



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Organization CSA Ltda

No. 1
RGF

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

08-8493

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO 3-ACILAMINO BENZANTILIDAS INSECTICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE BAYER CROPS SCIENCE AG

DOMICILIO MONHEIM, ALEMANIA

74. APODERADO EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C., _____



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-008493- -00000-0000

Fecha: 2008-01-29 16:42:17
Tra. 11 PATENTEIYII
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 NUECREACION
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 113

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

29 Feb 2008

SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.
☒ Capítulo I.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☐ Capítulo II.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: **BAYER CROPSCIENCE AG**
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de Alemania.

Dirección: Alfred Nobel Strasse 50,
40789 Monheim,
Alemania

Domicilio: Monheim,
Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **EMILIO FERRERO**
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax: 211 86 50
E-mail: clientes@cavelier.com
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número 438.019 T.P 31.929

4

INVENTOR (ES)
(72)

1. **Akihiko YANAGI**
2-40-11 Higashijonan,
Oyama-shi,
Tochigi 323-0825,
Japón

3. **Katsuaki WADA**
5-12-15 Nakakuki,
Oyama-shi,
Tochigi 323-0806,
Japón

5. **Jun MIHARA**
2-11-1 Ekihigashidouri,
Oyama-shi,
Tochigi 323-0022,
Japón

7. **Eiichi SHIMOJO**
4-16-1 Nishiyonan,
Oyama-shi,
Tochigi 323-0820,
Japón

2. **Yukiyoshi WATANABE**
2-8-24 Hanagaki-cho,
Oyama-shi,
Tochigi 323-0027,
Japón

4. **Tetsuya MURATA**
7-16-24-202 Joto,
Oyama-shi,
Tochigi 323-0822,
Japón

6. **Katsuhiko SHIBUYA**
6-14-4 Midori,
Minamikawachi-machi,
Kawachi-gun,
Tochigi 329-0433,
Japón

8. **Akira EMOTO**
1-23-13 Ekihigashidouri,
Oyama-shi,
Tochigi 323-0022,
Japón

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2006/007203

Fecha: 21 de julio de 2006

Publicación Internacional No. WO 2007/017075 A1

Fecha: 15 de febrero de 2007

6

Título (54)

3-ACILAMINO BENZANILIDAS INSECTICIDAS

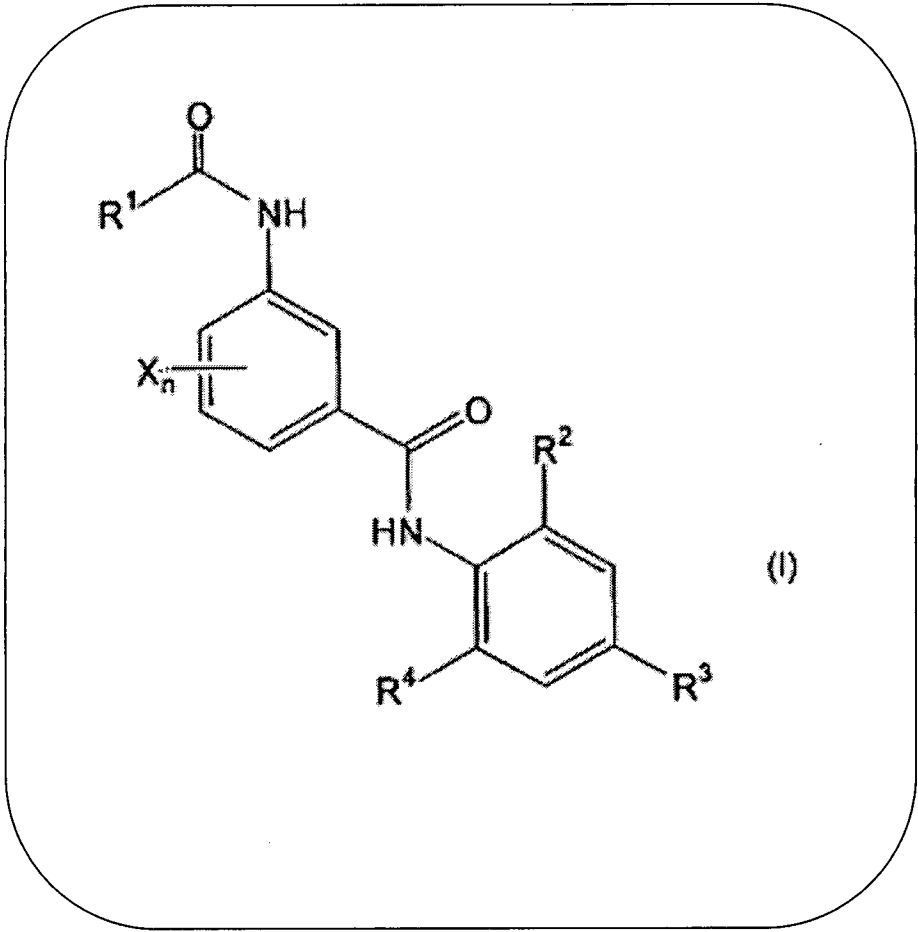
2

7 Clasificación Internacional (51) <u>C07C 237/042</u>			
8 Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
	<u>JP</u>	<u>29 de julio de 2005</u>	<u>2005-220049</u>
9 Comprobante de pago No.: <u>08-1,693</u> Fecha: <u>8 de enero de 2008</u>			
10 Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 501.000.oo. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poderes, si fuere el caso. ☐ Documento de cesión del inventor 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 efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar 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. ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS			

3

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA : 
C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

7/66 JGG

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2007/017075 A1

Descripción:

Páginas 38 en el idioma original

Páginas 43 en español

Reivindicaciones: Número (s) 15

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210.** Informe de Búsqueda Internacional.

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA
FASE INTERNACIONAL**

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4a N° 72-35
BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA

179

Representación y Poder con autenticación notarial y Apostille para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias.

Representation and Power-of- Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER- OF- ATTORNEY

Yo (nosotros), abajo firmado (s)/I (we), the undersigned
Bayer CropScience AG

domiciliado (s) en/of Alfred-Nobel-Str. 50,

40789 Monheim, Germany, hereby ratify the patent application

No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72 35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciled at Carrera 4ª N° 72 35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be

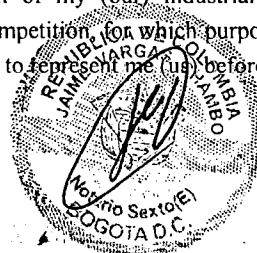
taken again in their sequence by the principal, the first or second alternate depending on the case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time. 24 FEB. 2009

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above named attorneys at law, so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons.

© CAVELIER ABOGADOS

WPPODE01-179 (MINUTA 12.1.1.2.5)



6

administrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

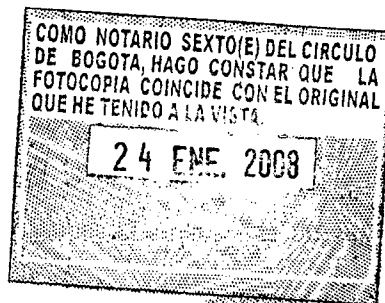
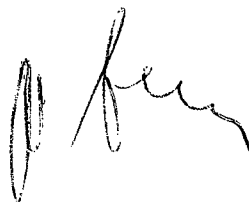
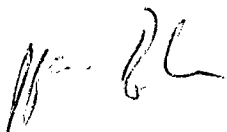
with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, domain names, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Dado y firmado hoy/Given and signed this 12th of February, 2003
en/in Leverkusen
por/by Dr. Axel Bader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Firma

Signature

Bayer CropScience AG



AUTENTICACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

El suscrito Notario Certifica: Que la firma que antecede de
Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

es auténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo
de Secretarios
de la compañía Bayer CropScience AG

sociedad que actualmente existe y está organizada de acuerdo a
las leyes de Alemania

que la dirección de dicha compañía es Alfred Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Alemania

y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

Todos los hechos anteriores le constan por haber examinado los
documentos respectivos y de todo ello da fe.

Dado y firmado en Leverkusen

El 12 de febrero, 2003

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature
of

Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jesse
is authentic, that the signatory currently acts in the position of
secretaries
of the company Bayer CropScience AG

a company currently existing and organized under the laws of
Germany

that the address is Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Germany

and that the signatory has the power to grant this document.

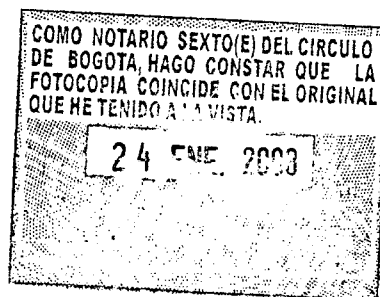
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon
examination of the corresponding documents.

Given and signed in Leverkusen

On 12th of February, 2003

El Notario Público
(Firma-sello)

The Notary Public
(Signature-seal)



8

URNr. 242/2003

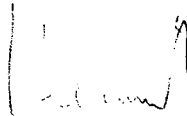
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

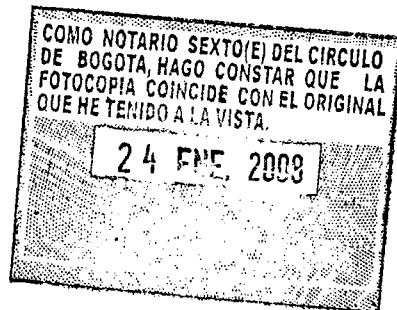
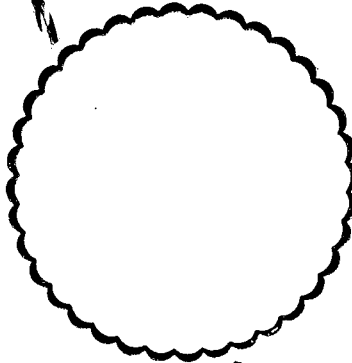
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheilige aufgrund Einsicht in das Handelsregister des
Amtsgerichts Langenfeld - HRB 3990 -, daß die genannten Herren
berechtigt sind, die Bayer CropScience Aktiengesellschaft in
Monheim am Rhein als Prokuristen einzeln zu vertreten.

Leverkusen, den 12. Februar 2003


Notar



APPROBÉ
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde

2. Ist unterschrieben von: Dirk Heiderhoff

3. In seiner Eigenschaft als: Notar

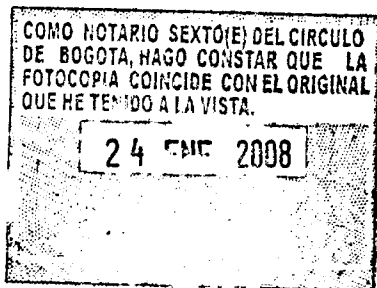
4. Sie ist versehen mit dem Stempel/Siegel des (des) Notars Dirk Heiderhoff
in Leverkusen

5. in Köln
Beitrag: 17. FEB 2003

7. Nach dem Vorsitzenden des Landgerichts Köln

8. unter Nr. 482/03

9. Stempel/Siegel: 10. Unterschrift: Carla Caliebe



2008-150

9

TRADUCCION OFICIAL No. 9450

de un documento escrito en Alemán, efectuada por Luz Arriaga de Herber, resolución del Ministerio de Justicia 599 del 6 de marzo 1978.-

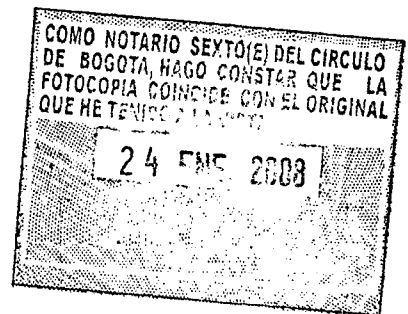
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia. Dado y firmado el 12 de febrero 2003 en Leverkusen, Alemania, por los señores Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse.

Autenticación en español e inglés de las firmas antecedentes y certificación de existencia de la sociedad por el notario de Leverkusen, Dirk Heiderhoff.

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCCION OFICIAL



10

Protocolo notarial 242/2003

Certifico la autenticidad de la firma antecedentes puestas
ante mí por los señores

1. Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, con domicilio comercial en D-
51368, Bayerwerk, Alemania,
2. Dr. Axel Bader, con domicilio comercial en D-51368,
Bayerwerk, Alemania,

a quienes conozco en persona.

Certifico, por haber tenido la lista el registro de comercio
del Juzgado Municipal de Langenfeld -HRB 3990- que los
mencionados señores están facultados, en su calidad de
apoderados, para representar individualmente a la firma Bayer
CropScience Aktiengesellschaft, domiciliada en Monheim am
Rhein.

Leverkusen, 12 de febrero 2003

(Hilo y oblea notarial)

Fdo.: firma ilegible, Notario

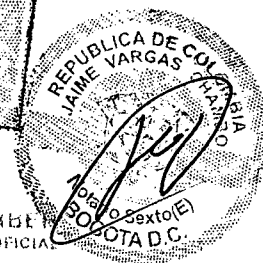
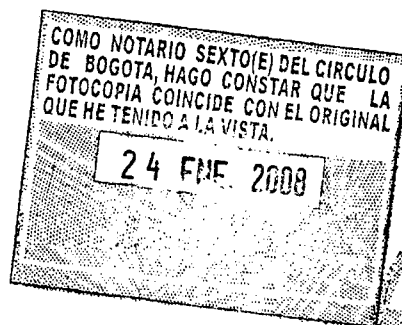
Costas

Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45

EUROS 10,-



LAZARILLO DE HERBES
INAGUATORIA DE HERBES OFICIAL
Resolución No. 000.000.000

71

Derechos Art. 58	EUROS 10,-
Derechos Art. 150	Euros 13,-
IVA	<u>EUROS 5,28</u>
Total	EUROS 38,28
Edo.: Heiderhoff, notario	

APOSTILLA

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por Dirk Heiderhoff

3. Actuando en calidad de notario

4. Lleva el sello del notario Dirk Heiderhoff, notario en
Leverkusen

Certificado

5. en Colonia

6. El 17 de febrero 2003

7 por el Vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 482/03

9. Sello

10. Firma

El Presidente del

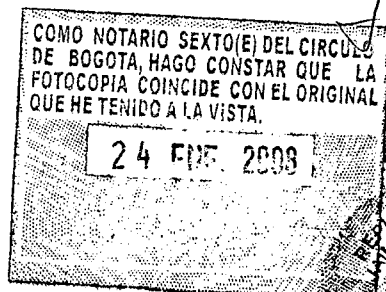
Edo.: firma ilegible

Tribunal Regional de Colonia

Caliebe

ES TRADUCCIÓN FIEL COMPLETA, de la cual se deja copia en los
archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 14 de marzo 2003.

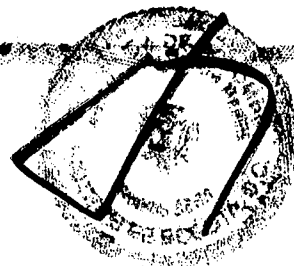


MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993
Cuya firma aparece en el
documento desempeña
las funciones indicadas

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
1803 MAR 18 P 12:24
JEFES DE LEGACIONES
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LOS ANTERIOR(ES) FIR-
MA(S) PUESTA(S) POR Georgio de
Felber
IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s) _____
ES(SON) AUTENTICAS
SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003



COMO NOTARIO SEXTO(E) DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE VISTO A VISTA.
24 MAR 2003



TRADUCCIÓN OFICIAL No. 10.09/02 realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia y registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

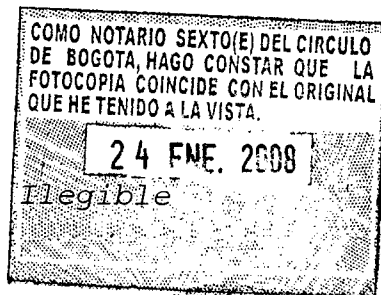
A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Bayer CropScience AG, domiciliado en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania, por el presente ratifica la solicitud de patente No. 03.005.574, presentada por EMILIO FERRERO el 28 de enero de 2003 y otorga derechos de representación y poder a los Doctores EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, tpa. 23555 y GERMÁN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4° No. 72-35.

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003
en Leverkusen
por Dr. Axel Brader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible



(ANEXO)

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (SOCIEDAD) en donde se certifican la firma anterior del Doctor Axel Bader y del Doctor Ralf-Rüdiger Jesse como

DIEGO F. VARGAS Z.

TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 19991

(3)

Secretarios de Bayer CropScience AG, una sociedad actualmente existente y organizada de acuerdo a las leyes de Alemania y con dirección en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania. Dado y firmado en Leverkusen el 12 de febrero del 2003.

Firma Ilegible
Notario Público

Sello

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

Respaldo:

Apostilla expedida por Alemania y certificado el 17 de febrero de 2003 bajo el número 482/03.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación.

DVZ/ID-4268/WPCL002G/COLO 13549-841-002-0

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS Z
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA

COMO NOTARIO SEXTO(E) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA.
24 FEB. 2003



NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 P 12:24

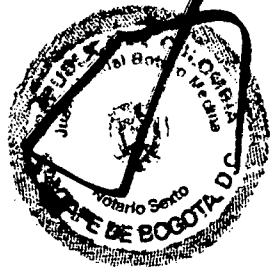
JEFE DE LEJISLACIONES
BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208992

D.F. Vargas
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIOR(ES) FIRMA(S) PUESTA(S) POR D. Vargas
IDENTIFICADOS CON C.E. No.(s) _____
ES(SON) AUTENTICA(S)
SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA.
24 ENF. 2003



(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
15 February 2007 (15.02.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/017075 A1

(51) International Patent Classification:
C07C 237/42 (2006.01) A01N 37/22 (2006.01)

(JP). EMOTO, Akira [JP/JP]; 1-23-13, Ekihigashidouri, Oyama-shi, Tochigi 323-0022 (JP).

(21) International Application Number:
PCT/EP2006/007203

(74) Common Representative: BAYER CROPSCIENCE AG; Business Planning and Administration, Law and Patents, Patents and Licensing, Building 6100, Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(22) International Filing Date: 21 July 2006 (21.07.2006)

(25) Filing Language: English

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
2005-220049 29 July 2005 (29.07.2005) JP

(71) Applicant (for all designated States except US): BAYER CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): YANAGI, Akihiko [JP/JP]; 2-40-11, Higashijonan, Oyama-shi, Tochigi 323-0825 (JP). WATANABE, Yukiyoshi [JP/JP]; 2-8-24, Hanagaki-cho, Oyama-shi, Tochigi 323-0027 (JP). WADA, Katsuaki [JP/JP]; 5-12-15, Nakakuki, Oyama-shi, Tochigi 323-0806 (JP). MURATA, Tetsuya [JP/JP]; 7-16-24-202, Joto, Oyama-shi, Tochigi 323-0822 (JP). MIHARA, Jun [JP/JP]; 2-11-1, Ekihigashidouri, Oyama-shi, Tochigi 323-0022 (JP). SHIBUYA, Katsuhiko [JP/JP]; 6-14-4, Midori, Minamikawachi-machi, Kawachi-gun, Tochigi 329-0433 (JP). SHIMOJO, Eiichi [JP/JP]; 4-16-1 Nishiyonan, Oyama-shi, Tochigi 323-0820

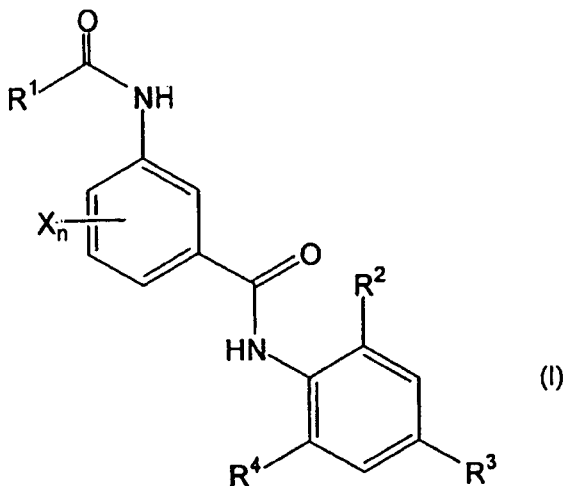
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— with international search report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: INSECTICIDAL 3-ACYLAMINO BENZANILIDES



(57) Abstract: Novel 3-acylaminobenzanilides of the formula (I) wherein R¹ represents phenyl which may be substituted or a 5-member or 6-member heterocyclic ring group, which may be substituted, containing at least one heteroatom selected from the group consisting of N, O, and S; R² represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl; R³ represents C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, or C₁₋₆ haloalkylsulfonyl; R⁴ represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl; X represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl; and n represents 0 or 1 and the compounds are used as insecticides, and a use of the new compounds as insecticides.

WO 2007/017075 A1

BCS KK/Patent/YN/

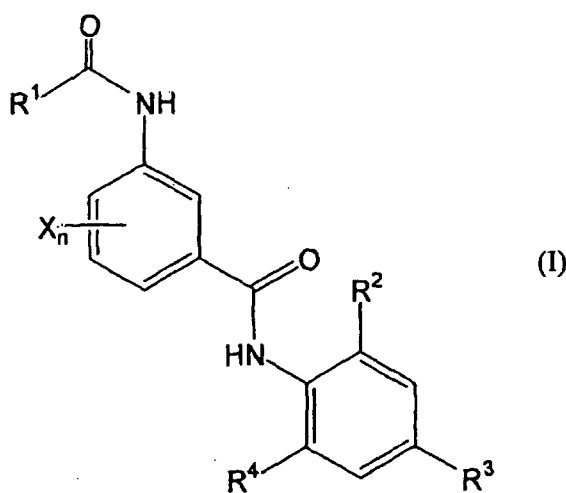
NTP 837/BCS 05-7006

INSECTICIDAL 3-ACYLAMINO BENZANILIDES

The invention relates to new 3-acylaminobenzanilides and their utilization as insecticides.

PCT International Publication WO 2005/021488 pamphlet describes that benzamides are useful as insecticides.

There have now been found novel 3-acylaminobenzanilides of the formula (I)



wherein R¹ represents phenyl which may be substituted or a 5-member or 6-member heterocyclic ring group, which may be substituted, containing at least one hetero-atom selected from the group consisting of N, O, and S;

R² represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl;

R³ represents C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, or C₁₋₆ haloalkylsulfonyl;

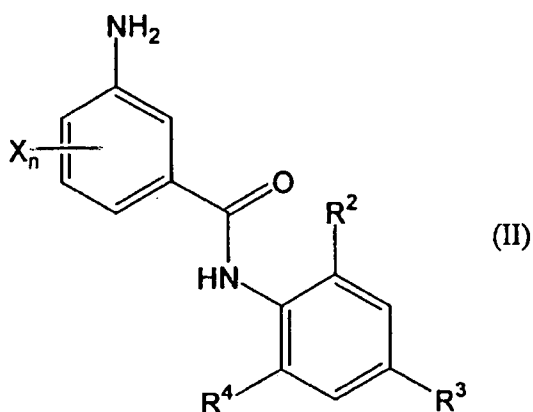
R⁴ represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl;

X represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl; and
n represents 0 or 1.

