐ Con respecto a cualquier secuencia de nucleótidos y/o aminoácidos descrita en la solicitud internacional, la búsqueda internacional, véase Bloque No. I

2. ☐ Se encontró que ciertas reivindicaciones eran inescrutables (Véase Bloque II).

3. ☐ Se carece de unidad de la invención (Véase bloque III).

4. Con respecto al título ☒ el texto está aprobado como se presentó por el solicitante.

☐ el texto ha sido establecido por esta Autoridad para leerse como sigue:

5. Con respecto al extracto,

☒ el texto está aprobado como se presentó por el solicitante.

☐ el texto ha sido establecido, de acuerdo a la Regla 38.2(b), por esta Autoridad como aparece en el bloque III. El solicitante puede, en el término de un mes a partir de la fecha de envío de este reporte de búsqueda internacional, presentar comentarios a esta Autoridad.

6. La figura de los dibujos a ser publicada con el extracto es la Figura No.

☐ como se sugiere por el solicitante.

☒ Ninguna de las figuras

☐ debido a que el solicitante fracasó en sugerir una figura.

☐ debido a que esta figura caracteriza mejor la invención.

REPORTE DE BUSQUEDA INTERNACIONAL

No. de solicitud internacional
 PCT/JP2005/015208

234

A. CLASIFICACION DEL TEMA

Int.Cl⁷ C07C317/28, A01N37/18, 41/10, 43/40, C07C323/42, C07D213/64, 213/70, 213/75, 239/42//C07M7:00

De acuerdo a la Clasificación de Patentes Internacional (IPC) o a la clasificación nacional y a la IPC.

B. CAMPOS BUSCADOS

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido por los símbolos de clasificación):

Int.Cl⁷ C07C317/28, A01N37/18, 41/10, 43/40, C07C323/42, C07D213/64, 213/70, 213/75, 239/42//C07M7:00

Documentación buscada diferente a la documentación mínima, a la extensión que tales documentos están incluidos en los campos buscados :

Base de datos electrónicos consultados durante la búsqueda internacional (nombre de la base de datos y, en donde sea práctico, términos de búsqueda utilizados):

Caplus (STM), REGISTRY (STM)

C. DOCUMENTOS QUE SE CONSIDERA QUE SON RELEVANTES

Categoría*	Cita del documento, con indicación, en donde sea apropiado, de los pasajes relevantes	Relevante para la Relv. No.
X	JP 2004-18506 A (Bayer AG.), 22 Enero 2004 (22.01.04), Reivindicaciones; ejemplos & WO 2004/000796 A1 & EP 1517886 A1	1-6
X	JP 2004-51614 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.) , 19 Febrero 2004 (19.02.04), Reivindicaciones; ejemplos & WO 2003/011028 A1	1-6
X	JP 2003-34673 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 07 Febrero 2003 (07.02.03), Reivindicaciones; ejemplos & WO 2002/094765 A2 & EP 1390342 A2 & US 2004/152598 A1	1-6

☒ Documentos adicionales se enlistan en la continuación del bloque C ☐ Véase familia de patentes anexa.

* Categorías especiales de los documentos citados

"A" documento que define el estado general de la técnica el cual no se considera ser de particular relevancia.

"E" documento anterior publicado en o después de la fecha de presentación internacional.

"L" documento el cual puede arrojar dudas sobre la(s) reivindicación(es) de prioridad o el cual se cita para establecer la fecha de publicación de otra cita u otra razón especial (como es específico)

"O" documento que se refiere a una descripción oral, uso, exhibición u otro medio

"P" documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero después de la fecha de prioridad reivindicada.

"I" documento posterior publicado después de la fecha de presentación internacional o fecha de prioridad y no en conflicto con la solicitud, pero citado para entender el principio o teoría fundamental de la invención.

"X" documento de relevancia particular; la invención reivindicada no puede ser considerada nueva o no se puede considerar que involucre una etapa inventiva cuando el documento es considerado de manera aislada.

"Y" documento de particular relevancia; no se puede considerar que la invención involucre una etapa inventiva cuando el documento es combinado con uno o más de tales documentos, tal combinación sería obvia para una persona experimentada en la técnica.

"Z" documento miembro de la misma familia de patentes.

Fecha de la terminación real de la búsqueda internacional

07 Septiembre 2005 (07.09.05)

Fecha de envío del reporte de búsqueda internacional

27 Septiembre 2005 (27.09.05)

Nombre y dirección de correspondencia de la ISA/US

Oficina de Patentes Japonesa

Funcionario Autorizado

Fax No.:

Teléfono No.

C. (Continuación) DOCUMENTOS QUE SE CONSIDERA QUE SON RELEVANTES

Categoría*	Cita del documento, con indicación, en donde sea apropiado, de los pasajes relevantes	Relevante para la Relv. No.
X	JP 2001-335563 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 04 Diciembre 2001 (04.12.01), Reivindicaciones; ejemplos & WO 2001/002354 A1 & EP 1193254 A1 & US 6875768 B1	1-6
X	JP 2001-131141 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 15 Mayo 2001 (15.05.01), Reivindicaciones; ejemplos & EP 1006107 A2 & US 6603044 B1	1-6
X	JP 2001-163654 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 19 Junio 2001 (19.06.01), Ejemplos referenciales & WO 2001/023350 A1 & EP 1216968 A1 & US 6639109 B1	1-6
X A	JP 2001-335559 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 04 Diciembre, 2001 (04.12.01), Método de producción (Familia: ninguna)	1-4 5-6

(TRANSLATION)

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

Applicant's or agent's file reference W2528-000000	FOR FURTHER ACTION see Form PCT/ISA/220 as well as, where applicable, item 5 below.	
International application No. PCT/JP2005/015208	International Filing date (day/month/year) 22/08/2005	(Earliest) Priority Date (day/month/year) 23/08/2004
Applicant: NIHON NOHYAKU CO., LTD.		