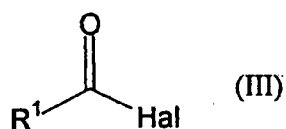
The compound of the formula (I) of the invention can be obtained by the following
production methods (a) and (b) in which

Production method (a):

compounds of the formula (II)



wherein R², R³, R⁴, X, and n are same as defined above,
are reacted with compounds of the formula (III)

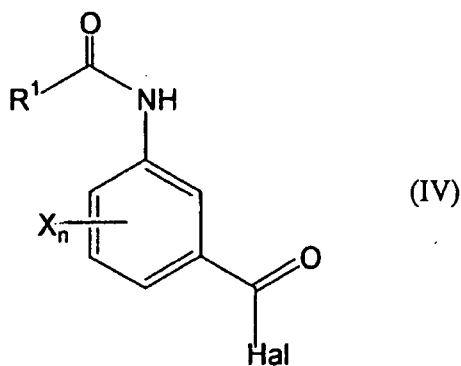


wherein R¹ is same as defined above and Hal represents a halogen,
in the presence of inert solvents and if appropriate, in the presence of a base and a
phase transfer catalyst,
or

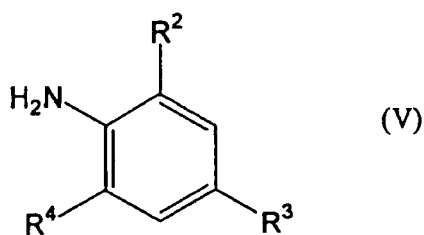
Production method (b):

compounds of the formula (IV)

17



wherein R^1 , X , n , and Hal are same as defined above,
are reacted with compounds of the formula (V)



wherein R^2 , R^3 , and R^4 are same as defined,
in the presence of inert solvents and if appropriate, in the presence of a base and a
phase transfer catalyst.

According to the invention, 3-acylamino-benzanilides of the formula (I) as mentioned
above show a powerful insecticidal effect.

The compounds of the formula (I) surprisingly shows a significantly outstanding
insecticidal effect as compared with analogous compounds.

In this specification, "halogen" represents fluorine, chlorine, bromine, and iodine and
preferably fluorine, chlorine, and bromine.

"Alkyl" represents, for example, a straight or branched C_{1-12} alkyl such as methyl, ethyl,

n- or iso-propyl, n-, iso-, sec-, or tert-butyl, n-pentyl, n-hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-decyl, n-undecyl, and n-dodecyl, preferably a C₁₋₆ alkyl.

The respective alkyl portions of "haloalkyl", "haloalkoxy", "haloalkylthio", "haloalkylsulfinyl", "haloalkylsulfonyl", "alkoxy", "alkylthio", "alkylsulfinyl", and "alkylsulfonyl" may be the same as described in description "alkyl".

The respective halogen portions of "haloalkyl", "haloalkoxy", "haloalkylthio", "haloalkylsulfinyl", and "haloalkylsulfonyl" may be the same as described in description "halogen".

"5-membered or 6-membered heterocyclic ring group" represents those containing at least one hetero-atom selected from a group consisting of N, O, and S and may include thienyl, furyl, pyrazolyl, imidazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, oxadiazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, and triazinyl and particularly, thienyl, furyl, pyrazolyl, isoxazolyl, thiadiazolyl, pyridyl and pyrimidinyl.

With respect to the compounds of the formula (I) of the invention, the following compounds are preferable:

wherein R¹ represents a phenyl optionally substituted with at least one group selected from C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkoxysulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkoxysulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen, or a 5-membered or 6-membered heterocyclic ring group containing at least one hetero-atom selected from the group consisting of N, O, and S and optionally substituted with at least one group selected from C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen;

R² represents halogen, C₁₋₄ alkyl, or C₁₋₄ haloalkyl;

R³ represents C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, or

C₁₋₄ haloalkylsulfonyl;

R⁴ represents halogen, C₁₋₄ alkyl, or C₁₋₄ haloalkyl;

X represents halogen, C₁₋₄ alkyl, or C₁₋₄ haloalkyl; and

n represents 0 or 1.

With respect to the compounds of the formula (I), the following compounds are particularly preferable:

wherein R¹ represents phenyl optionally substituted with at least one group selected from the group consisting of C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ alkylsulfinyl, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, C₁₋₄ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen; or pyridyl, pyrazolyl, thienyl, furyl, isoxazolyl, or thiadiazolyl optionally substituted with at least one group selected from the group consisting of C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ alkylsulfinyl, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, C₁₋₄ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen;

R² represents fluoro, chloro, iodo, methyl, ethyl, propyl, butyl, trifluoromethyl, or pentafluoroethyl;

R³ represents C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, or C₁₋₄ haloalkylsulfonyl;

R⁴ represents fluoro, chloro, iodo, methyl, ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, t-butyl, trifluoromethyl or pentafluoroethyl;

X represents fluoro, chloro, or methyl; and

n represents 0 or 1.

Among compounds of the formula (I), the following compounds are very particularly preferable:

wherein R¹ represents phenyl optionally substituted with one to three groups selected

from the group consisting of methyl, trifluoromethyl, fluorine, chlorine, bromine, methoxy, trifluoromethoxy, nitro and tertiary butyl; or pyridyl, pyrazolyl, thienyl, furyl, isoxazolyl, or thiadiazolyl optionally substituted with one to three groups selected from the group consisting of methyl, trifluoromethyl, fluorine, chlorine, bromine, methoxy, trifluoromethoxy, nitro and tertiary butyl;

R² represents methyl;

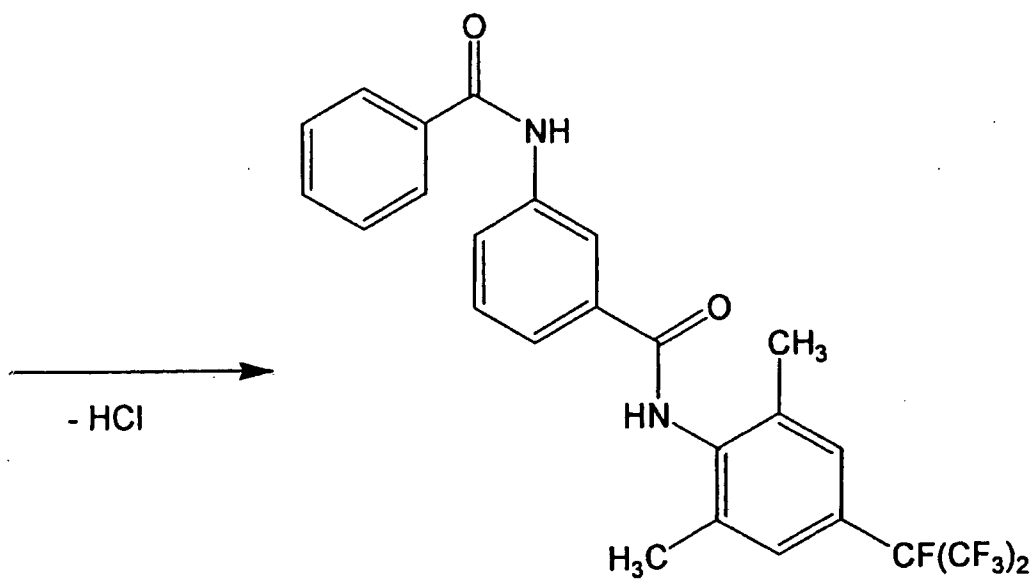
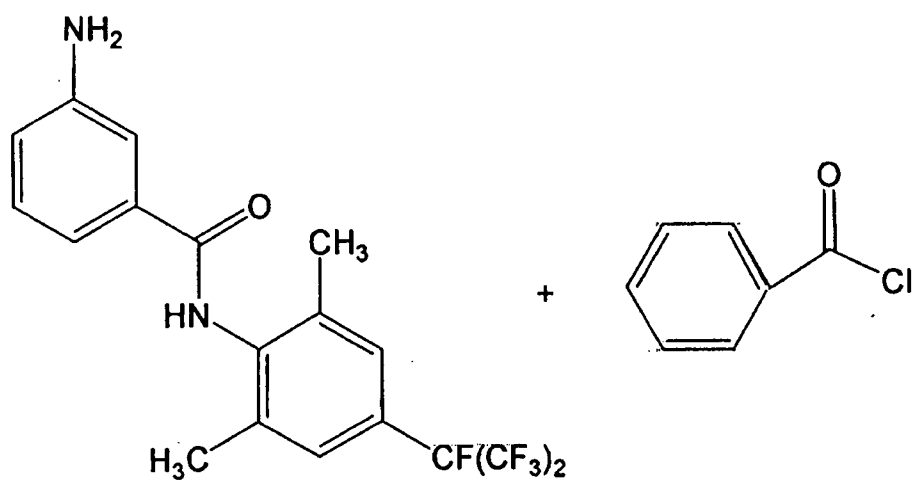
R³ represents perfluoroisopropyl;

R⁴ represents iodo, methyl, ethyl or pentafluoroethyl;

X represents fluoro, chloro, or methyl; and

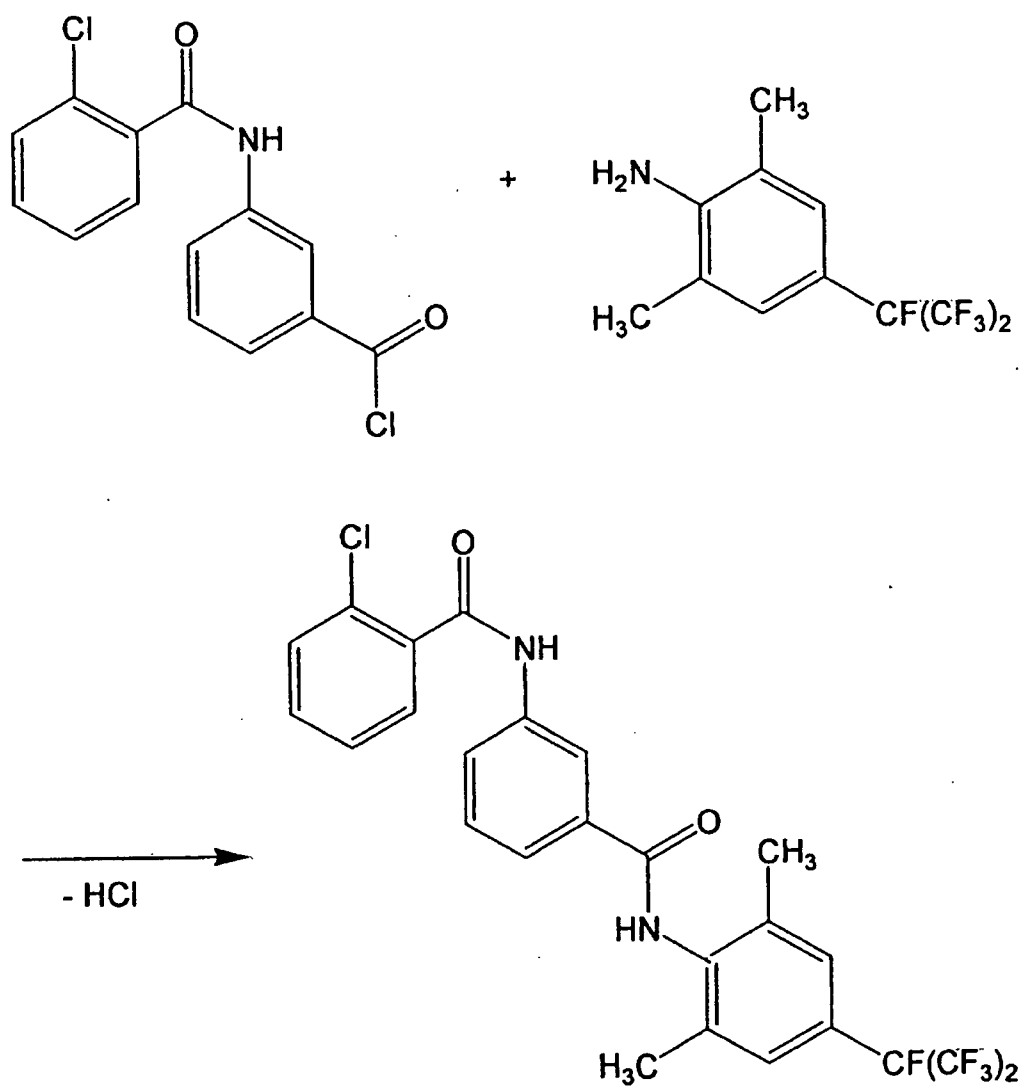
n represents 0 or 1.

The production method (a) can be defined by the following reaction formula, for example, in the case 3-amino-N-(2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide and benzoyl chloride are used as starting raw materials.



The production method (b) can be defined by the following reaction formula, for example, in the case 3-(2-chlorobenzoyl)aminobenzoic acid chloride and 2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylaniline are used as starting raw materials.

22



The compounds of the formula (II) to be used as a raw material in the above-mentioned production method (a) are known compounds described in WO 2005/021458 and can easily be synthesized according to the methods described in the international publication.

Representative examples of the compounds of the formula (II) include;
3-amino-N-(2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide,

3-amino-N-(2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)-2-fluorobenzamide,
3-amino-N-(2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)-2-chlorobenzamide,
3-amino-N-(2-ethyl-6-methyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide,
3-amino-N-(2-isopropyl-6-methyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide,
3-amino-N-(2,6-diethyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide,
3-amino-N-(2,6-dichloro-4-heptafluoro-n-propylthiophenyl)benzamide,
3-amino-N-(2,6-dichloro-4-heptafluoro-n-propylthiophenyl)benzamide, and
3-amino-N-(2,6-dichloro-4-heptafluoro-n-propylsulfonylphenyl)benzamide.

The compounds of the formula (III) to be used as a raw material in the above-mentioned production method (a) are known compounds and many are commercialized. Or, they can easily be synthesized according to conventional methods from corresponding known carboxylic acids.

Representative examples of the compounds may include;

benzoyl chloride,
2-chlorobenzoyl chloride,
3-chlorobenzoyl chloride,
4-chlorobenzoyl chloride,
2-fluorobenzoyl chloride,
3-fluorobenzoyl chloride,
4-fluorobenzoyl chloride,
2,3-dichlorobenzoyl chloride,
2,4-dichlorobenzoyl chloride,
2,6-dichlorobenzoyl chloride,
2,3-difluorobenzoyl chloride,
2,4-difluorobenzoyl chloride,
2,6-difluorobenzoyl chloride,

nicotinyl chloride,
4-trifluoromethylnicotinyl chloride,
6-chloronicotinyl chloride,
6-fluoronicotinyl chloride,
2-fluoronicotinyl chloride,
2-chloronicotinyl chloride,
2-bromonicotinyl chloride,
2,6-difluoronicotinyl chloride,
4-chloropicolinoyl chloride,
2-chloroisonicotinyl chloride,
thiophene-3-carbonyl chloride,
2,5-dichlorothiophene-3-carbonyl chloride,
3-chlorothiophene-2-carbonyl chloride,
3-(tert-butyl)-1-methylpyrazol-5-carbonyl chloride,
4-methyl-1,2,3-thiadiazole-5-carbonyl chloride, and
4-furoyl chloride.

The reaction of the above-mentioned production method (a) can be carried out in a proper diluent. Examples of the diluent to be used in that case include aliphatic, alicyclic, and aromatic hydrocarbons (optionally chlorinated) such as pentane, hexane, cyclohexane, petroleum ether, benzene, toluene, xylene, dichloromethane, and dichloroethane; ethers such as ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane, dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF), and diethylene glycol dimethyl ether (DGM); ketones such as acetone, methyl ethyl ketone (MEK), methyl isopropyl ketone, methyl isobutyl ketone (MIBK); nitriles such as acetonitrile, propionitrile, and acrylonitrile; esters such as ethyl acetate and amyl acetate.

25

The production method (a) can be carried out in the presence of a base. Such base may include as inorganic bases, hydroxides, carbonates, and dicarbonates of alkali metals such as sodium hydrogen carbonate, potassium hydrogen carbonate, sodium carbonate, potassium carbonate, lithium hydroxide, sodium hydroxide, and potassium hydroxide; as organic bases, tertiary amines, dialkylaminoanilines, and pyridines such as triethylamine, 1,1,4,4-tetramethylethylenediamine (TMEDA), N,N-dimethylaniline, N,N-diethylaniline, pyridine, 4-dimethylaminopyridine (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octane (DABCO), and 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-ene (DBU).

The production method (a) can be carried out by a method using a phase transfer catalyst. Examples of the diluent to be used in that case include water; aliphatic, alicyclic, and aromatic hydrocarbons (optionally chlorinated) such as pentane, hexane, cyclohexane, benzene, toluene, xylene, ethers such as ethyl ether, methyl ethyl ether, methyl butyl ether, isopropyl ether, and butyl ether.

Examples of the phase transfer catalyst include quaternary ions such as tetramethylammonium bromide, tetrapropylammonium bromide, tetrabutylammonium bromide, tetrabutylammonium bisulfide, tetrabutylammonium iodide, trioctylmethylammonium chloride, benzyltriethylammonium bromide, butylpyridinium bromide, heptylpyridinium bromide, and benzyltriethylammonium chloride; crown ethers such as dibenzo-18-crown-6, dicyclohexyl-18-crown-6, and 18-crown-6; cryptands such as [2.2.2]-cryptate, [2.1.1]-cryptate, [2.2.1]-cryptate, [2.2.B]-cryptate, [2O2O2S]-cryptate, and [3.2.2]-cryptate.

The production method (a) can be carried out substantially in a wide temperature range. Generally, it is about -40 to about 200°C, preferably about -20 to about 150°C. Also, although the reaction is preferably carried out under normal pressure, it can be carried out under increased pressure or reduced pressure.

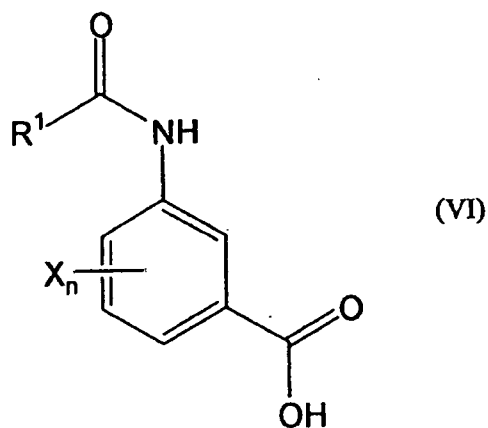
The aimed compounds of the formula (I) can be obtained by reacting 1 mole of the

compounds of the formula (II) with 1 mole or a slight excess of the compounds of the formula (III) in a diluent for example THF in the presence of pyridine.

The compounds of the formula (IV) to be used as raw materials in the production method (b) may include known compounds and represented examples are;

3-(benzoylamino)benzoyl chloride,
3-[(2-fluorobenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(3-fluorobenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(4-fluorobenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(3-trifluoromethylbenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(2-chlorobenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(2,6-difluorobenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(4-chlorobenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(2,4-dichlorobenzoyl)amino]benzoyl chloride,
3-[(2,5-dichlorobenzoyl)amino]benzoyl chloride, and
3-(benzoylamino)-2-methylbenzoyl chloride.

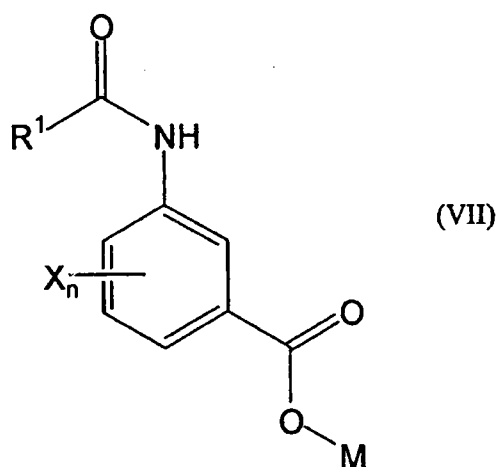
The compounds of the formula (IV) can easily be obtained by halogenation of the benzoic acids corresponding to them represented by the following formula:



2A

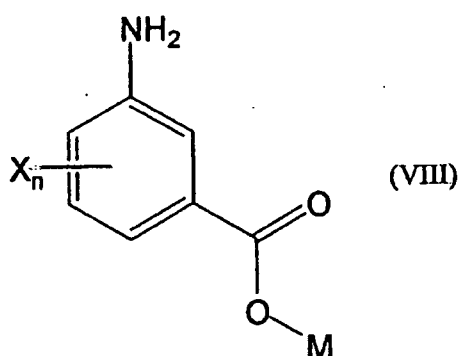
wherein R^1 , X, and n are same as described above.

The above-mentioned compounds of the formula (VI) can easily be obtained by hydrolyzing 3-acylamino benzoic acid esters of the following formula (VII) by conventional methods:



wherein R^1 , X, and n are same as described above and M represents C_{1-4} alkyl.

The above-mentioned compounds of by the formula (VII) can easily be obtained by reaction of the compounds of the following formula:



wherein R^1 , X, and n are same as described above:

with the above-mentioned compounds of the formula (III).

28

The above-mentioned compounds of the formula (VIII) are well-known compounds and representative examples are;

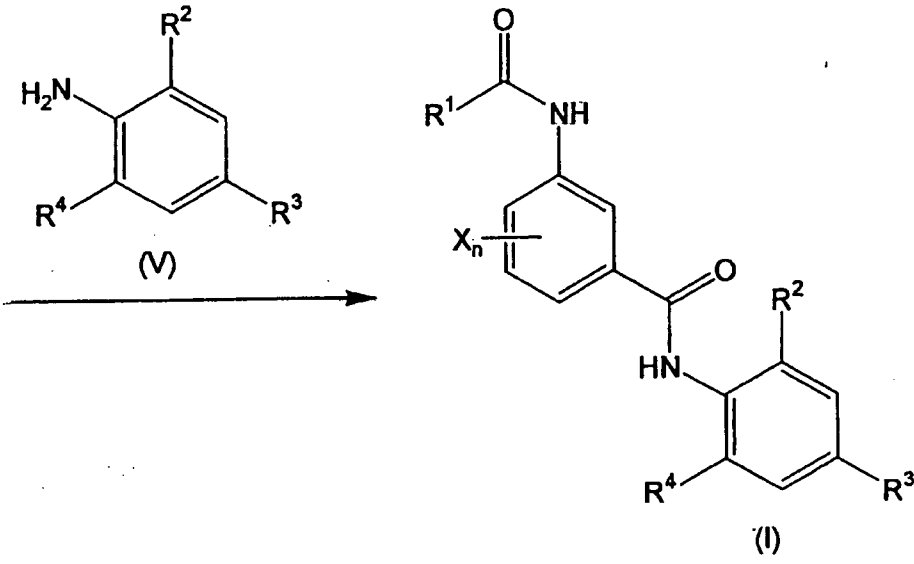
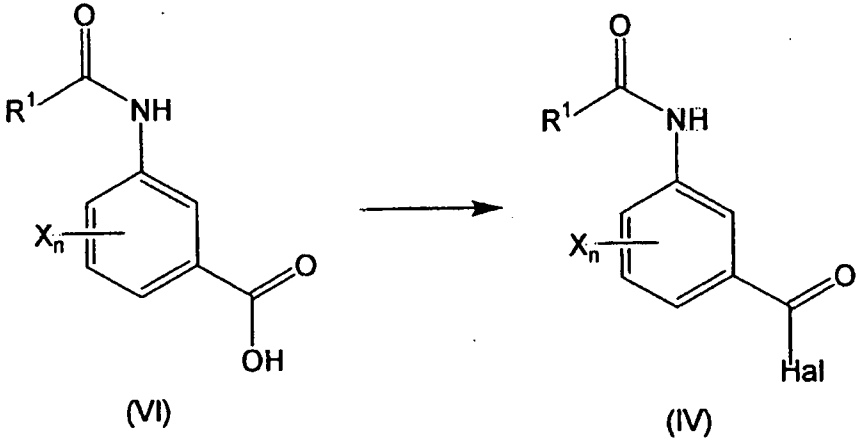
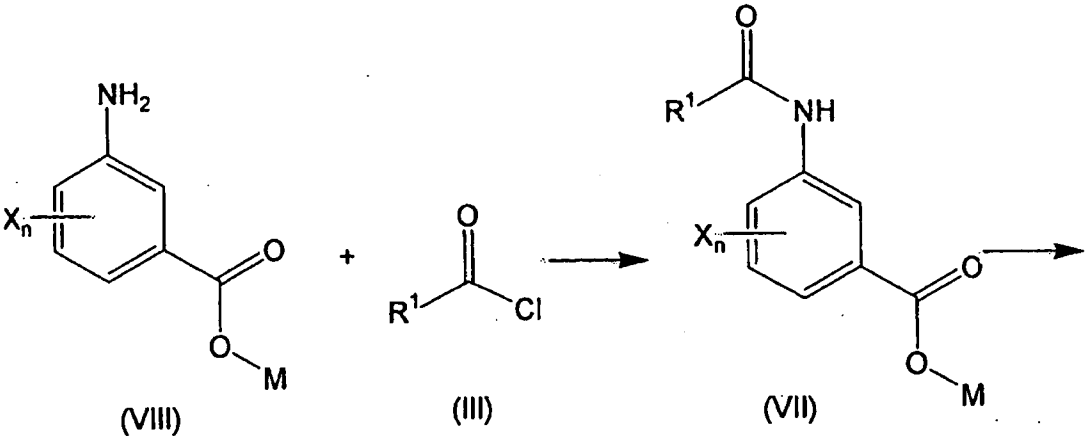
3-aminobenzoic acid methyl ester,
3-aminobenzoic acid ethyl ester,
3-aminobenzoic acid tert-butyl ester,
3-amino-2-methylbenzoic acid ethyl ester,
3-amino-4-fluorobenzoic acid ethyl ester,
3-amino-5-fluorobenzoic acid ethyl ester, and
3-amino-2-bromobenzoic acid ethyl ester.

The compounds of the formula (V), the other raw material, in the production method (b) are well known compounds described in EP1380568 or WO 2005/021488 and can easily be produced according to the methods described in these official gazettes.

Representative examples include;

2,6-dimethyl-4-pentafluoroethylaniline,
2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylaniline,
2-ethyl-4-heptafluoroisopropyl-6-methylaniline,
2,6-diethyl-4-heptafluoroisopropylaniline,
2,6-dichloro-4-heptafluoroisopropylaniline,
2,6-dimethyl-4-heptafluoro-n-propylthioaniline, and
2,6-dichloro-4-heptafluoro-n-propylthioaniline.

A series of the reaction scheme relevant to the production method (b) is as follows.



In the above shown reaction scheme, the reaction of the compound of the formula (VIII) and the compounds of the formula (III) can be carried out in a proper diluent and examples of the diluent to be used in that case include aliphatic, alicyclic, and aromatic hydrocarbons (optionally chlorinated) such as pentane, hexane, cyclohexane, petroleum ether, benzene, toluene, xylene, dichloromethane, and dichloroethane; ethers such as ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane, dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF), and diethylene glycol dimethyl ether (DGM); ketones such as acetone, methyl ethyl ketone (MEK), methyl isopropyl ketone, methyl isobutyl ketone (MIBK); nitriles such as acetonitrile, propionitrile, and acrylonitrile; and esters such as ethyl acetate and amyl acetate.

The above-mentioned reaction may be carried out in the presence of a base and examples of an acid bonding agent used in the above-mentioned reaction may include as inorganic bases, hydroxides, carbonates, and dicarbonates of alkali metals such as sodium hydrogen carbonate, potassium hydrogen carbonate, sodium carbonate, potassium carbonate, lithium hydroxide, sodium hydroxide, and potassium hydroxide; as organic bases, alcolates, tertiary amines, dialkylaminoanilines, and pyridines such as triethylamine, 1,1,4,4,-tetramethylethylenediamine (TMEDA), N,N-dimethylaniline, N,N-diethylaniline, pyridine, 4-dimethylaminopyridine (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octane (DABCO), and 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-ene (DBU).

The above-mentioned reaction can be carried out by a method using a phase transfer catalyst. Examples of the diluent to be used in that case may includes aliphatic, alicyclic, and aromatic hydrocarbons (optionally chlorinated) such as pentane, hexane, cyclohexane, benzene, toluene, and xylene; ethers such as ethyl ether, methyl ethyl ether, methyl butyl ether, isopropyl ether, and butyl ether.

Examples of the phase transfer catalyst include quaternary ions such as tetramethylammonium bromide, tetrapropylammonium bromide, tetrabutylammonium bromide, tetrabutylammonium bisulfide, tetrabutylammonium iodide, trioctylmethylammonium chloride, benzyltriethylammonium bromide, butylpyridinium bromide, heptylpyridinium bromide, and benzyltriethylammonium chloride; crown ethers such as dibenzo-18-crown-6, dicyclohexyl-18-crown-6, and 18-crown-6; cryptands such as [2.2.2]-cryptate, [2.1.1]-cryptate, [2.2.1]-cryptate, [2.2.B]-cryptate, [2O2O2S]-cryptate, and [3.2.2]-cryptate.

The reaction can be carried out substantially in a wide temperature range. Generally, it is about -40 to about 200°C, preferably about -20 to about 110°C. Although the reaction is preferably carried out under normal pressure, it can be carried out under increased pressure or reduced pressure.

The aimed compounds of the formula (VII) can be obtained by reacting 1 mole of the compounds of the formula (VIII) with 1 mole or a slight excess of the compounds of the formula (III) in a diluent for example THF in the presence of pyridine.

The production method of the compounds of the formula (VI) by hydrolysis of the compounds of the formula (VII) can be carried out in a proper diluent and examples of the diluent are water; ethers such as ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane, and tetrahydrofuran (THF); and alcohols such as methanol, ethanol, isopropanol, butanol, and ethylene glycol.

The above-mentioned reaction is carried out using as inorganic bases, hydroxides of alkali metals and alkaline earth metals such as sodium hydroxide, potassium hydroxide, and calcium hydroxide or as inorganic acids, hydrochloric acid and sulfuric acid.

The reaction can be carried out substantially in a wide temperature range. Generally, it is about 0 to about 200°C, preferably between room temperature and about 150°C. Also, although the reaction is preferably carried out under normal pressure, it can be carried out under increased pressure or reduced pressure.

The aimed compounds of the formula (VI) can be obtained by reacting 1 mole of the compound of the formula (VII) with potassium hydroxide in a diluent, for example, a mixed solvent of water and ethanol.

The production method of the compounds of the formula (IV) from the compounds of the formula (VI) can be carried out in a proper diluent and examples of the diluent to be used in that case include aliphatic, alicyclic, and aromatic hydrocarbons (optionally chlorinated) such as hexane, cyclohexane, benzene, toluene, xylene, chlorobenzene, dichlorobenzene, dichloromethane and dichloroethane.

The above-mentioned reaction may be carried out by using as a halogenation agent, thionyl chloride and thionyl bromide and the like, and adding DMF as a catalyst.

The reaction can be carried out substantially in a wide temperature range. Generally, it is about 0 to about 200°C, preferably between room temperature to about 150°C.

Also, although the reaction is preferably carried out under normal pressure, it can be carried out under increased pressure or reduced pressure.

To carry out the reaction, the aimed compounds of the formula (IV) can be obtained by adding a catalytic amount of DMF and reacting 1mole of the compound of the formula (VI) with thionyl chloride in a diluent such as 1,2-dichloroethane.

The final reaction method (b) in the scheme can be carried out in a proper diluent and examples of the diluent to be used in that case include aliphatic, alicyclic, and aromatic hydrocarbons (optionally chlorinated) such as pentane, hexane, cyclohexane, petroleum ether, ligroin, benzene, toluene, xylene, dichloromethane, and dichloroethane;

ethers such as ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane, dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF), and diethylene glycol dimethyl ether (DGM);

ketones such as acetone, methyl ethyl ketone (MEK), methyl isopropyl ketone, methyl

isobutyl ketone (MIBK);

nitriles such as acetonitrile, propionitrile, and acrylonitrile; and

esters such as ethyl acetate and amyl acetate.

The production method (b) can be carried out in the presence of a base. Examples of an acid bonding agent used in the above-mentioned reaction may include as inorganic bases, hydroxides, carbonates, and dicarbonates of alkali metals such as sodium hydrogen carbonate, potassium hydrogen carbonate, sodium carbonate, potassium carbonate, lithium hydroxide, sodium hydroxide, and potassium hydroxide; as organic bases, tertiary amines, dialkylaminoanilines, and pyridines such as triethylamine, 1,1,4,4,-tetramethylethylenediamine (TMEDA), N,N-dimethylaniline, N,N-diethylaniline, pyridine, 4-dimethylaminopyridine (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octane (DABCO), and 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-ene (DBU).

The production method (b) can be carried out by a method using a phase transfer catalyst. Examples of the diluent to be used in that case may be aliphatic, alicyclic, and aromatic hydrocarbons (optionally chlorinated) such as pentane, hexane, cyclohexane, benzene, toluene, and xylene; ethers such as ethyl ether, methyl ethyl ether, methyl butyl ether, isopropyl ether, and butyl ether.

Examples of the phase transfer catalyst include quaternary ions such as tetramethylammonium bromide, tetrapropylammonium bromide, tetrabutylammonium bromide, tetrabutylammonium bisulfide, tetrabutylammonium iodide, trioctylmethylammonium chloride, benzyltriethylammonium bromide, butylpyridinium bromide, heptylpyridinium bromide, and benzyltriethylammonium chloride; crown ethers such as dibenzo-18-crown-6, dicyclohexyl-18-crown-6, and 18-crown-6; cryptands such as [2.2.2]-cryptate, [2.1.1]-cryptate, [2.2.1]-cryptate, [2.2.B]-cryptate, [2O2O2S]-cryptate, and [3.2.2]-cryptate.

The production method (b) can be carried out substantially in a wide temperature range. Generally, it is about -40 to about 200°C, preferably about -20 to about 150°C. Also,

34

although the reaction is preferably carried out under normal pressure, it can be carried out under increased pressure or reduced pressure. The aimed compounds of the formula (I) can be obtained by reacting 1 mole of the compounds of the formula (IV) with 1 mole or a slight excess of the compounds of the formula (V) in a diluent for example THF in the presence of pyridine.

The compounds of the formula (I) show a powerful insecticidal effect. Therefore, the compounds can be used as insecticides. The active compounds of the formula (I) exhibit reliable anti-insects effects to harmful insects without damaging to the grown plants. The compounds of the invention can be used for prevention of the harm of a wide range of various harmful insects, for example, harmful sucking type insects, chewing type insects, and other plant-parasitic insects, storage insects, hygienically harmful insects and prevention of breeding and extermination of them.

Such harmful insects may include the following harmful insects.

Examples of the insects may include Coleoptera such as *Callosobruchus Chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomala rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Monochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, and *Lyctus bruneus*;

Lipidtera such as *Lymantria dispar*, *Malacosoma neustria*, *Pieris rapae*, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Chilo suppressalis*, *Pyrausta nubilalis*, *Ephesia cautella*, *Adoxophyes orana*, *Carpocapsa pomonella*, *Agrotis fucosa*, *Galleria mellonella*, *Plutella maculipennis*, *Heliothis virescens*, and *Phyllocnistis citrella*;

Himiptea such as *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Pseudococcus comstocki*, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicas*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Phopalosiphum pseudobrassicae*, *Stephanitis nashi*, *Nazara* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, and *Pshylla* spp.;

Thysanoptera such as *Thrips palmi*, and *Franklinella occidentalis*;

Orthoptera such as *Blatella germanica*, *Periplaneta americana*, *Gryllotalpa africana*, and *Locusta migratoria migratorioides*;

Isoptera such as *Reticulitermes speratus*, and *Coptotermes formosanus*;

Diptera such as *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipens*,

Anopheles sinensis, *Culex tritaeniorhynchus*, and *Liriomyza trifolii*;

Acarina such as *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*,

Aculops pelekassi, and *Tarsonemus* spp.; and

Ascaris such as *Meloidogyne incognita*, *Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara, *Aphelenchoides besseyi*, *Heterodera glycines*, and *Pratylenchus* spp.

In the veterinary field, the new compounds of the invention can effectively be used to various harmful animal parasites (internal and external parasites) for examples Insecta and Helminth.

Examples of such animal parasites may include the following harmful insects.

Examples of Insecta include *Gastrophilus* spp., *Stomoxys* spp., *Trichodectes* spp., *Rhodnius* spp., *Ctenocephalides canis*, and *Cimex lecturarius*.

Examples of Acarina include *Ornithodoros* spp., *Ixodes* spp, and *Boophilus* spp.

In the invention, the substances having insecticidal effects on the harmful insects including all of the involved insects may sometimes be called insecticides.

In the case the active compounds of the invention are used as insecticides, they can be formed in general formulations. The forms of the formulations are, for example, liquid agents, emulsions, hydrated agents, granular hydrated agents, suspension agents, powder agents, foaming agents, pastes, tablets, granules, aerosol, active compound dampening, natural and synthesized products, microcapsules, coated agents for seeds, formulations provided with combustion apparatus (for example, fumigation and smoking cartridges, cans, and coils as the combustion apparatus), and ULV (cold mist and warm mist).

These formulations can be produced by known methods. For example, the active compounds can be produced by developers, that is, by mixing liquid diluents or carriers; liquid gas diluents or carrier, solid diluents or carriers, and optionally, surfactants, that is, emulsifiers and/or dispersants and/or foam-forming agents with them.

In the case water is used as a developer, organic solvents, for example, may be used as auxiliary solvents.

Examples of the liquid deluents or carriers include aromatic hydrocarbons (e.g. xylene, toluene, alkylnaphthalene); chloroaromatic or chloroaliphatic hydrocarbons (e.g. chlorobenzenes, ethylene chlorides, methylene chlorides), aliphatic hydrocarbons (e.g. cyclohexane, paraffins (e.g. mineral oil fractions)), alcohols (e.g. butanol, glucol, and their ethers and esters), ketones (e.g. acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone, cyclohexanone), strong-polar solvents (e.g. dimethylformamide and dimethyl sulfoxide), and water.

The liquid gas diluents or carriers are those which are gases at normal temperature and normal pressure and examples are aerosol jetting agents such as furan, propane, nitrogen gas, carbon dioxide, halohydrocarbons.

Examples of the solid diluents include milled natural minerals (e.g. kaolin, clay, talc, choke, quartz, attapulgate, montmorillonite, or kieselguhr), milled synthetic minerals (e.g. highly dispersed silicic acid, alumina, silicates).

Examples of the solid carriers for granules include crushed and classified rocks (e.g. calcite, marble, pumice, socialite, muscovite, etc.), synthesized granules of inorganic or organic powders, and fine granules of organic substances (e.g. saw dust, coconut husk, stalk of corns, and stalk of tobacco).

Examples of emulsifiers and/or foaming agents include nonionic and anionic emulsifiers (e.g. polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty acid alcohol ethers (e.g. alkyl aryl polyglycol ether), alkylsulfonic acid salts, alkylsulfuric acid salts,

and arylsulfonic acid salts) and albumin hydrolysis products.

Examples of the dispersants involve lignin sulfite waste solutions, and methyl cellulose.

The solid agents may be used for the formulations (powder agents, granular agents, and emulsions) and examples of the binding agents may include carboxymethyl cellulose, natural and synthetic polymers (e.g. gum arabi, poly(vinyl alcohol), and poly(vinylacetate)).

Coloring agents may be used and examples of the coloring agents include inorganic pigments (e.g. iron oxide, titanium oxide, Prussian blue); organic dyes such as Alizarine dyes, azo dyes, and metal phthalocyanine dyes; and also trace elements such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum, and zinc.

Generally, the formulations may contain the active components in a range of 0.1 to 95% by weight, preferably 0.5 to 90% by weight.

The active compounds of the formula (I) may be in form of mixed agents with other active compounds, for example, insecticides, poisonous feeds, sterilizers, Acarina-cides, Ascaris-cides, anti-molding agents, breeding control agents, and herbicides in commercially usable formulations and application forms produced from these formulations. Herein, examples of the insecticides are organic phosphorus agents, carbamate agents, carboxylate chemical agents, chlorohydrocarbon type chemical agents, and insecticidal substance produced by microorganism.

The active compounds of the formula (I) may be in form of mixed agents with synergists and the formulations and the applications of them may be those which are commercially usable and the synergists are compounds which are not active themselves but intensify the function of the active compounds.

The contents of the active compounds of the formula (I) in commercialized application forms can be changed in a wide range.

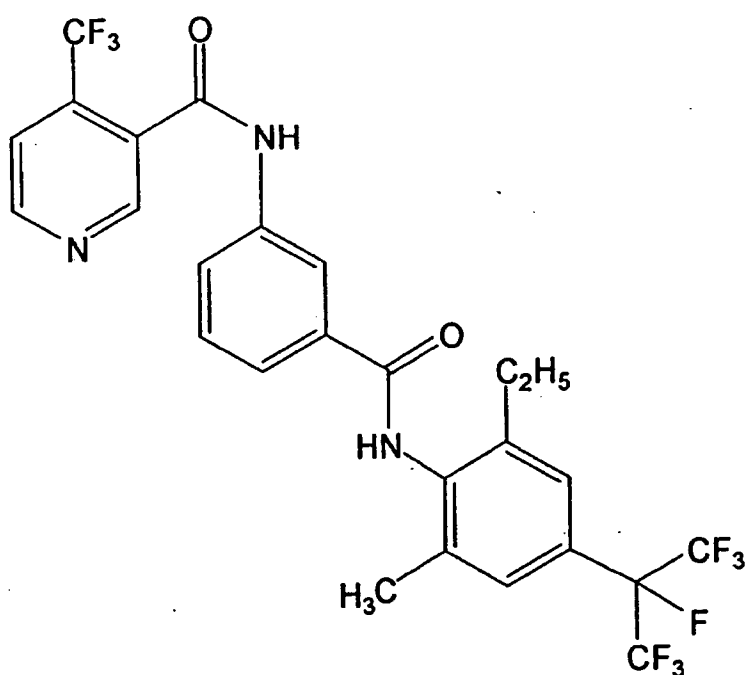
The concentration of the practical use of the active compounds of the formula (I) may be in a range of 0.0000001 to 100% by weight, preferably 0.00001 to 1% by weight.

The compounds of the formula (I) may be used in common manners adequate to the applications.

The active compounds of the invention have efficient stability to alkali of lime substances in the case of use for hygienically harmful insects and harmful insects to storage products and have excellent sustainable property in wood and soil.

Next, the invention will be described more concretely along with Examples; however it is not intended that the invention be limited to the illustrated examples.