This international search report has been prepared by this International Searching Authority and is transmitted to the applicant according to Article 18. A copy is being transmitted to the International Bureau.

This international search report consists of a total of 3 sheets.

☐ It is also accompanied by a copy of each prior art document cited in this report.

1. Basis of the report

a. With regard to the language, the international search was carried out on the basis of:

☐ the international application in the language in which it was filed

b. ☐ With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, see Box No. I.

2. ☐ Certain claims were found unsearchable (see Box No. II).

3. ☐ Unity of invention is lacking (see Box No. III).

4. With regard to the title,

☒ the text is approved as submitted by the applicant.

☐ the text has been established by this Authority to read as follows:

5. With regard to the abstract,

☒ the text is approved as submitted by the applicant.

☐ the text has been established, according to Rule 38.2(b), by this Authority as it appears in Box No. IV. The applicant may, within one month from the date of mailing of this international search report, submit comments to this Authority.

6. With regard to the drawings,

a. the figure of the drawings to be published with the abstract is Figure No. _____

☐ as suggested by the applicant

☐ as selected by this Authority, because the applicant failed to suggest a figure.

☐ as selected by this Authority, because this figure better characterizes the invention.

b. ☒ none of the figures is to be published with the abstract

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/015208

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.⁷ C07C317/28, A01N37/18, 41/10, 43/40, C07C323/42, C07D213/64,
213/70, 213/75, 239/42//C07M7:00

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.⁷ C07C317/28, A01N37/18, 41/10, 43/40, C07C323/42, C07D213/64,
213/70, 213/75, 239/42

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2004-18506 A (Bayer AG.), 22 January, 2004 (22.01.04), Claims; examples & WO 2004/000796 A1 & EP 1517886 A1	1-6
X	JP 2004-51614 A (Nissan Chemical Industries, Ltd.), 19 February, 2004 (19.02.04), Claims; examples & WO 2003/011028 A1	1-6
X	JP 2003-34673 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 07 February, 2003 (07.02.03), Claims; examples & WO 2002/094765 A2 & EP 1390342 A2 & US 2004/152598 A1	1-6

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
07 September, 2005 (07.09.05)

Date of mailing of the international search report
27 September, 2005 (27.09.05)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (January 2004)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2005/015208

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2001-335563 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 04 December, 2001 (04.12.01), Claims; examples & WO 2001/002354 A1 & EP 1193254 A1 & US 6875768 B1	1-6
X	JP 2001-131141 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 15 May, 2001 (15.05.01), Claims; examples & EP 1006107 A2 & US 6603044 B1	1-6
X	JP 2001-163854 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 19 June, 2001 (19.06.01), Referential examples & WO 2001/023350 A1 & EP 1216988 A1 & US 6639109 B1	1-6
X A	JP 2001-335559 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 04 December, 2001 (04.12.01), Production method (Family: none)	1-4 5-6

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 07-022198-00000-0000
Fec: 2007-03-05 14:59:14 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tm. 11 PATENTERYU
Ene: 378 FASENACIONAL
Art 411 DE REGISTRO Y PATENTE

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

**REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT**

PATENTE DE INVENCION []

MODELO DE UTILIDAD [✓]

- ◆ Indicación de que se solicita la concesión de una patente [✓]
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud [✓]
- ◆ Descripción de la invención [✓]
- ◆ Dibujos de ser estos pertinentes [✓]
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas [✓]

COMPLETA [✓]

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

ESQUEMA DE TRAZADO []

- ◆ Indicación de que se solicita el registro de un Esquema de Trazado []
- ◆ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ◆ Representación gráfica del esquema trazado []
- ◆ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Edgar Uscam

Firma Responsable

Fecha 06-03-07

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax: 350 52 20
E-mail: Info@slc.gov.co
www.slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

240

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CUBILLOS MENDOZA GERMAN ALONSO

REFERENCIA	Radicación No.	7 22198
	Solicitud internacional	OCT/JP2005/015208
	Fecha inicio fase nacional	23/03/2007
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	4323

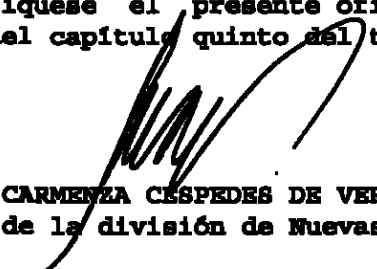
Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

2. La solicitud no contiene el poder debidamente otorgado, con el lleno de los requisitos exigidos por los artículos 63 y subsiguientes del Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, deberá presentar el documento que acredita la existencia y representación legal de la sociedad solicitante, cuando ésta fuere persona jurídica.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CRESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 13 ABR 2007
adpall