Synthesis Example 1

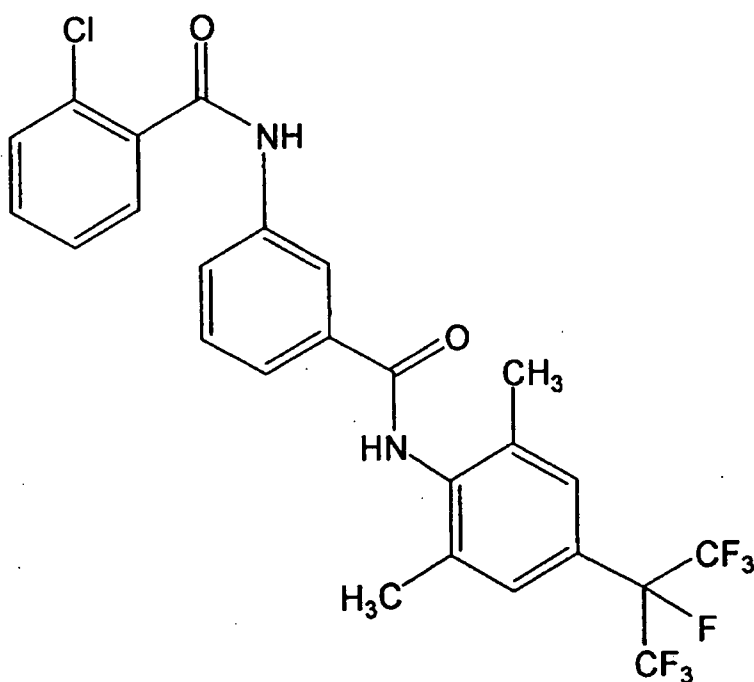


3-amino-N-(2-ethyl-6-methyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide (0.21 g) and triethylamine (0.07 g) were added to THF (30 mL) and 4-trifluoromethylnicotinyl

chloride (0.12 g) was added and stirred at room temperature for 2 hours. On completion of the reaction, the solvent was removed by distillation at a reduced pressure and the obtained residue was refined by silica gel column chromatography (n-hexane-ethyl acetate mixed solvent) to obtain an aimed product, 3-[4-(trifluoromethyl)nicotinyl]amino-N-(2-ethyl-6-methyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide (0.26 g).

melting point: 176 to 179°C

Synthesis Example 2



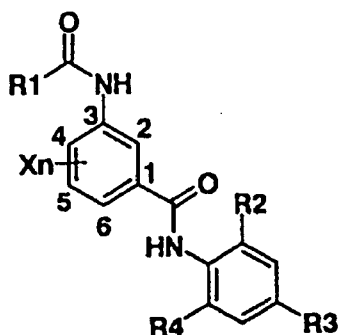
3-(2-chlorobenzoyl)aminobenzoyl chloride (0.30 g) was added to a THF solution (10 mL) of 2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylaniline (0.32 g), pyridine (0.16 mL), and 4-dimethylaminopyridine (0.012 g) at a room temperature. After the reaction mixture was stirred at room temperature for 16 hours, it was poured to water and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with 2N hydrochloric acid and dried with

anhydrous magnesium sulfate. The solvent was removed by distillation at a reduced pressure and the obtained residue was refined by silica gel column chromatography (n-hexane-ethyl acetate mixed solvent) to obtain an aimed product, 3-(2-chlorobenzoyl)amino-N-(2,6-dimethyl-4-heptafluoroisopropylphenyl)benzamide (0.23 g).

melting point: 141 to 145°C

The compounds defined by the formula (I) and obtained by same methods as those of the above-mentioned Synthesis Example 1 or 2 are shown in Table 1. The compounds obtained by the Synthesis Examples 1 and 2 are also shown in Table 1.

[Table 1]



No.	R1	R2	R3	R4	n	X	M.p °C
1	4-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	176-179
2	4,6-difluoropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	181-182
3	6-chloropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	237-238
4	6-chloropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
5	2-fluoropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	102-105
6	2-chloropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	121-124
7	2-bromopyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	118-120

No.	R1	R2	R3	R4	n	X	M.p °C
8	5-chloropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
9	2-methypyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
10	2-methylpyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
11	pyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
12	pyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
13	3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	203-205
14	3,5-dichloropyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
15	3-chloropyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
16	3-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
17	3-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
18	pyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
19	pyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
20	2,6-dichloropyridin-4-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
21	2-chloropyridin-4-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
22	pyridin-4-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
23	pyridin-4-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
24	2,5-dichlorothiophen-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	90-94
25	2-chlorothiophen-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
26	thiophen-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
27	5-chlorothiophen-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
28	3-chlorothiophen-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
29	3-chlorothiophen-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
30	thiophen-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	182
31	thiophen-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
32	furan-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	97-99

No.	R1	R2	R3	R4	n	X	M.p °C
33	furan-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
34	3-(tert-butyl)-1-methylpyrazol-5-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	102-106
35	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	223-224
36	2-iodophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	134-141
37	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	I	0	-	101-105
38	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ F ₅	0	-	91-96
39	4-(trifluoromethoxy)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	153-155
40	2-bromophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	105-109
41	3-bromophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	164-167
42	4-bromophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	205-206
43	3,4-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	133-135
44	2,4-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	129-134
45	3,5-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	175-176
46	2,6-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	137-140
47	2,3-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	123-128
48	2,5-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	115-120
49	4-(trifluoromethyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	195-197
50	3-(trifluoromethyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
51	2-(trifluoromethyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	134-139
52	2,4,6-trifluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	223-224
53	2-nitrophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	110-115
54	2,6-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	118-121
55	2,3-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	165-167
56	2,4-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	187-188
57	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	114-120

No.	R1	R2	R3	R4	n	X	M.p °C
58	3-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	162-165
59	4-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	163-168
60	4-methoxyphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	192-194
61	4-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	174-176
62	3-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	175-177
63	2-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	164-166
64	4-methylphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	213-214
65	3-methylphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
66	2-methylphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	106-112
67	phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
68	4-(trifluoromethoxy)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
69	2,3-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
70	2,5-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
71	4-(trifluoromethyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
72	2,6-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	145-148
73	2,3-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
74	2,4-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
75	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	141-145
76	3-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
77	4-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	211-212
78	4-ethoxyphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
79	4-(trifluoromethylthio)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
80	3-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
81	2-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
82	4-methylsulfinylphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	

44

No.	R1	R2	R3	R4	n	X	M.p °C
83	4-(trifluoromethylsulfinyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
84	4-methylsulfonylphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
85	4-(trifluoromethylsulfonyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
86	2-methylphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
87	phenyl	CH ₃	C ₂ F ₅	CH ₃	0	-	
88	phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	201-204
89	4-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	0	-	
90	2-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	0	-	
91	4-chlorophenyl	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
92	2,6-difluorophenyl	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
93	4-fluorophenyl	Cl	SCF ₃	Cl	0	-	
94	3-fluorophenyl	Cl	SC ₂ F ₅	Cl	0	-	
95	2-fluorophenyl	Cl	SC ₃ F _{7-n}	Cl	0	-	
96	2-chlorophenyl	Cl	S(O)CF ₃	Cl	0	-	
97	3-chlorophenyl	Cl	S(O)C ₂ F ₅	Cl	0	-	
98	4-chlorophenyl	Cl	S(O)C ₃ F _{7-n}	Cl	0	-	
99	2,6-difluorophenyl	Cl	SO ₂ CF ₃	Cl	0	-	
100	2,3-difluorophenyl	Cl	SO ₂ S ₂ F ₅	Cl	0	-	
101	2,4-difluorophenyl	Cl	SO ₂ C ₃ F _{7-n}	Cl	0	-	
102	4-chlorophenyl	CH ₃	SCF ₃	CH ₃	0	-	
103	4-fluorophenyl	CH ₃	SC ₂ F ₅	CH ₃	0	-	
104	2-fluorophenyl	CH ₃	SC ₃ F _{7-n}	CH ₃	0	-	
105	2,4-difluorophenyl	CH ₃	SO ₂ C ₃ F _{7-n}	CH ₃	0	-	
106	4-methylthiophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
107	4-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	

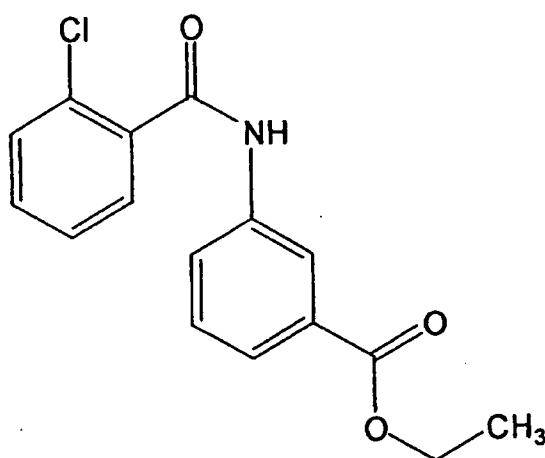
45

No.	R1	R2	R3	R4	n	X	M.p °C
108	4,6-difluoropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
109	6-chloropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
110	3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
111	2-bromophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
112	3,4-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
113	2,4-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
114	2,6-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
115	2,3-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
116	2,5-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
117	3-(trifluoromethyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
118	2-(trifluoromethyl)phenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
119	2,4,6-trifluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
120	2-nitrophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
121	2,6-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
122	2,3-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
123	2,4-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
124	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
125	3-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
126	4-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
127	3-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
128	2-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
129	2,3-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
130	2,5-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
131	2,6-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
132	2,3-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	

46

No.	R1	R2	R3	R4	n	X	M.p °C
133	2,4-difluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
134	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	193-194
135	3-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
136	3-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
137	2-fluorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
138	2-methylphenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
139	4-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	183-184
140	3,5-dichlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-Cl	
141	4-bromophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-Cl	
142	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-Cl	>250
143	2-chlorophenyl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-CH ₃	>250
144	3-methoxy-5-(trifluoromethyl)thiophen-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	230-231
145	5-chloro-1-methyl-3-(trifluoromethyl)pyrazole	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	101-106
146	4-bromo-1-ethyl-3-methylpyrazol-5-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	91-97
147	5-methylisoxazol-4-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	216-217
148	isoxazol-5-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	91-99
149	2-chloropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	120-124
150	6-fluoropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
151	6-fluoropyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
152	3-hydroxypyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
153	4-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
154	6-chloro-4-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	

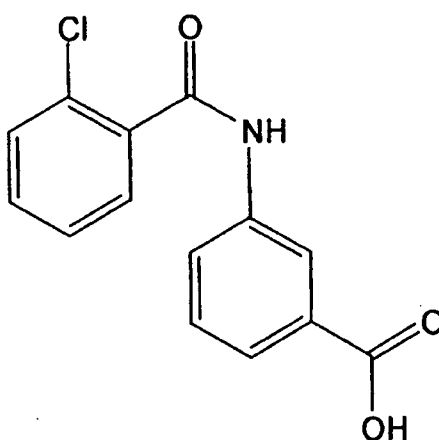
Synthesis Example 3 (raw material/intermediate)



o-Chlorobenzoyl chloride (3.34 g) was added to THF (10 mL) solution containing ethyl m-aminobenzoate (3.00 g) and pyridine (2.16 g) in ice cooling condition. After the reaction mixture was stirred for 1 hour in ice cooling condition, it was poured to water and extraction was carried out with ethyl acetate. The organic layer was washed with water and dried by anhydrous magnesium sulfate. After the solvent was removed by distillation, the obtained coarse product was washed with a mixed solvent of hexane and tert-butyl methyl ether to obtain an aimed compound, 3-(2-chlorobenzoyl)aminobenzoic acid ethyl ether (5.00 g).

^1H NMR (300MHz, CDCl_3) δ 8.18 (1H, br, s), 8.13 (1H, br, s), 8.09 (1H, d, $J = 8.1\text{Hz}$), 7.84 (1H, d, $J = 7.8\text{Hz}$), 7.74 (1H, d, $J = 7.8\text{Hz}$), 7.30-7.52 (4H, m), 4.34 (2H, q, $J = 7.2\text{Hz}$), 1.38 (3H, t, $J = 7.2\text{Hz}$).

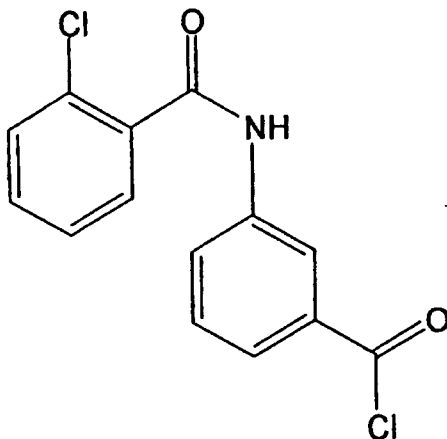
Synthesis Example 4 (raw material/intermediate)



A mixture of 3-(2-chlorobenzoyl)aminobenzoic acid ethyl ether (4.00 g), potassium hydroxide (water 4.7 mL), and ethanol (20 mL) was stirred at room temperature for 4 hours. The reaction mixture was diluted with water and made acidic with 2N hydrochloric acid and the precipitated coarse product was washed with water and dried to obtain 3-(2-chlorobenzoyl)aminobenzoic acid (3.04 g).

^1H NMR (300MHz, DMSO- d_6) δ 13.0 (1H, br, s), 10.7 (1H, s), 8.40 (1H, s), 7.90 (1H, d, $J = 7.8\text{Hz}$), 7.70 (1H, d, $J = 7.8\text{Hz}$), 7.42-7.64 (5H, m).

Synthesis Example 5 (raw material/intermediate)



One drop of DMF was added to a 1,2-dichloroethane solution containing 3-(2-chlorobenzoyl)aminobenzoic acid (3.52 g) and further thionyl chloride (1.86 mL) was added and the mixture was heated and refluxed for 6 hours. After the solvent was removed by distillation, the coarse product, 3-(2-chlorobenzoyl)aminobenzoyl chloride, was used for the next step without refining treatment.

Biological Test Example 1: Test to larvae of Spodoptera litura

Sample solution preparation

Solvent: dimethylformamide 3 part by weight

Emulsifier: polyoxyethylene alkyl phenyl ether 1 part by weight

To prepare a proper active compound, the active compound 1 part by weight was mixed with the above-mentioned solvent containing the above-mentioned emulsifier

50

and the mixture was diluted with water to a prescribed concentration.

Test method

Leaves of batata were immersed in the sample solution diluted with water to a prescribed concentration and then the solution was dried out by air and the resulting leaves were put in a laboratory dish and 10 third stage larvae of *Spodoptera litura* were released and put in a greenhouse at a temperature 25°C and the leaves of batata were added on second day and fourth day and the number of dead larvae was investigated after 7 days and the ratio of the dead larvae was calculated.

The results were the averages of two laboratory dishes for respective 1 group in this test.

Test results

In the above-mentioned biological test example 1, as representative examples, the above-mentioned compounds 1, 3, 13, 24, 30, 32, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 66, 72, 77, 88, 134, 139 showed the breeding prevention and extermination effect of efficacious component concentration 20 ppm at 100% insecticidal ratio.

Biological Test Example 2: Test to organic phosphorus agent- and carbamate agent-resistant *Myzus persicasypii*

Test Method

30 grown organic phosphorus agent- and carbamate agent- resistant *Myzus persicasypii* were inoculated in each vinyl pot with 6 cm diameter in which eggplant seeding was done and after 1 day from the inoculation, the above produced active compound diluted with water to have a prescribed concentration was sufficiently sprayed by a spray gun. After the spraying, the vinyl pots were left in a greenhouse at 28°C and the insect extermination ratio was calculated after 7 days from spraying.

The test was repeated two times.

51

Test results

As representative examples, the above-mentioned compounds Nos. 1, 57, 58, 61, 63, and 139 showed breeding prevention and extermination effect of the efficacious component concentration 500 ppm at 100% insecticidal ratio.

Biological Test Example 3: Test to Tetranychus urticae (spraying test)

Test Method

50 to 100 adults of Tetranychus urticae were inoculated in leaves in two-leaf stage of kidney bean planted in pots with 6 cm diameter and after 1 day, the above produced active compound diluted with water to have a prescribed concentration was sufficiently sprayed by a spray gun. After the spraying, the pots were left in a greenhouse and the insect extermination ratio was calculated after 7 days from spraying.

Test results

As representative examples, the above-mentioned compounds Nos. 1, 3, 13, 39, 43, 44, 45, 46, 47, 49, 54, 57, 58, 59, 61, 63, 64, 88, and 134 showed breeding prevention and extermination effect of the efficacious component concentration 500 ppm at 98% or higher insecticidal ratio.

Formulation Example 1 (granule)

Water 25 parts was added to a mixture containing the compound of the invention (No.1) 10 parts, bentonite (montmorillonite) 30 parts, talc 58 parts, and ligninsulfonic acid salt 2 part and the mixture was well kneaded and granulated with 10 to 40 meshes by an extruding granulator and dried at 40 to 50°C to obtain granules.

Formulation Example 2 (granule)

95 parts of clay mineral granules having particle diameter distribution of 0.2 to 2 mm were put in a rotary mixer and under rotating condition, the compound of the invention

(No.3) 5 parts together with a liquid diluent was sprayed and wetted evenly and dried at 40 to 50°C to obtain granules.

Formulation Example 3 (emulsion)

An emulsion was obtained by mixing the compound of the invention (No. 13) 30 part, xylene 55 part, polyoxyethylene alkylphenyl ether 8 part, and calcium alkylbenzenesulfonate 7 part.

Formulation Example 4 (hydrated agent)

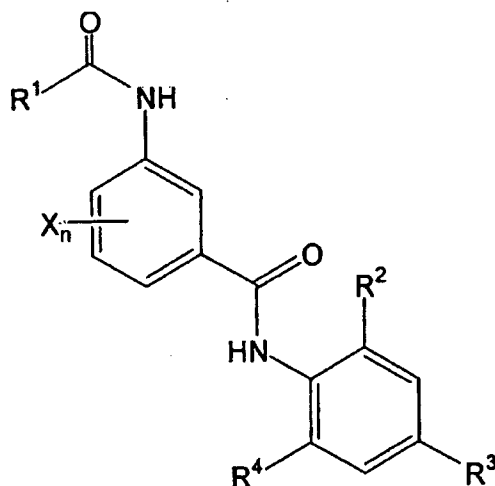
A hydrated agent was obtained by mixing the compound of the invention (No. 24) 15 part, a mixture of white carbon (hydrated amorphous silicon oxide fine powder) and powdered clay (1 : 5) 80 part, sodium alkylbenzenesulfonate 2 part, and sodium alkylnaphthalenesulfonate-formalin condensate 3 part and crushing the mixture.

Formulation Example 5 (hydrated granule)

A hydrated granule was obtained by sufficiently mixing the compound of the invention (No. 30) 20 part, ligninsulfonic acid sodium salt 30 part, bentonite 15 part, fired kieselguhr powder 35 part, adding water, extruding the mixture with a 0.3 mm screen, and drying the extruded granules.

CLAIMS

- 1). Novel 3-acylaminobenzanilides of the formula (I)



wherein

R¹ represents phenyl which may be substituted or a 5-member or 6-member heterocyclic ring group, which may be substituted, containing at least one hetero-atom selected from the group consisting of N, O, and S;

R² represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl;

R³ represents C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, or C₁₋₆ haloalkylsulfonyl;

R⁴ represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl;

X represents halogen, C₁₋₆ alkyl, or C₁₋₆ haloalkyl; and

n represents 0 or 1.

- 2). The compounds according to claim 1, wherein

R¹ represents phenyl optionally substituted with at least one group selected from the group consisting of C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆

54

haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen, or a 5-member or 6-member heterocyclic ring group containing at least one hetero-atom selected from the group consisting of N, O, and S and optionally substituted with at least one group selected from the group consisting of C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ alkylthio, C₁₋₆ alkylsulfinyl, C₁₋₆ alkylsulfonyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ haloalkoxy, C₁₋₆ haloalkylthio, C₁₋₆ haloalkylsulfinyl, C₁₋₆ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen;

R² represents halogen, C₁₋₄ alkyl, or C₁₋₄ haloalkyl;

R³ represents C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, or C₁₋₄ haloalkylsulfonyl;

R⁴ represents halogen, C₁₋₄ alkyl, or C₁₋₄ haloalkyl;

X represents halogen, C₁₋₄ alkyl, or C₁₋₄ haloalkyl; and

n represents 0 or 1.

3). The compounds according to claim 1, wherein

R¹ represents phenyl optionally substituted with at least one group selected from the group consisting of C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ alkylsulfinyl, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, C₁₋₄ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen; or pyridyl, pyrazolyl, thienyl, furyl, isoxazolyl, or thiadiazolyl optionally substituted with at least one group selected from the group consisting of C₁₋₄ alkyl, C₁₋₄ alkoxy, C₁₋₄ alkylthio, C₁₋₄ alkylsulfinyl, C₁₋₄ alkylsulfonyl, C₁₋₄ haloalkyl, C₁₋₄ haloalkoxy, C₁₋₄ haloalkylthio, C₁₋₄ haloalkylsulfinyl, C₁₋₄ haloalkylsulfonyl, nitro, hydroxy, and halogen

R² represents fluoro, chloro, iodo, methyl, ethyl, propyl, butyl, trifluoromethyl, or pentafluoroethyl;

55

R^3 represents C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} haloalkoxy, C_{1-4} haloalkylthio, C_{1-4} haloalkylsulfinyl, or C_{1-4} haloalkylsulfonyl;

R^4 represents fluoro, chloro, iodo, methyl, ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, t-butyl, trifluoromethyl or pentafluoroethyl;

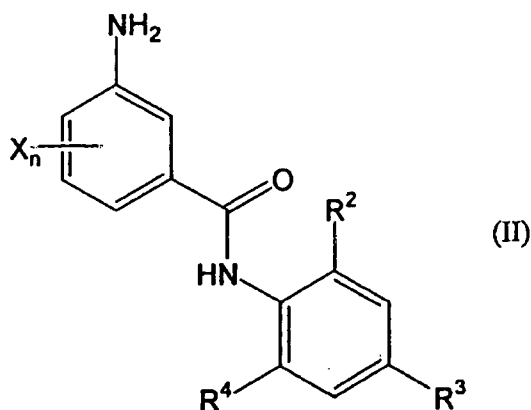
X represents fluoro, chloro, or methyl; and

n represents 0 or 1.

- 4). Process for the preparation of compounds of formula (I) according to claim 1 characterized in that

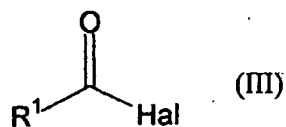
Production method (a):

compounds of the formula (II)



wherein R^2 , R^3 , R^4 , X, and n are same as defined above,

are reacted with compounds of the formula (III)



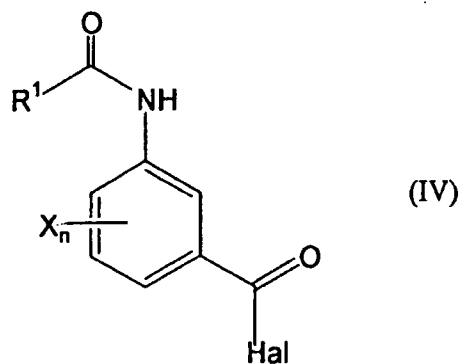
wherein R^1 is same as defined above and Hal represents a halogen,

in the presence of inert solvents and if appropriate, in the presence of a base
and a phase transfer catalyst,

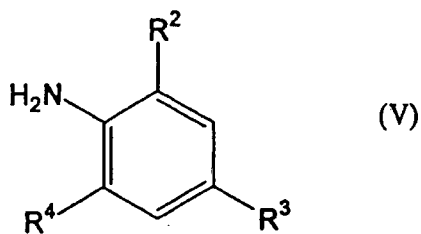
or

Production method (b):

compounds of the formula (IV)



wherein R¹, X, n, and Hal are same as defined above,
are reacted with compounds of the formula (V)



wherein R², R³, and R⁴ are same as defined,

in the presence of inert solvents and if appropriate, in the presence of a base
and a phase transfer catalyst.

- 5). Insecticidal compositions, characterized in that they contain at least one 3-acylamino-benzanilide of the formula (I).
- 6). Process for combating weeds, characterized in that 3-acylamino-benzanilides of the formula (I) are allowed to act on harmful insects and/or their habitat and/or propagation material.

57

- 7). Use of 3-acylaminobenzanilides of the formula (I) for combating harmful insects.
- 8). Process for the preparation of insecticidal compositions, characterized in that 3-Acylaminobenzanilides of the formula (I) are mixed with extenders and/or surface active agents.
- 9). Use of compositions according to claim 5 for the treatment of seeds.
- 10). Use of compositions according to claim 5 for the treatment of transgenic plants.
- 11). Use of compositions according to claim 5 for the treatment of seeds of transgenic plants.
- 12). Method for treating seeds comprising treating the seeds with a composition according to claim 5.
- 13). Method for treating transgenic plants comprising applying a composition according to claim 5.
- 14). Method for treating the seeds of transgenic plants comprising treating the seeds of transgenic plants with a composition according to claim 5.
- 15). Seeds treated with a composition according to claim 5.

3-ACILAMINOBENZANILIDAS INSECTICIDAS.**Inventores.-****Solicitante.- Bayer CropScience, AG, entidad alemana.****Residencia.- Alfred-Nobel-Straße. 50, D-40789, Monheim, Alemania.**

BCS 05-7006-COLOMBIA

- 1 -

3-ACILAMINO BENZANILIDAS INSECTICIDAS.**Campo de la invención**

La invención se refiere a nuevas 3-acilaminobenzanilidas y a su uso como insecticidas.

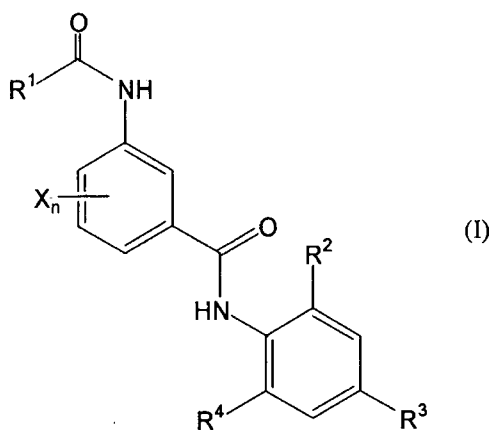
5

Antecedentes de la invención

El folleto de la publicación internacional PCT WO 2005/021488 describe que las benzamidas son útiles como insecticidas.

Descripción detallada de la invención

Se han encontrado ahora nuevas 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I)



10

en la que

R¹ significa fenilo que puede estar substituido o un grupo de anillo heterocíclico con 5 miembros o 6 miembros, que puede estar substituido, que contiene, al menos, un heteroátomo elegido entre el grupo constituido por N, O y S;

15 R² significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono;

R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoaloxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o

- 2 -

halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono;

R^4 significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquib con 1 hasta 6 átomos de carbono;

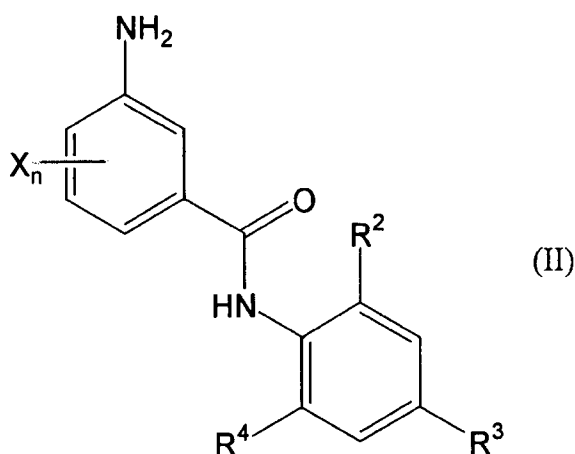
X significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquib con 1 hasta 6 átomos de carbono; y

n significa 0 ó 1.

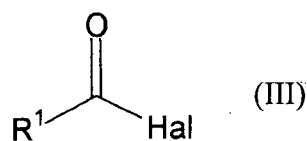
El compuesto de la fórmula (I) de la invención puede obtenerse por los siguientes métodos de obtención(a) y (b) en los que

Método de obtención(a):

10 se hacen reaccionar los compuestos de la fórmula (II)



en la que R^2 , R^3 , R^4 , X y n son los mismo que se han definido precedentemente, con los compuestos de la fórmula (III)

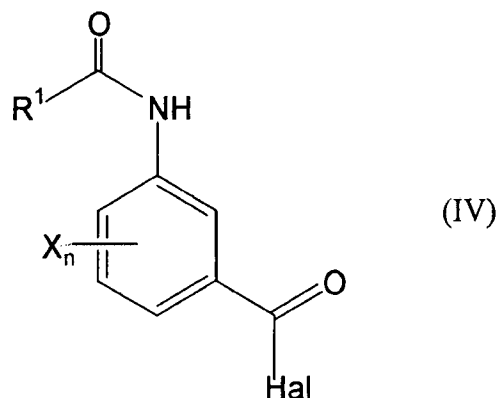


15 en la que R^1 es como se ha definido precedentemente y Hal significa un halógeno, en presencia de disolventes inertes y, en caso dado, en presencia de una base y de un catalizador de transferencia de fases,

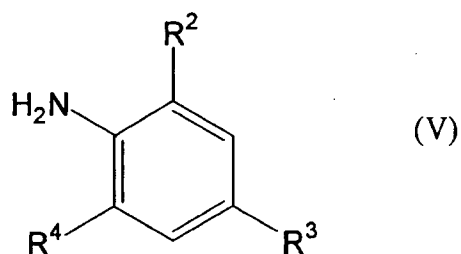
o

Método de obtención(b):

se hacen reaccionar los compuestos de la fórmula (IV)



- 5 en la que R¹, X, n y Hal son los mismo que se han definido precedentemente,
con los compuestos de la fórmula (V)



- en la que R², R³, y R⁴ son los mismo que se han definido precedentemente,
en presencia de disolventes inertes y, en caso dado, en presencia de una base y de un
10 catalizador de transferencia de fases.

De conformidad con la invención, las 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I),
tal como se ha mencionado precedentemente, muestran un potente efecto insecticida.

- Los compuestos de la fórmula (I) muestran, sorprendentemente, un efecto
insecticida destacado de manera significativa, en comparación con los compuestos
15 análogos.

En esta memoria descriptiva, "hal ógeno" significa flúor, cloro, bromo y yodo

y, de manera preferente, flúor, cloro, y bromo.

“Alquilo” significa, por ejemplo, un alquilo con 1 hasta 12 átomos de carbono de cadena lineal o de cadena ramificada tal como metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo y n-dodecilo, de manera preferente significa un alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono.

Las respectivas partes alquilo de “halógenoalquilo”, “halógenoalcoxi”, “halógenoalquiltio”, “halógenoalquilsulfinilo”, “halógenoalquilsulfonilo”, “alcoxi”, “alquiltio”, “alquilsulfinilo” y “alquilsulfonilo” pueden ser las mismas, tal como se han descrito en la descripción de “alquilo”.

Las respectivas partes de halógeno de “halógenoalquilo”, “halógenoalcoxi”, “halógenoalquiltio”, “halógenoalquilsulfinilo” y “halógenoalquilsulfonilo” pueden ser las mismas, tal como se han descrito en la descripción de “halógeno”.

La expresión “grupo de anillo heterocíclico de 5 miembros o de 6 miembros” significa aquellos que contienen, al menos, un heteroátomo elegido entre un grupo que consiste en N, O y S y puede incluir tienilo, furilo, pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo y triazinilo y, de manera particular, tienilo, furilo, pirazolilo, isoxazolilo, tiadiazolilo, piridilo y pirimidinilo.

Con respecto a los compuestos de la fórmula (I) de la invención, son preferentes los compuestos siguientes:

en los que

R¹ significa un fenilo, opcionalmente substituido por, al menos, un grupo elegido entre alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, alcoxisulfinilo con 1 hasta

- 5 -

- 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxisulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono,
- 5 halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno, o un grupo de anillo heterocíclico de 5 miembros o de 6 miembros, que contiene, al menos, un heteroátomo elegido entre el grupo constituido por N, O y S y, opcionalmente, substituido con, al menos, un grupo elegido entre
- 10 alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono,
- 15 halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno;
- R² significa halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquib con 1 hasta 4 átomos de carbono;
- R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con
- 20 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;
- R⁴ significa halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquib con 1 hasta 4 átomos de carbono;
- 25 X significa halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquib

con 1 hasta 4 átomos de carbono; y

n significa 0 ó 1.

Con respecto a los compuestos de la fórmula (I), son preferentes de manera particular los compuestos siguientes:

5 en los que

R¹ significa fenilo, opcionalmente substituido por, al menos, un grupo elegido entre el grupo constituido por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno; o piridilo, pirazolilo, tienilo, furilo, isoxazolilo o tiadiazolilo, opcionalmente substituido por, al menos, un grupo elegido entre el grupo constituido por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno.

R² significa flúor, cloro, yodo, metilo, etilo, propilo, butilo, trifluórmétilo, o pentafluóretilo;

R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoaloxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;

5 R⁴ significa flúor, cloro, yodo, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, t-butilo, trifluórometilo o pentafluóretilo;

X significa flúor, cloro o metilo; y

n significa 0 ó 1.

Entre los compuestos de la fórmula (I), son preferentes de una manera muy particular los compuestos siguientes:
en los que

R¹ significa fenilo, opcionalmente substituido por uno a tres grupos elegidos del grupo que consiste en metilo, trifluórometilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, trifluórometoxi, nitro y butilo terciario; o piridilo, pirazolilo, tienilo, furilo, isoxazolilo o tiadiazolilo, opcionalmente substituido por uno a tres grupos elegidos del grupo que consiste en metilo, trifluórometilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, trifluórometoxi, nitro y butilo terciario;

R² significa metilo;

R³ significa perfluorisopropilo;

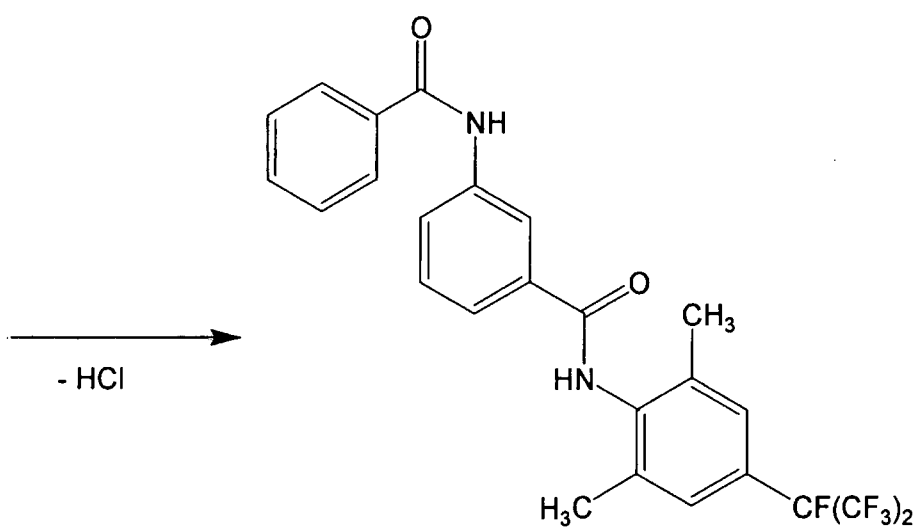
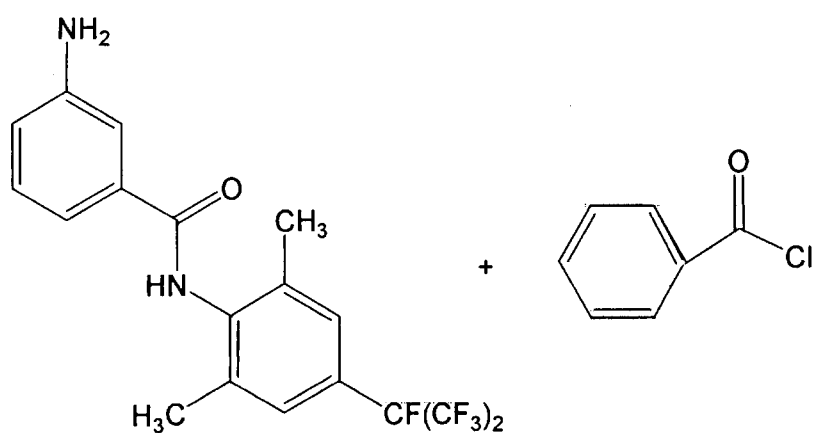
20 R⁴ significa yodo, metilo, etilo o pentafluóretilo;

X significa flúor, cloro o metilo; y

n significa 0 ó 1.

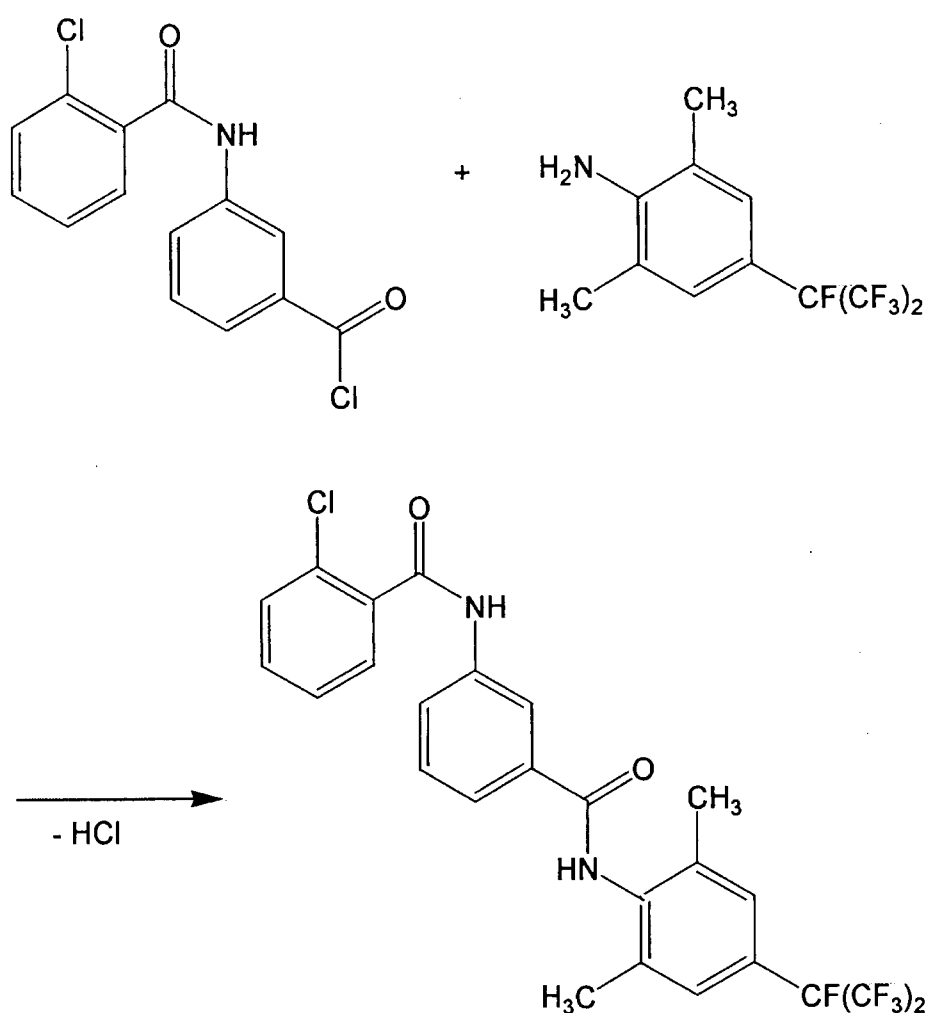
El método de obtención(a) puede definirse por medio de la siguiente fórmula de reacción, por ejemplo, en el caso que se utilicen como materiales de partida la 3-amino-N-(2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilfenil)benzamida y el cloruro de benzoilo.

- 8 -



El método de obtención(b) puede definirse por medio de la siguiente fórmula de reacción, por ejemplo, en el caso que se utilicen como materiales de partida el cloruro del ácido 3-(2-clorobenzoyl)aminobenzoico y la 2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilánilina.

- 9 -



Los compuestos de la fórmula (II), a ser empleados como materiales de partida en el método de obtención (a), mencionado precedentemente, son compuestos conocidos descritos en la publicación WO 2005/021458 y pueden ser sintetizados fácilmente de conformidad con los métodos descritos en la publicación internacional.

Ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (II) son;

- la 3-amino-N-(2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilfenil)benzamida,
- la 3-amino-N-(2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilfenil)-2-flúorbenzamida,
- la 3-amino-N-(2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilfenil)-2-clorobenzamida,
- la 3-amino-N-(2-etil-6-metil-4-heptafluorisopropilfenil)benzamida,

- 10 -

- la 3-amino-N-(2-isopropil-6-metil-4-heptaflúorisopropilfenil)benzamida,
la 3-amino-N-(2,6-dietil-4-heptaflúorisopropilfenil)benzamida,
la 3-amino-N-(2,6-dicloro-4-heptaflúor-n-propiltiofenil)benzamida,
la 3-amino-N-(2,6-dicloro-4-heptaflúor-n-propiltiofenil)benzamida y
5 la 3-amino-N-(2,6-dicloro-4-heptaflúor-n-propilsulfonilfenil)benzamida.

Los compuestos de la fórmula (III) a ser empleados como materiales de partida en el método de obtención (a), mencionado precedentemente, son compuestos conocidos y muchos pueden ser adquiridos en el comercio. O pueden ser sintetizados fácilmente de conformidad con los métodos convencionales a partir de los
10 correspondientes ácidos carboxílicos conocidos.

Ejemplos representativos de los compuestos pueden ser;

- el cloruro de benzoilo,
el cloruro de 2-clorobenzoilo,
el cloruro de 3-clorobenzoilo,
15 el cloruro de 4-clorobenzoilo,
el cloruro de 2-flúorbenzoilo,
el cloruro de 3-flúorbenzoilo,
el cloruro de 4-flúorbenzoilo,
el cloruro de 2,3-diclorobenzoilo,
20 el cloruro de 2,4-diclorobenzoilo,
el cloruro de 2,6-diclorobenzoilo,
el cloruro de 2,3-diflúorbenzoilo,
el cloruro de 2,4-diflúorbenzoilo,
el cloruro de 2,6-diflúorbenzoilo,
25 el cloruro de nicotinilo,

- el cloruro de 4-trifluórmethylnicotinilo,
el cloruro de 6-cloronicotinilo,
el cloruro de 6-fluornicotinilo,
el cloruro de 2-fluornicotinilo,
5 el cloruro de 2-cloronicotinilo,
el cloruro de 2-bromonicotinilo,
el cloruro de 2,6-difluornicotinilo,
el cloruro de 4-cloropicolinoilo,
el cloruro de 2-cloroisonicotinilo,
10 el cloruro de tiofen-3-carbonilo,
el cloruro de 2,5-diclorotiofen-3-carbonilo,
el cloruro de 3-clorotiofen-2-carbonilo,
el cloruro de 3-(terc.-butil)-1-metilpirazol-5-carbonilo,
el cloruro de 4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-carbonilo y
15 el cloruro de 4-furoilo.

Puede llevarse a cabo la reacción del método de obtención (a), mencionado precedentemente, en un diluyente apropiado. Ejemplos de los diluyentes a ser empleados en este caso son los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (opcionalmente clorados) tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano, el éter de petróleo, el benceno, el tolueno, el xileno, el diclorometano y el dicloroetano; los
20 éteres tales como el etiléter, el metiletiléter, el isopropiléter, el butiléter, el dioxano, el dimetoxietano (DME), el tetrahidrofurano (THF) y el dietilenglicoldimetiléter (DGM); las cetonas tales como la acetona, la metiletilcetona (MEK), la metilisopropilcetona, la metilisobutilcetona (MIBK); los nitrilos tales como el acetonitrilo, el propionitrilo y el
25 acrilonitrilo; los ésteres tales como el acetato de etilo y el acetato de amilo.

Puede llevarse a cabo el método de obtención(a) en presencia de una base. Tal base puede ser, como bases inorgánicas, los hidróxidos, los carbonatos y los bicarbonatos de metales alcalinos tales como el hidrógenocarbonato de sodio, el hidrógenocarbonato de potasio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidróxido de litio, el hidróxido de sodio y el hidróxido de potasio; como bases orgánicas, las aminas terciarias, las dialquilaminoanilinas y las piridinas tales como la trietilamina, la 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), la N,N-dimetilanilina, la N,N-di-etilanilina, la piridina, la 4-dimetilaminopiridina (DMAP), el 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO) y el 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU).

El método de obtención(a) puede llevarse a cabo por medio de un método con empleo de un catalizador de transferencia de fases. Ejemplos de los diluyentes a ser empleados en este caso son el agua; los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (opcionalmente clorados) tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno, los éteres tales como el etiléter, el metiletiléter, el metilbutiléter, el isopropiléter y el butiléter.

Ejemplos del catalizador de transferencia de fases son los iones cuaternarios tales como el bromuro de tetrametilamonio, el bromuro de tetrapropilamonio, el bromuro de tetrabutilamonio, el bisulfuro de tetrabutilamonio, el yoduro de tetrabutilamonio, el cloruro de trioctilmetilamonio, el bromuro de benciltrietilamonio, el bromuro de butilpiridinio, el bromuro de heptilpiridinio y el cloruro de benciltrietilamonio; los éteres corona tales como el dibenzo-18-corona-6, el dicitclohexil-18-corona-6 y el 18-corona-6; los criptandos tales como el [2.2.2]-criptato, el [2.1.1]-criptato, el [2.2.1]-criptato, el [2.2.B]-criptato, el [2O2O2S]-criptato y el [3.2.2]-criptato.

El método de obtención(a) Puede llevarse a cabo, de manera substancial, en un

amplio intervalo de temperaturas. Por regla general, está se encuentra entre aproximadamente -40 y aproximadamente 200°C, de manera preferente entre aproximadamente -20 y aproximadamente 150°C. Aún cuando la reacción se lleva a cabo, de manera preferente, a presión normal, puede llevarse a cabo, también, a presión más alta o a presión reducida.

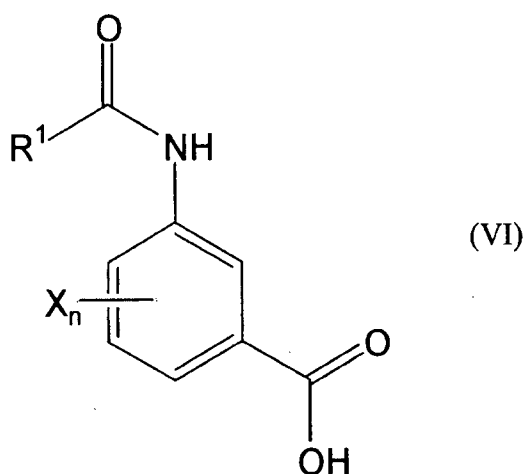
Los compuestos propuestos de la fórmula (I) pueden ser obtenidos por reacción de 1 mol de los compuestos de la fórmula (II) con 1 mol o con un ligero exceso de los compuestos de la fórmula (III) en un diluyente, por ejemplo el THF, en presencia de piridina.

Los compuestos de la fórmula (IV), a ser empleados como materiales de partida en el método de obtención (b), pueden incluir compuestos conocidos y son ejemplos representativos,

- el cloruro de 3-(benzoilamino)benzoilo,
- el cloruro de 3-[(2-flúorbenzoil)amino]benzoilo,
- 15 el cloruro de 3-[(3-flúorbenzoil)amino]benzoilo,
- el cloruro de 3-[(4-flúorbenzoil)amino]benzoilo,
- el cloruro de 3-[(3-trifluórmethylbenzoil)amino]benzoilo,
- el cloruro de 3-[(2-clorobenzoil)amino]benzoilo,
- el cloruro de 3-[(2,6-difluórbenzoil)amino]benzoilo,
- 20 el cloruro de 3-[(4-clorobenzoil)amino]benzoilo,
- el cloruro de 3-[(2,4-diclorobenzoil)amino]benzoilo,
- el cloruro de 3-[(2,5-diclorobenzoil)amino]benzoilo y
- el cloruro de 3-(benzoilamino)-2-metilbenzoilo.

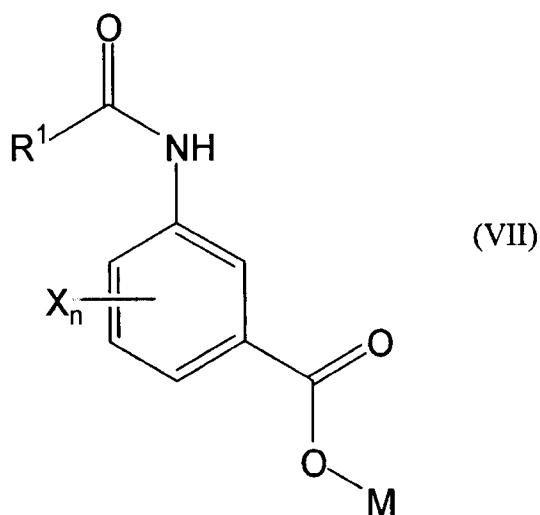
Los compuestos de la fórmula (IV) pueden obtenerse fácilmente por medio de la halogenación de los ácidos benzoicos correspondientes al representado por la

siguiente fórmula:



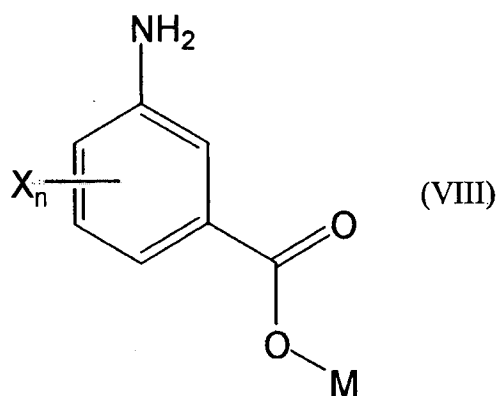
en la que R¹, X y n son como se han descrito precedentemente.

Los compuestos de la fórmula (VI), mencionados precedentemente, pueden
 5 obtenerse fácilmente por hidrólisis de los ésteres del ácido 3-acilaminobenzoico de la
 fórmula (VII) siguiente, de acuerdo con métodos convencionales:



en la que R¹, X y n son como han descrito precedentemente y M significa alquilo con
 1 hasta 4 átomos de carbono.

10 Los compuestos de la fórmula (VII), mencionados precedentemente, pueden
 obtenerse fácilmente haciendo reaccionar los compuestos de la siguiente fórmula:



en la que R^1 , X y n son los mismo que han sido descrito precedentemente, con los compuestos de la fórmula (III), mencionados precedentemente.

- Los compuestos de la fórmula (VIII), mencionados precedentemente, son
- 5 compuestos bien conocidos y ejemplos representativos son;
- el éster de metilo del ácido 3-aminobenzoico,
- el éster de etilo del ácido 3-aminobenzoico,
- el éster de terc.-butilo del ácido 3-aminobenzoico,
- el éster de etilo del ácido 3-amino-2-metilbenzoico,
- 10 el éster de etilo del ácido 3-amino-4-flúorbenzoico,
- el éster de etilo del ácido 3-amino-5-flúorbenzoico y
- el éster de etilo del ácido 3-amino-2-bromobenzoico.

- Los compuestos de la fórmula (V), el otro material de partida, en el método de obtención(b), son compuestos bien conocidos descritos en la publicación EP1380568 o
- 15 en la publicación WO 2005/021488 y pueden obtenerse fácilmente de conformidad con los métodos descritos en estos boletines oficiales.

Ejemplos representativos son:

- la 2,6-dimetil-4-pentafluoretilanilina,
- la 2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilanilina,

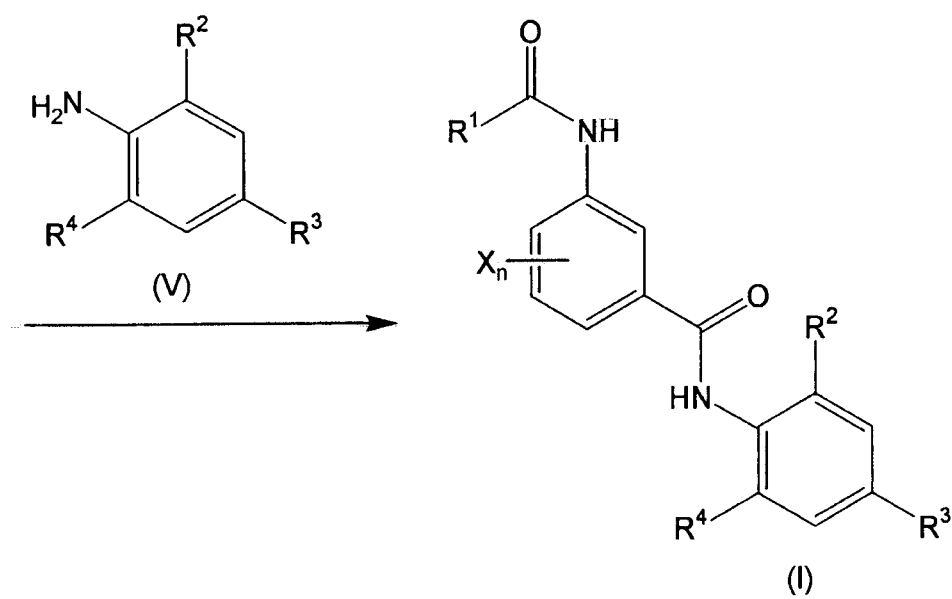
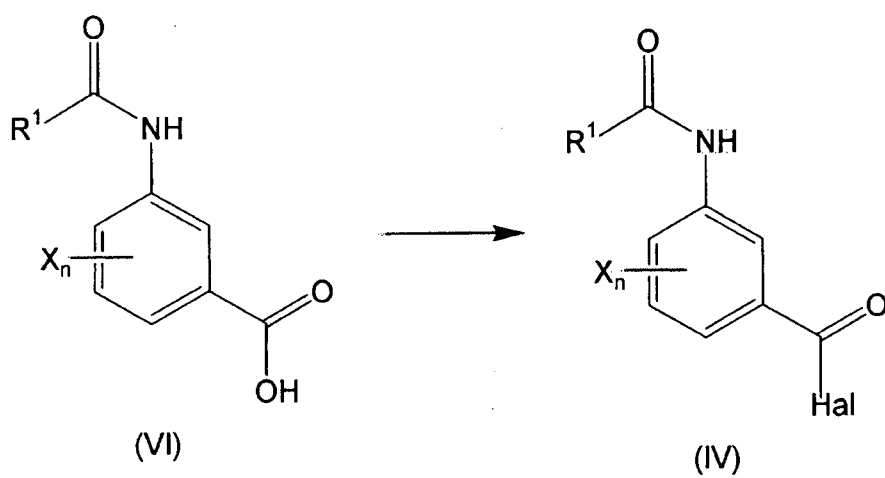
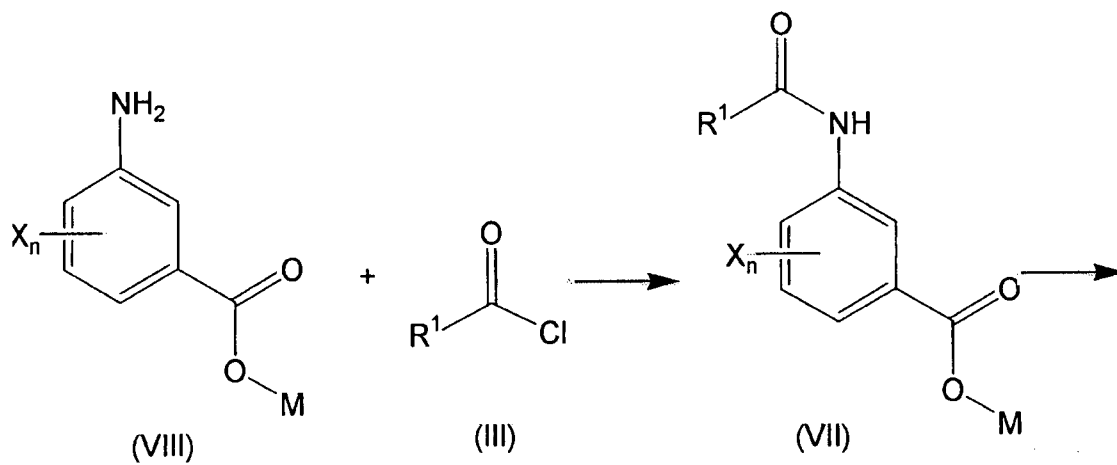
- 16 -

- la 2-etil-4-heptaflúorisopropil-6-metilanilina,
la 2,6-dietil-4-heptaflúorisopropilalinina,
la 2,6-dicloro-4-heptaflúorisopropilalinina,
la 2,6-dimetil-4-heptaflúor-n-propiltioalinina y
5 la 2,6-dicloro-4-heptaflúor-n-propiltioalinina.

Una serie de esquemas de reacción relevantes para el método de obtención(b) es el siguiente.

75

- 17 -



En el esquema de reacción mostrado precedentemente, puede llevarse a cabo la reacción del compuesto de la fórmula (VIII) y los compuestos de la fórmula (III) en un diluyente apropiado y ejemplos del diluyente a ser empleado en este caso son los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (opcionalmente clorados) tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano, el éter de petróleo, el benceno, el tolueno, el xileno, el diclorometano y el dicloroetano; los éteres tales como el etiléter, el metiletiléter, el isopropiléter, el butiléter, el dioxano, el dimetoxietano (DME), el tetrahidrofurano (THF) y el dietilenglicoldimetiléter (DGM); las cetonas tales como la acetona, la metiletilcetona (MEK), la metilisopropilcetona, la metilisobutilcetona (MIBK); los nitrilos tales como el acetonitrilo, el propionitrilo y el acrilonitrilo; los ésteres tales como el acetato de etilo y el acetato de amilo.

La reacción mencionada precedentemente puede llevarse a cabo en presencia de una base y ejemplos de un agente aceptor de ácido empleado en la reacción mencionada precedentemente pueden ser como bases inorgánicas, los hidróxidos, los carbonatos y los bicarbonatos de metales alcalinos tales como el hidrógenocarbonato de sodio, el hidrógenocarbonato de potasio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidróxido de litio, el hidróxido de sodio y el hidróxido de potasio; como bases orgánicas, los alcoholatos, las aminas terciarias, las dialquilaminoanilinas y las piridinas tales como la trietilamina, la 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), la N,N-dimetilanilina, la N,N-dietilanilina, la piridina, la 4-dimetilaminopiridina (DMAP), el 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO) y el 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU).

La reacción mencionada precedentemente puede llevarse a cabo por medio de un método con empleo de un catalizador de transferencia de fases. Ejemplos del

diluyente a ser empleado en este caso pueden ser los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (opcionalmente clorados) tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano, el benceno, el tolueno y el xileno, los éteres tales como el etiléter, el metiletiléter, el metilbutiléter, el isopropiléter y el butiléter.

5 Ejemplos del catalizador de transferencia de fases son iones cuaternarios tales como el bromuro de tetrametilamonio, el bromuro de tetrapropilamonio, el bromuro de tetrabutilamonio, el bisulfuro de tetrabutilamonio, el yoduro de tetrabutilamonio, el cloruro de trioctilmetilamonio, el bromuro de benciltrietilamonio, el bromuro de butilpiridinio, el bromuro de heptilpiridinio y el cloruro de benciltrietilamonio; los
10 éteres corona tales como el dibenzo-18-corona-6, el dicitclohexil-18-corona-6 y el 18-corona-6; los criptandos tales como el [2.2.2]-criptato, el [2.1.1]-criptato, el [2.2.1]-criptato, el [2.2.B]-criptato, el [2O2O2S]-criptato y el [3.2.2]-criptato.

La reacción puede llevarse a cabo, de manera substancial, en un amplio intervalo de temperaturas. Por regla general, está comprendida entre
15 aproximadamente -40 y aproximadamente 200°C, de manera preferente entre aproximadamente -20 y aproximadamente 110°C. Aún cuando la reacción se lleva a cabo, de manera preferente, a presión normal, puede llevarse a cabo, también, a presión más alta o a presión reducida.

Los compuestos propuestos de la fórmula (VII) pueden ser obtenidos por
20 reacción de 1 mol de los compuestos de la fórmula (VIII) con 1 mol o con un ligero exceso de los compuestos de la fórmula (III) en un diluyente, por ejemplo el THF, en presencia de piridina.

El método de obtención de los compuestos de la fórmula (VI) puede llevarse a cabo por hidrólisis de los compuestos de la fórmula (VII) en un diluyente apropiado y
25 ejemplos del diluyente son el agua; los éteres tales como el etiléter, el metiletiléter, el

isopropiléter, el butiléter, el dioxano y el tetrahidrofurano (THF); y los alcoholes tales como el metanol, el etanol, el isopropanol, el butanol y el etilenglicol.

La reacción mencionada precedentemente se lleva a cabo empleando como bases inorgánicas, los hidróxidos de los metales alcalinos y de los metales alcalinotérreos
5 tales como el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio y el hidróxido de calcio o como ácidos inorgánicos, el ácido clorhídrico y el ácido sulfúrico.

La reacción puede llevarse a cabo, de manera substancial, en un amplio intervalo de temperaturas. Por regla general, está comprendida entre aproximadamente 0 y aproximadamente 200°C, de manera preferente está entre la
10 temperatura ambiente y aproximadamente 150°C. Aún cuando la reacción se lleva a cabo, de manera preferente, a presión normal, puede llevarse a cabo, también, a presión más alta o a presión reducida.

Los compuestos propuestos de la fórmula (VI) pueden ser obtenidos por reacción de 1 mol del compuesto de la fórmula (VII) con hidróxido de potasio en un diluyente,
15 por ejemplo, un disolvente mixto de agua y de etanol.

El método de obtención de los compuestos de la fórmula (IV) a partir de los compuestos de la fórmula (VI) puede llevarse a cabo en un diluyente apropiado y ejemplos del diluyente a ser empleado en este caso son los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (opcionalmente clorados) tales como el hexano, el
20 ciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno, el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano y el dicloroetano.

La reacción mencionada precedentemente puede llevarse a cabo con empleo de un agente de halogenación, el cloruro de tionilo y el bromuro de tionilo y similares, y añadiendo DMF como un catalizador.

25 La reacción puede llevarse a cabo, de manera substancial, en un amplio

intervalo de temperatura. Por regla general, está comprendida entre aproximadamente 0 y aproximadamente 200°C, de manera preferente está entre la temperatura ambiente y aproximadamente 150°C. Aún cuando la reacción se lleva a cabo, de manera preferente, a presión normal, puede llevarse a cabo, también, a presión más alta o a presión reducida.

Para llevar a cabo la reacción, los compuestos propuestos de la fórmula (IV) pueden obtenerse añadiendo una cantidad catalítica de DMF y haciendo reaccionar 1 mol del compuesto de la fórmula (VI) con cloruro de tionilo en un diluyente, tal como el 1,2-dicloroetano.

- 10 Puede llevarse a cabo el método de reacción final (b) en el esquema en un diluyente apropiado y ejemplos del diluyente a ser empleados en este caso son los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (opcionalmente clorados) tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano, el éter de petróleo, la ligroína, el benceno, el tolueno, el xileno, el diclorometano y el dicloroetano;
- 15 los éteres tales como el etiléter, el metiletiléter, el isopropiléter, el butiléter, el dioxano, el dimetoxietano (DME), el tetrahidrofurano (THF) y el dietilenglicoldimetiléter (DGM);
- las cetonas tales como la acetona, la metiletilcetona (MEK), la metilisopropilcetona, la metilisobutilcetona (MIBK);
- 20 nitrilos tales como el acetonitrilo, el propionitrilo y el acrilonitrilo; y
- los ésteres tales como el acetato de etilo y el acetato de amilo.

El método de obtención (b) puede llevarse a cabo en presencia de una base. Ejemplos de un agente aceptor de ácido, empleado en la reacción mencionada precedentemente pueden incluir, como bases inorgánicas, los hidróxidos, los carbonatos y los bicarbonatos de los metales alcalinos tales como el

hidrógenocarbonato de sodio, el hidrógenocarbonato de potasio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidróxido de litio, el hidróxido de sodio y el hidróxido de potasio; como bases orgánicas, las aminas terciarias, las dialquilaminoanilinas y las piridinas tales como la trietilamina, la 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), la
5 N,N-dimetilanilina, la N,N-dietilanilina, la piridina, la 4-dimetilaminopiridina (DMAP), el 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO) y el 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU).

El método de obtención(b) puede llevarse a cabo por medio de un método con empleo de un catalizador de transferencia de fases. Ejemplos del diluyente a ser
10 empleado en este caso pueden ser los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (opcionalmente clorados) tales como el pentano, el hexano, el ciclohexano, el benceno, el tolueno y el xileno; los éteres tales como el etiléter, el metiletiléter, el metilbutiléter, el isopropiléter y el butiléter.

Ejemplos del catalizador de transferencia de fases son los iones cuaternarios
15 tales como el bromuro de tetrametilamonio, el bromuro de tetrapropilamonio, el bromuro de tetrabutilamonio, el bisulfuro de tetrabutilamonio, el yoduro de tetrabutilamonio, el cloruro de trioctilmetilamonio, el bromuro de benciltrietilamonio, el bromuro de butilpiridinio, el bromuro de heptilpiridinio y el cloruro de benciltrietilamonio; los éteres corona tales como el dibenzo-18-corona-6, el
20 dicitclohexil-18-corona-6 y el 18-corona-6; los criptandos tales como el [2.2.2]-criptato, el [2.1.1]-criptato, el [2.2.1]-criptato, el [2.2.B]-criptato, el [2O2O2S]-criptato y el [3.2.2]-criptato.

El método de obtención(b) puede llevarse a cabo, de manera substancial, en un amplio intervalo de temperaturas. Por regla general, está comprendida entre
25 aproximadamente -40 y aproximadamente 200°C, de manera preferente entre

aproximadamente -20 y aproximadamente 150°C. Aún cuando la reacción se lleva a cabo, de manera preferente, a presión normal, puede llevarse a cabo, también, a presión más alta o a presión reducida. Pueden obtenerse los compuestos propuestos de la fórmula (I) haciendo reaccionar 1 mol de los compuestos de la fórmula (IV) con 1 mol o con un ligero exceso de los compuestos de la fórmula (V) en un diluyente, por ejemplo el THF, en presencia de piridina.

Los compuestos de la fórmula (I) muestran un potente efecto insecticida. Por lo tanto, los compuestos pueden emplearse como insecticidas. Los productos activos de la fórmula (I) muestran efectos insecticidas fiables frente a los insectos perjudiciales sin perjudicar a las plantas en crecimiento. Los compuestos de la invención pueden ser usados para la prevención del daño producido por una amplia gama de diversos insectos perjudiciales, por ejemplo, tipos de insectos chupadores perjudiciales, tipos de insectos masticadores y otros insectos parásitos de las plantas, insectos de almacén, insectos perjudiciales para la higiene y para prevenir su reproducción y para la exterminación de los mismos.

Tales insectos perjudiciales pueden incluir los siguientes insectos perjudiciales.

Ejemplos de los insectos pueden ser los coleópteros tales como *Callosobruchus chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomala rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Monochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, y *Lyctus bruneus*;

los lepidópteros tales como *Lymantria dispar*, *Malacosoma neustria*, *Pieris rapae*, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Chilo suppressalis*, *Pyrausta nubilalis*, *Ephesia cautella*, *Adoxophyes orana*, *Carpocapsa pomonella*, *Agrotis fucosa*, *Galleria mellonella*, *Plutella maculipennis*, *Heliothis virescens*, y *Phyllocnistis citrella*;

los hemípteros tales como *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*,

Pseudococcus comstocki, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicas*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Phopalosiphum pseudobrassicas*, *Stephanitis nashi*, *Nazara* spp., *Trileurodes vaporariorum*, y *Pshylla* spp.;

los tisanópteros tales como *Thrips palmi* y *Franklinella accidental*;

- 5 los ortópteros tales como *Blatella germanica*, *Periplaneta americana*, *Gryllotalpa africana*, y *Locusta migratoria migratorioides*;

los isópteros tales como *Reticulitermes speratus*, y *Coptotermes formosanus*;

los dípteros tales como *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus*, y *Liriomyza trifolii*;

- 10 los acarinos tales como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Aculops pelekassi*, y *Tarsonemus* spp.; y

los nematodos tales como *Meloidogyne incognita*, *Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara, *Aphelenchoides besseyi*, *Heterodera glycines*, y *Pratylenchus* spp.

- 15 Los nuevos compuestos de la invención pueden emplearse en el campo veterinario, de manera eficaz, frente a diversos parásitos perjudiciales de animales (parásitos internos y externos), por ejemplo insectos y helmintos.

Ejemplos de tales parásitos de animales pueden incluir los insectos perjudiciales siguientes.

- 20 Ejemplos de insectos son *Gastrophilus* spp., *Stomoxys* spp., *Trichodectes* spp., *Rhodnius* spp., *Ctenocephalides canis*, y *Cimex lecturarius*.

Ejemplos de acarinos son *Ornithodoros* spp., *Ixodes* spp., y *Boophilus* spp.

Ocasionalmente pueden denominarse insecticidas en la invención aquellas sustancias que tienen efectos insecticidas sobre los insectos perjudiciales, con

- 25 inclusión de todos los insectos relacionados.

En el caso en el que los productos activos de la invención sean empleados como insecticidas, pueden formarse en formulaciones generales. Las formas de las formulaciones son, por ejemplo, los agentes líquidos, las emulsiones, los agentes hidratados, los agentes hidratados granulados, los agentes de suspensión, los agentes en polvo, los agentes espumantes, las pastas, las tabletas, los granulados, los aerosoles, el humedecimiento de productos activos, los productos naturales y sintéticos, las microcápsulas, los agentes recubiertos para semillas, las formulaciones dotadas con aparatos de combustión (por ejemplo, cartucho, botes y serpentinas de fumigación y generadores de humo como aparatos de combustión) y ULV (volumen ultra bajo) (nebulización en frío y nebulización en caliente).

Estas formulaciones ser preparadas según métodos conocidos. Por ejemplo, pueden prepararse los productos activos pueden por medio de agentes extendedores, es decir, por mezcla de los mismos con diluyentes o materiales de soporte líquidos; con diluyentes o materiales de soporte gaseosos líquidos, con diluyentes o materiales de soporte sólidos y, opcionalmente, con agentes tensioactivos, es decir, con emulsionantes y/o con dispersantes y/o con agentes espumantes.

Cuando se utilice el agua como agente extendedor, podrán emplearse, por ejemplo, disolventes orgánicos a título de disolventes auxiliares.

Ejemplos de diluyentes o de materiales de soporte líquidos son los hidrocarburos aromáticos (por ejemplo el xileno, el tolueno, el alquilnaftaleno); los hidrocarburos aromáticos clorados o los hidrocarburos alifáticos clorados (por ejemplo los clorobencenos, los cloruros de etileno, los cloruros de metileno), los hidrocarburos alifáticos (por ejemplo el ciclohexano, las parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral)), los alcoholes (por ejemplo el butanol, el glicol y sus éteres y ésteres), las cetonas (por ejemplo la acetona, la metiletilcetona, la

metilisobutilcetona, la ciclohexanona), los disolventes polares fuertes (por ejemplo la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido) y el agua.

Los diluyentes o los materiales de soporte gaseosos, licuados, son aquellos que son gaseosos a temperatura normal y a presión normal y ejemplos de los mismos son
5 los agentes propulsores de aerosoles tales como el furano, el propano, el nitrógeno gaseoso, el dióxido de carbono, los hidrocarburos halogenados.

Ejemplos de los diluyentes sólidos incluyen los minerales naturales molturados (por ejemplo el caolín, la arcilla, el talco, el coque, el cuarzo, la attapulgita, la montmorillonita o la tierra de diatomeas), los minerales sintéticos molturados (por
10 ejemplo el ácido silícico altamente dispersado, el óxido de aluminio, los silicatos).

Ejemplos de los materiales de soporte sólidos para granulados incluyen las rocas quebradas y tamizadas (por ejemplo la calcita, el mármol, la piedra pómez, la socialita, la moscovita, etc.), los granulados sintetizados de polvos orgánicos o inorgánicos, y granulados finos de sustancias orgánicas (por ejemplo el serrín de
15 madera, la cáscara de nuez de coco, las panochas de maíz y los tallos de tabaco).

Ejemplos de emulsionantes y/o agentes espumantes incluyen los emulsionantes aniónicos y no iónicos (por ejemplo los ésteres de ácidos grasos polioxietilenados, los éteres de alcoholes de ácidos grasos polioxietilenados (por ejemplo el alquilarilpoliglicoléter), las sales de los ácidos alquilsulfónicos, las sales de los ácidos
20 alquilsulfúricos y las sales de los ácidos arilsulfónicos) y los hidrolizados de albúmina.

Ejemplos de dispersantes comprenden soluciones residuales de sulfito de lignina y la metilcelulosa.

Los agentes sólidos pueden ser empleados para las formulaciones (agentes en estado polvo, agentes granulados y emulsiones) y ejemplos de agentes aglutinantes
25 pueden incluir la carboximetilcelulosa, los polímeros naturales y sintéticos (por

ejemplo la goma arábica, el alcohol poli(vinílico) y el acetato de poli(vinilo)).

Pueden usarse agentes colorantes y ejemplos de agentes colorantes incluyen los pigmentos inorgánicos (por ejemplo el óxido de hierro, el óxido de titanio, el azul de Prusia); los colorantes orgánicos tales como los colorantes de alizarina, los colorantes azoicos y los colorantes de ftalocianina metálicos; y también elementos en trazas tales como las sales de hierro, de manganeso, de boro, de cobre, de cobalto, de molibdeno y de cinc.

Por regla general, las formulaciones pueden contener los productos activos en un intervalo comprendido entre un 0,1 y un 95 % en peso, de manera preferente entre un 0,5 y un 90 % en peso.

Los productos activos de la fórmula (I) pueden presentarse en forma de agentes mezclados con otros productos activos, por ejemplo, insecticidas, alimentos venenosos, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, agentes de desmoldeo, agentes de control de la reproducción y herbicidas en formulaciones empleables en el comercio y formas de aplicación producidas a partir de estas formulaciones. En este caso, son ejemplos de insecticidas los agentes órgano fosforados, los agentes del carbamato, agentes químicos del carboxilato, agentes químicos del tipo de los hidrocarburos clorados y las sustancia insecticida producida por microorganismos.

Los productos activos de la fórmula (I) pueden presentarse en forma de agentes mezclados con sinérgicos y las formulaciones y las aplicaciones de los mismos pueden ser las que son usuales en el comercio y los sinérgicos son compuestos que no son activos en si mismos, pero que intensifican la función de los productos activos.

Los contenidos de los productos activos de la fórmula (I) en las formas de aplicaciones comercializadas pueden variar dentro de amplios límites.

La concentración para el uso práctico de los productos activos de la fórmula (I)

- 28 -

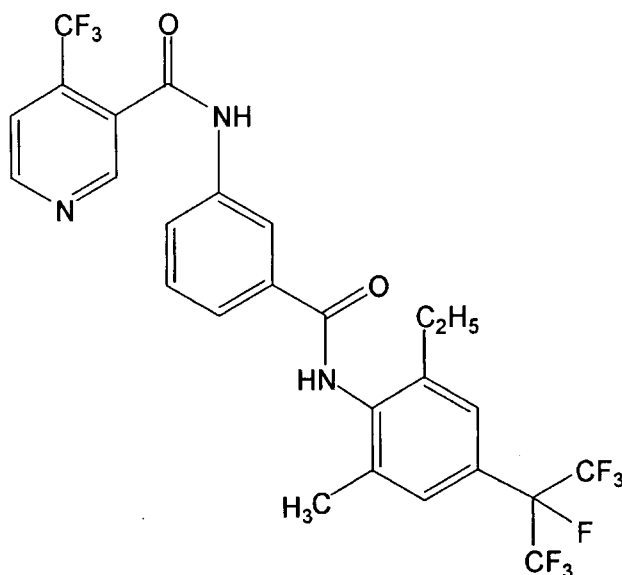
puede encontrarse en un intervalo comprendido entre un 0,0000001 y un 100 % en peso, de manera preferente comprendido entre un 0,00001 y un 1 % en peso.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden ser empleados de maneras usuales, adecuadas a las aplicaciones.

- 5 Los productos activos de la invención tienen una estabilidad eficiente frente a las sustancias alcalinas de encalado cuando se utilizan contra insectos perjudiciales para la higiene y contra insectos perjudiciales para los productos almacenados y tienen una excelente propiedad de persistencia sobre la madera y sobre el suelo.

La invención describe a continuación de una manera mas concreta por medio
10 de ejemplos; sin embargo, no debe considerar que la invención queda limitada a los ejemplos descritos.

Ejemplo de síntesis 1

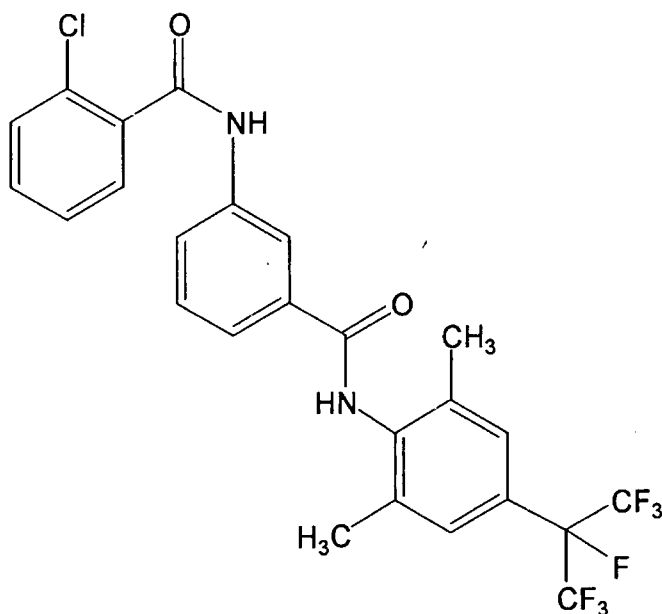


- Se añadieron 3-amino-N-(2-etil-6-metil-4-heptafluorisopropilfenil)benzamida
15 (0,21 g) y trietilamina (0,07 g) a THF (30 ml) y se añadió cloruro de 4-trifluormetilnicotinilo (0,12 g) y se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Una

vez completada la reacción, se eliminó el disolvente por medio de destilación a presión reducida y se refinó el residuo obtenido por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (mezcla de disolventes formada por n-hexano-acetato de etilo) para obtener el producto deseado, la 3-[4-(trifluórmetil)nicotinil]amino-N-(2-etil-6-metil-4-heptafluorisopropilfenil)benzamida (0,26 g).

Punto de fusión: 176 a 179°C.

Ejemplo de síntesis 2



Se añadió cloruro de 3-(2-clorobenzoil)aminobenzoilo (0,30 g) a una solución en THF (10 ml) de 2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilánilina (0,32 g), de piridina (0,16 ml) y de 4-dimetilaminopiridina (0,012 g), a temperatura ambiente. Una vez agitada la mezcla de la reacción, a temperatura ambiente, durante 16 horas, se vertió sobre agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico 2N y se secó con sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y el residuo obtenido se refinó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (mezcla de disolventes formada por de n-hexano-acetato de

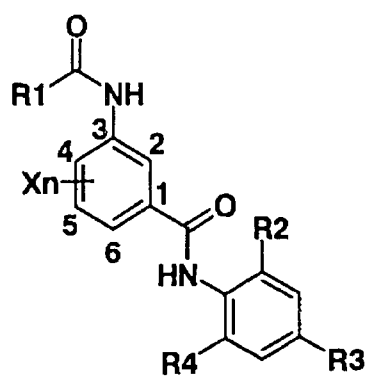
78

etilo) para obtener el producto deseado, la 3-(2-clorobenzoil)amino-N-(2,6-dimetil-4-heptafluorisopropilfenil)benzamida (0,23 g).

Punto de fusión: 141 a 145°C.

En la tabla 1 se muestran los compuestos, definidos por la fórmula (I) y obtenidos por medio de los mismos métodos que los de los ejemplos de síntesis 1 ó 2, mencionados precedentemente. En la tabla 1 se han mostrado, también, los compuestos obtenidos por medio de los ejemplos de síntesis 1 y 2.

[Tabla 1]



Nº	R1	R2	R3	R4	n	X	P.f. °C
1	4-(trifluórmetil)-piridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	176-179
2	4,6-difluórpíridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	181-182
3	6-cloropiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	237-238
4	6-cloropiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
5	2-fluórpíridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	102-105
6	2-cloropiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	121-124
7	2-bromopiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	118-

89

- 31 -

120

8	5-cloropiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
9	2-metilpiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
10	2-metilpiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
11	piridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
12	piridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
13	3-cloro-5-(trifluórmetil)-piridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	203- 205
14	3,5-dicloropiridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
15	3-cloropiridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
16	3-(trifluórmetil)-piridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
17	3-(trifluórmetil)-piridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
18	piridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
19	piridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
20	2,6-dicloropiridin-4-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
21	2-cloropiridin-4-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
22	piridin-4-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
23	piridin-4-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
24	2,5-diclorotiofen-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	90-94
25	2-clorotiofen-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
26	tiofen-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
27	5-clorotiofen-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
28	3-clorotiofen-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
29	3-clorotiofen-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
30	tiofen-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	182
31	tiofen-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
32	furan-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	97-99
33	furan-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
34	3-(terc-butil)-1-metilpirazol-5-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	102-

90

- 32 -

							106
35	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	223- 224
36	2-yodofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	134- 141
37	2-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	I	0	-	101- 105
38	2-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ F ₅	0	-	91-96
39	4-(trifluormetoksi)-fenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	153- 155
40	2-bromofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	105- 109
41	3-bromofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	164- 167
42	4-bromofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	205- 206
43	3,4-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	133- 135
44	2,4-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	129- 134
45	3,5-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	175- 176
46	2,6-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	137- 140
47	2,3-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	123- 128
48	2,5-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	115- 120
49	4-(trifluormetil)-fenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	195-

91

							197
50	3-(trifluórmetil)-fenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
51	2-(trifluórmetil)-fenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	134-
							139
52	2,4,6-trifluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	223-
							224
53	2-nitrofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	110-
							115
54	2,6-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	118-
							121
55	2,3-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	165-
							167
56	2,4-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	187-
							188
57	2-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	114-
							120
58	3-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	162-
							165
59	4-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	163-
							168
60	4-metoxifenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	192-
							194
61	4-flúorfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	174-
							176
62	3-flúorfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	175-
							177
63	2-flúorfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	164-
							166
64	4-metilfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	213-

45.

89	4-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	0	-
90	2-flúorfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	0	-
91	4-clorofenilo	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-
92	2,6-diflúorfenilo	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-
93	4-flúorfenilo	Cl	SCF ₃	Cl	0	-
94	3-flúorfenilo	Cl	SC ₂ F ₅	Cl	0	-
95	2-flúorfenilo	Cl	SC ₃ F _{7-n}	Cl	0	-
96	2-clorofenilo	Cl	S(O)CF ₃	Cl	0	-
97	3-clorofenilo	Cl	S(O)C ₂ F ₅	Cl	0	-
98	4-clorofenilo	Cl	S(O)C ₃ F _{7-n}	Cl	0	-
99	2,6-diflúorfenilo	Cl	SO ₂ CF ₃	Cl	0	-
100	2,3-diflúorfenilo	Cl	SO ₂ S ₂ F ₅	Cl	0	-
101	2,4-diflúorfenilo	Cl	SO ₂ C ₃ F _{7-n}	Cl	0	-
102	4-clorofenilo	CH ₃	SCF ₃	CH ₃	0	-
103	4-flúorfenilo	CH ₃	SC ₂ F ₅	CH ₃	0	-
104	2-flúorfenilo	CH ₃	SC ₃ F _{7-n}	CH ₃	0	-
105	2,4-diflúorfenilo	CH ₃	SO ₃ C ₃ F _{7-n}	CH ₃	0	-
106	4-metiltofeno	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-
107	4-(trifluormetil)-piridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F
108	4,6-difluorpiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F
109	6-cloropiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F
110	3-cloro-5-(trifluormetil)piridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F
111	2-bromofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F
112	3,4-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F
113	2,4-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F
114	2,6-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F
115	2,3-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F

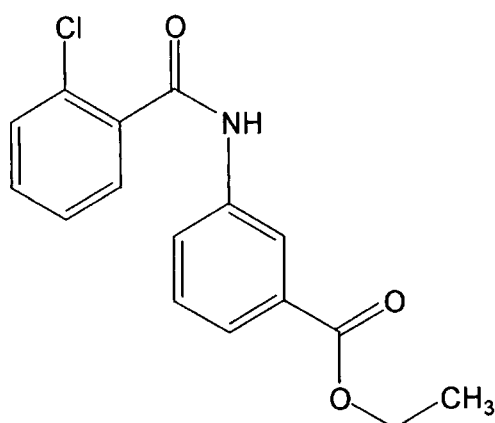
116	2,5-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
117	3-(trifluórmetil)fenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
118	2-(trifluórmetil)fenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
119	2,4,6-trifluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
120	2-nitrofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
121	2,6-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
122	2,3-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
123	2,4-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
124	2-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
125	3-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
126	4-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
127	3-fluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
128	2-fluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-F	
129	2,3-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
130	2,5-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
131	2,6-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
132	2,3-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
133	2,4-difluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
134	2-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	193- 194
135	3-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
136	3-fluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
137	2-fluórfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
138	2-metilfenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	
139	4-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-F	183- 184
140	3,5-diclorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2- Cl	
141	4-bromofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	1	2-	

95

						Cl	
142	2-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-	> 250
						Cl	
143	2-clorofenilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	1	2-	> 250
						CH ₃	
144	3-metoxi(5-(trifluórmetil)-tiofen-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	230-231
145	5-cloro-1-metil-3-(trifluórmetil)-pirazol	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	101-106
146	4-bromo-1-etil-3-metilpirazol-5-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	91-97
147	5-metilisoxazol-4-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	216-217
148	isoxazol-5-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	91-99
149	2-cloropiridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	120-124
150	6-fluórpíridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
151	6-fluórpíridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
152	3-hidroxipiridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	
153	4-(trifluórmetil)-piridin-2-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	0	-	
154	6-cloro-4-(trifluórmetil)-piridin-3-ilo	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	0	-	

Ejemplo de síntesis 3 (material de partida/ producto intermedio)

- 38 -

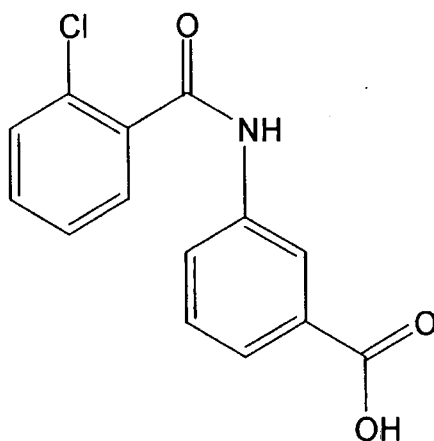


Se añadió cloruro de o-torbenzoilo (3,34 g) a una solución en THF (10 ml) que contenía m-aminobenzoato de etilo (3,00 g) y piridina (2,16 g) bajo refrigeración con hielo. Una vez que mezcla de la reacción se agitó durante 1 hora bajo refrigeración con hielo, se vertió sobre agua y se llevó a cabo la extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó por medio de sulfato de magnesio anhidro. Una vez eliminado el disolvente por destilación, se lavó el producto bruto obtenido con una mezcla de disolventes formada por hexano y por terc.-butilmetiléter para obtener el compuesto deseado, el éter de etilo del ácido 3-(2-clorobenzoil)aminobenzoico (5,00 g).

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8,18 (1H, br, a), 8,13 (1H, br, a), 8,09 (1H, d, $J = 8,1$ Hz), 7,84 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 7,74 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 7,30-7,52 (4H, m), 4,34 (2H, q, $J = 7,2$ Hz), 1,38 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de síntesis 4 (material de partida/ producto intermedio)

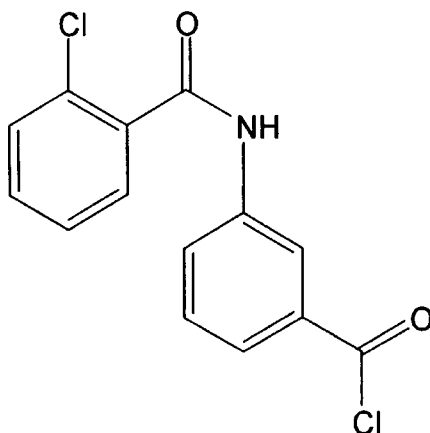
- 39 -



Se agitó a temperatura ambiente una mezcla de éter de etilo del ácido 3-(2-clorobenzoyl)aminobenzoico (4,00 g), de hidróxido de potasio (4,7 ml de agua) y de etanol (20 ml) durante 4 horas. La mezcla de la reacción se diluyó con agua y se acidificó con ácido clorhídrico 2N y el producto en bruto, precipitado, se lavó con agua y se secó para obtener el ácido 3-(2-clorobenzoyl)aminobenzoico (3,04 g).

^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 13,0 (1H, br, s), 10,7 (1H, s), 8,40 (1H, s), 7,90 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 7,70 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 7,42-7,64 (5H, m).

Ejemplo de síntesis 5 (material de partida / producto intermedio)



10

Se añadió una gota de DMF a una solución de 1,2-dicloroetano, que contenía ácido 3-(2-clorobenzoyl)aminobenzoico (3,52 g) y, a continuación, se añadió cloruro de

tionilo (1,86 ml) y la mezcla se calentó y se mantuvo a reflujo durante 6 horas. Una vez que el disolvente fue eliminado por destilación, se empleó el producto bruto, el cloruro de 3-(2-clorobenzoil)aminobenzoilo, para la siguiente etapa sin tratamiento de refinado.

5 Ejemplo de ensayo biológico 1: Ensayo frente a larvas de Spodoptera litura

Preparación de la solución de muestra

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de polioxietilenoalquilfeniléter

10 Para preparar un producto activo apropiado, se mezcló 1 parte en peso del producto activo con el disolvente, mencionado precedentemente, que contenía el emulsionante, mencionado precedentemente, y la mezcla se diluyó con agua hasta una concentración prescrita.

Método de ensayo

15 Se sumergieron hojas de batata en la solución de muestra diluida con agua hasta una concentración prescrita y, a continuación, se secó la solución al aire y las hojas resultantes se pusieron en una placa de laboratorio y se liberaron 10 larvas de Spodoptera litura en el tercer estadio y se pusieron en un invernadero a una temperatura de 25°C y se añadieron las hojas de batata el segundo día y el cuarto día y se investigó el número de larvas muertas al cabo de 7 días y se calculó la tasa de
20 larvas muertas.

Los resultados fueron los valores medios de dos placas de laboratorio respectivamente para 1 grupo en este ensayo.

Resultados de el ensayo

25 Los compuestos precedentemente mencionados 1, 3, 13, 24, 30, 32, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59,

60, 61, 62, 63, 64, 66, 72, 77, 88, 134, 139 mostraron en el ejemplo de ensayo biológico 1, mencionado precedentemente, a título de ejemplos representativos, el efecto de prevención de la reproducción y de exterminación a una concentración del producto activo de 20 ppm con una tasa insecticida del 100 %.

5 Ejemplo de ensayo biológico 2: Ensayo frente a *Myzus persicae* resistente al agente órganofosforado y al agente de carbamato

Método de ensayo

Se inocularon 30 *Myzus persicae* adultos, resistente al agente órgano fosforado y al agente de carbamato, respectivamente en un tiesto de vinilo con un
10 diámetro de 6 cm, en los que se sembraron semillas berenjenas y al cabo de 1 día, desde la inoculación, se pulverizó suficientemente, por medio de una pistola de aspersión, el producto activo, precedentemente indicado, diluido con agua para alcanzar una concentración prescrita. Tras la pulverización, se dejaron los tiestos de vinilo en un invernadero a 28°C y se calculó la tasa de exterminación de los insectos al
15 cabo de 7 días, desde la pulverización. El ensayo se repitió dos veces.

Resultados de el ensayo

Los compuestos precedentemente mencionados números 1, 57, 58, 61, 63 y 139 mostraron, como ejemplos representativos, el efecto de prevención de la reproducción y de la exterminación y prevención de la reproducción con una
20 concentración del producto activo de 500 ppm con una tasa insecticida del 100 %.

Ejemplo de ensayo biológico 3: Ensayo frente a *Tetranychus urticae* (ensayo por pulverización)

Método de ensayo

Se inocularon entre 50 y 100 adultos de *Tetranychus urticae* en hojas en el
25 estadio de dos hojas de frijoles plantados en tiestos con un diámetro de 6 cm y, al

cabo de 1 día, se pulverizó suficientemente, por medio de una pistola de aspersión, el producto activo, precedentemente citado, diluido con agua para alcanzar una concentración prescrita. Los tiestos se dejaron, tras la pulverización, en un invernadero y se calculó la tasa de exterminación de los insectos al cabo de 7 días, desde la pulverización.

Resultados de el ensayo

Como ejemplos representativos, Los compuestos precedentemente mencionados números 1, 3, 13, 39, 43, 44, 45, 46, 47, 49, 54, 57, 58, 59, 61, 63, 64, 88 y 134 mostraron, a título de ejemplos representativos, el efecto de prevención de la reproducción y de exterminación con una concentración del producto activo de 500 ppm con una tasa insecticida del 98 % o por encima de este valor.

Ejemplo de formulación 1 (granulados)

Se añadieron 25 partes de agua a una mezcla que contenía 10 partes del compuesto de la invención (número 1), 30 partes de bentonita (montmorillonita), 58 partes de talco y 2 partes de sal del ácido ligninsulfónico y la mezcla se amasó bien y se granuló con 10 hasta 40 mallas por medio de un granulador por extrusión y se secó a 40 hasta 50°C para obtener granulados.

Ejemplo de formulación 2 (granulados)

Se pusieron 95 partes de granulados de mineral de arcilla, que tenían una distribución del diámetro de las partículas de 0,2 hasta 2 mm, en una mezcladora giratoria y, se pulverizaron, bajo rotación, 5 partes del compuesto de la invención (número 3) junto con un diluyente líquido y se humectó uniformemente y se secó a 40 hasta 50°C para obtener granulados.

Ejemplo de formulación 3 (emulsión)

Se obtuvo una emulsión por mezcla de 30 partes del compuesto de la invención

(número 13), 55 partes de xileno, 8 partes de polioxietilenaalquilfeniléter y 7 partes de alquilbencenosulfonato de calcio.

Ejemplo de formulación4 (agente hidratado)

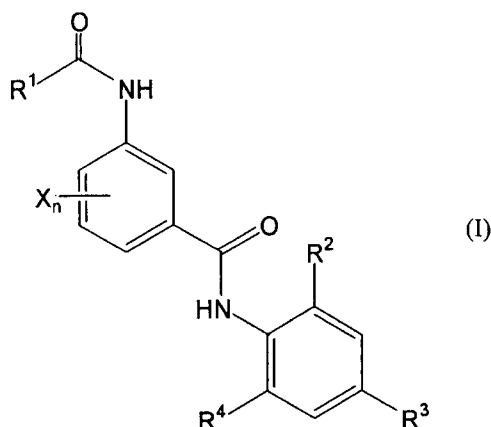
Se obtuvo un agente hidratado por mezcla de 15 partes del compuesto de la invención(número 24), 80 partes de una mezcla de carbónblanco (polvo fino de óxido de silicio amorfo, hidratado) y arcilla en polvo (1:5), 2 partes de alquilbencenosulfonato de sodio y 3 partes de condensado de alquilnaftalenosulfonato de sodio-formalina y por trituraciónla mezcla.

Ejemplo de formulación5 (granulado hidratado)

Se obtuvo un granulado hidratado por mezcla suficiente de 20 partes del compuesto de la invención (número 30), 30 partes de sal de sodio del ácido ligninsulfónico, 15 partes de bentonita, 35 partes de polvo de tierra de diatomeas calcinada, adiciónde agua, extrusiónla mezcla con un tamiz de 0,3 mm, y secado de los granulados extruidos.

REIVINDICACIONES

1.- Nuevas 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I)



en la que

- 5 R¹ significa fenilo que puede estar substituido o un grupo de anillo heterocíclico de 5 miembros o 6 miembros, que puede estar substituido, que contiene al menos un heteroátom o elegido entre el grupo constituido por N, O y S;
- R² significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átom os de carbono, o halógenoalquib con 1 hasta 6 átom os de carbono;
- 10 R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 6 átom os de carbono, halógenoalœxi con 1 hasta 6 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 áto mos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 át omos de carbono, o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átom os de carbono;
- R⁴ significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átom os de carbono, o halógenoalquib con 1 hasta 6 átom os de carbono;
- 15 X significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átom os de carbono, o halógenoalquib con 1 hasta 6 átom os de carbono; y
- n significa 0 ó 1.

2.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 1, en los que

- R¹ significa fenilo, opcionalmente substituido por, al menos, un grupo elegido entre el grupo constituido por alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno, o un grupo de anillo heterocíclico de 5 miembros o de 6 miembros, que contiene, al menos, un heteroátomo elegido entre el grupo constituido por N, O y S y, opcionalmente, substituido con, al menos, un grupo elegido entre alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno;
- 20 R² significa halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquib con 1 hasta 4 átomos de carbono;
- R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;

- R⁴ significa halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquib con 1 hasta 4 átomos de carbono;
- X significa halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquib con 1 hasta 4 átomos de carbono; y
- 5 n significa 0 ó 1.
- 3.- Los compuestos de conformidad con la reivindicación 1, en los que
- R¹ significa fenilo, opcionalmente substituido por, al menos, un grupo elegido entre el grupo constituido por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono,
 - 10 alquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, nitro, hidroxí y
 - 15 halógeno; o piridilo, pirazolilo, tienilo, furilo, isoxazolilo o tiadiazolilo, opcionalmente substituido por, al menos, un grupo elegido entre el grupo constituido por alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, nitro, hidroxí y
 - 20 halógeno.
- 25 R² significa flúor, cloro, yodo, metilo, etilo, propilo, butilo, trifluórmétilo, o

pentaflúoretilo;

R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoaloxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;

R⁴ significa flúor, cloro, yodo, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, t-butilo, trifluormetilo o pentaflúoretilo;

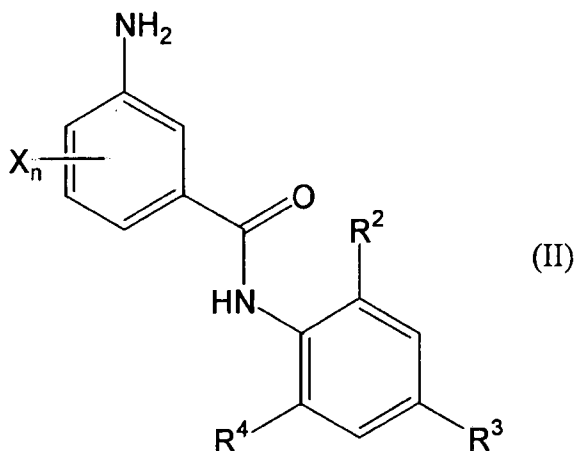
X significa flúor, cloro o metilo; y

n significa 0 ó 1.

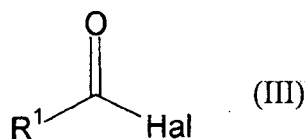
4.- Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula (I) de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque

Método de obtención(a):

se hacen reaccionar los compuestos de la fórmula (II)



en la que R², R³, R⁴, X y n son los mismos que se han definido precedentemente, con los compuestos de la fórmula (III)



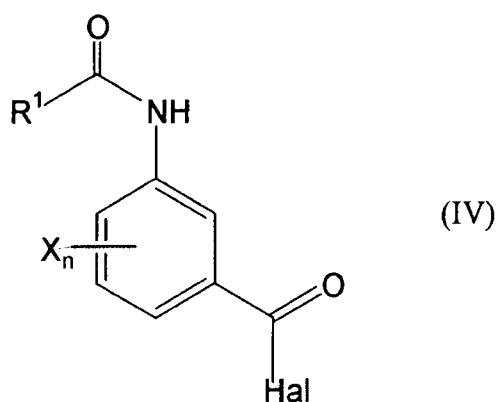
en la que R^1 es el mismo que se ha definido precedentemente y Hal significa un halógeno,

en presencia de disolventes inertes y, en caso dado, en presencia de una base y de un catalizador de transferencia de fases,

5 o

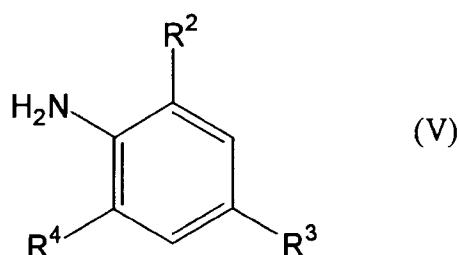
Método de obtención(b):

se hacen reaccionar los compuestos de la fórmula (IV)



en la que R^1 , X, n y Hal son los mismos que se han definido precedentemente,

10 con los compuestos de la fórmula (V)



en la que R^2 , R^3 , y R^4 son los mismo que se han definido precedentemente,

en presencia de disolventes inertes y, en caso dado, en presencia de una base y de un catalizador de transferencia de fases.

15 5.- Composiciones insecticidas, caracterizadas porque contienen, al menos, una 3-acilaminobenzanilida de la fórmula (I).

6.- Procedimiento para combatir a las malas hierbas, caracterizado porque se dejan actuar las 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I) sobre los insectos perjudiciales y/o sobre su hábitat y/o sobre el material de propagación.

5 7.- Empleo de las 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I) para combatir a los insectos perjudiciales.

8.- Procedimiento para la preparación de composiciones insecticidas, caracterizado porque se mezclan las 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I) con agentes entendedores y/o agentes tensioactivos.

10 9.- Empleo de las composiciones de conformidad con la reivindicación 5 para el tratamiento de las semillas.

10.- Empleo de las composiciones de conformidad con la reivindicación 5 para el tratamiento de las plantas transgénicas.

11.- Empleo de las composiciones de conformidad con la reivindicación 5 para el tratamiento de las semillas de las plantas transgénicas.

15 12.- Método para el tratamiento de las semillas que comprende el tratamiento de las semillas con una composición de conformidad con la reivindicación 5.

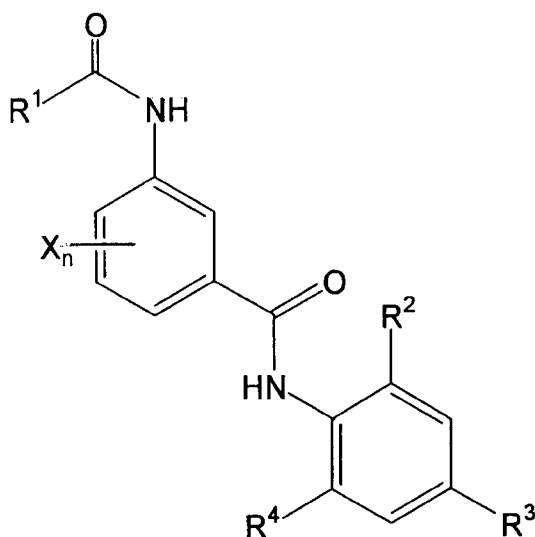
13.- Método para el tratamiento de las plantas transgénicas, que comprende la aplicación de una composición de conformidad con la reivindicación 5.

20 14.- Método para el tratamiento de las semillas de las plantas transgénicas, que comprende el tratamiento de las semillas de las plantas transgénicas con una composición de conformidad con la reivindicación 5.

15.- Semillas tratadas con una composición de conformidad con la reivindicación 5.

- 50 -
R E S U M E N

Nuevas 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I)



en la que R¹ significa fenilo, que puede estar substituido, o un grupo de anillo
 5 heterocíclico con 5 miembros o con 6 miembros, que puede estar substituido, que
 contiene, al menos, un heteroátom o elegido entre el grupo constituido por N, O y S;
 R² significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1
 hasta 6 átomos de carbono; R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de
 carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1
 10 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono o
 halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono; R⁴ significa halógeno, alquib
 con 1 hasta 6 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono;
 X significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1
 hasta 6 átomos de carbono; y n significa 0 ó 1 y los compuestos se emplean como
 15 insecticidas, y un empleo de los nuevos compuestos como insecticidas.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2006/007203

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. C07C237/42 A01N37/22

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)
C07C A01N

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 practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; YOSHIDA, KEI ET AL: "Preparation of 3-benzoylamino benzamide derivatives and related amides derivatives as insecticides" XP002406766 retrieved from STN Database accession no. 143:211723 Compounds annexed to the abstract abstract & WO 2005/073165 A1 (MITSUI CHEMICALS, INC., JAPAN) 11 August 2005 (2005-08-11)	1-15
A	EP 1 516 874 A (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 23 March 2005 (2005-03-23) page 89, table 1, entry 450; claims 1-12 ----- -/-	1-15

☒ 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 document 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

10 November 2006

Date of mailing of the international search report

24/11/2006

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Kleidernigg, Oliver

109

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2006/007203

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	GB 1 082 045 A (GEIGY U K LTD) 6 September 1967 (1967-09-06) example 4 -----	4

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2006/007203

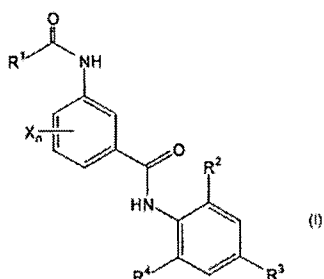
Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2005073165 A1	11-08-2005	AR 047456 A1	18-01-2006
		AU 2004315003 A1	11-08-2005
		CA 2554437 A1	11-08-2005
		EP 1714958 A1	25-10-2006
EP 1516874 A	23-03-2005	EP 1516875 A1	23-03-2005
GB 1082045 A	06-09-1967	BE 656885 A	09-06-1965
		BE 662639 A	18-10-1965
		BE 663515 A	08-11-1965
		BE 671911 A	05-05-1966
		BE 671912 A	05-05-1966
		BE 673015 A	16-03-1966
		BE 675798 A	01-08-1966
		BE 675908 A	01-08-1966
		BE 676210 A	08-08-1966
		CH 469788 A	15-03-1969
		CH 469789 A	15-03-1969
		CH 476078 A	31-07-1969
		CH 455103 A	30-04-1968
		CH 465105 A	15-11-1968
		CH 446575 A	15-11-1967
		CH 457672 A	15-06-1968
		CH 457673 A	15-06-1968
		CH 446576 A	15-11-1967
		DK 117166 B	23-03-1970
		DK 117088 B	16-03-1970
		DK 117165 B	23-03-1970
		DK 117167 B	23-03-1970
		DK 117089 B	16-03-1970
		DK 117087 B	16-03-1970
		GB 1078366 A	09-08-1967
		GB 1067244 A	03-05-1967
		GB 1042636 A	14-09-1966
		GB 1077235 A	26-07-1967
		GB 1092451 A	22-11-1967
		NL 129433 C	
		NL 6410993 A	22-03-1965
		NL 6414313 A	11-06-1965
		NL 6504888 A	18-10-1965
		NL 6505682 A	08-11-1965
		NL 6514409 A	09-05-1966
		NL 6514411 A	09-05-1966
		US 3328410 A	27-06-1967

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT

(21) N° de solicitud: (22) Fecha de solicitud: (30) Prioridad (31) Prioridad (32) Fecha (33) País 2005-220049 29/07/2005 JP	(51) Int Cl: C07C 237/042 (71) Solicitante(s) BAYER CROPS SCIENCE AG (72) Inventor(es) AKIHIKO YANAGI Y OTROS (74) Apoderado: EMILIO FERRERO
(85) Fecha límite inicio fase nacional: 29/02/2008 (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 21/07/2006 No. de solicitud PCT/EP2006/007203	(87) Publicación internacional Fecha: 15/02/2007 N° publicación: WO 2007/017075 A1
(54) Título: 3-ACILAMINOBENZANILIDAS INSECTICIDAS	

Reivindicación(es):

1. Nuevas 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I)



en la que

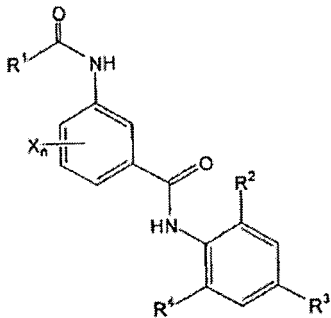
- R¹ significa fenilo que puede estar substituido o un grupo de anillo heterocíclico de 5 miembros o 6 miembros, que puede estar substituido, que contiene al menos un heteroátomo elegido entre el grupo constituido por N, O y S;
- R² significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquib con 1 hasta 6 átomos de carbono;
- R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquililitio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono;
- R⁴ significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono; o halógenoalquib con 1 hasta 6 átomos de carbono;
- X significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquib con 1 hasta 6 átomos de carbono; y
- n significa 0 ó 1.

2. Los compuestos de conformidad con la reivindicación 1, en los que

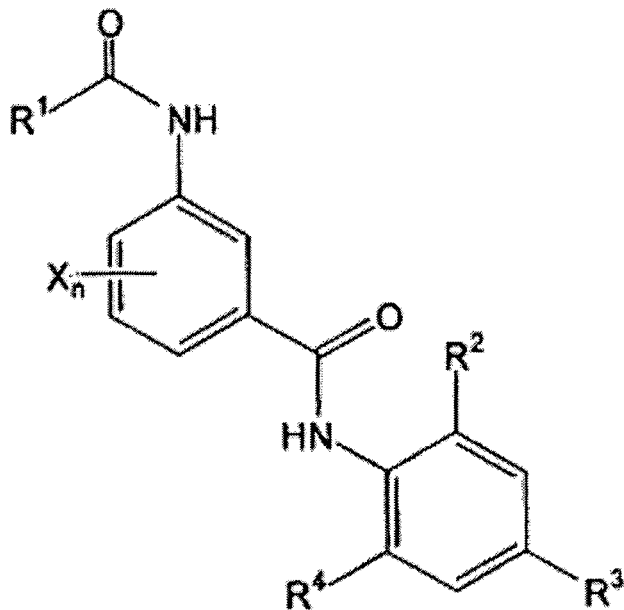
- R¹ significa fenilo, opcionalmente substituido por, al menos, un grupo elegido entre el grupo constituido por alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomo de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno, o un grupo de anillo heterocíclico de 5 miembros o de 6 miembros, que contiene, al menos, un tereroátomo elegido entre el grupo constituido por N, O y S y, opcionalmente, substituido con, al menos, un grupo elegido entre alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, nitro, hidroxí y halógeno;

- R² significa halógeno, alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquib con 1 hasta 4 átomos de carbono;

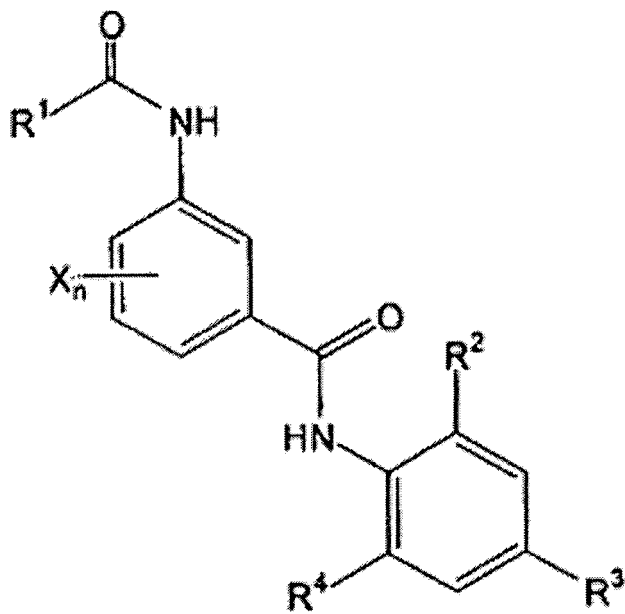
- R³ significa halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalcóxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfínilo con 1 hasta 4 átomos de carbono o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 4 átomos de carbono;



(I)



(I)



(I)

113.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 1,693
FECHA : ENERO 8 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-008493- -00000-0000

Fecha: 2008-01-29 16:42:17 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 113

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2808481	08/01/2008	56,858,000.00

***** CONCEPTO *****

CONT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	501,000.00
	TOTAL :	\$ 501,000.00

SON: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 13549-841-119-2



No. 08-008493- -00000-0000

Fecha: 2008-01-29 16:42:17 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios 113

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 ☐

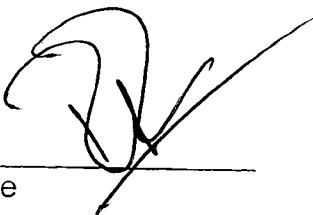
INCOMPLETA ☐

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 ☐

Firma Responsable 

Fecha _____

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