



Organización y
Digitalización CSA Ltda



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

RECEIVED
INVENTARIO

PGT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

10-108108

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

PLAGUICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

DOW AGROSCIENCES LLC

DOMICILIO

INDIANAPOLIS, INDIANA, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

74. APODERADO

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D.C.,



PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 10-108108- -00000-0000

Fecha: 2010-09-01 16:53:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 411 PRESENTACION Folios: 293

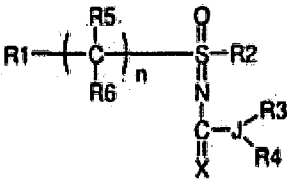
FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:		
1	☒ Patente de Invención. ☒ Capítulo I.	☐ Patente de Modelo de Utilidad. ☐ Capítulo II.
2 SOLICITANTE (71)	Nombre: DOW AGROSCIENCES LLC Sociedad constituida y existente bajo las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América. Dirección: 9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana 46268-1054, Estados Unidos de América Domicilio: Indianapolis, Indiana, Estados Unidos de América	IDENTIFICACIÓN C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ 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 35.456.344 T.P 23.555
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Nneka BREAU 1526 East Sturm Avenue, Indianapolis, Indiana 46201, Estados Unidos de América 3. Timothy JOHNSON 2010 Brewster Road, Indianapolis, Indiana 46260 Estados Unidos de América 5. Benjamin NUGENT 5325 Michael Court, Brownsburg, Indiana 46112, Estados Unidos de América 7. Annette BROWN 8132 Shottery Terrace, Indianapolis, Indiana 46268 Estados Unidos de America 9. William LO 12027 Weathered Edge Drive, Fishers, Indiana 46037, Estados Unidos de América	
	2. Michael LOSO 11439 Sutton Place Drive, Carmel, Indiana 46032, Estados Unidos de América 4. Jonathan BABCOCK 13668 Magic Stallion Drive, Carmell, Indiana 46032 Estados Unidos de América 6. Timothy MARTIN 6095 Ramsey Drive, Noblesville, Indiana 46062, Estados Unidos de América 8. Ronald ROSS 445 West Hawthorne Street Zionsville, Indiana 46077, Estados Unidos de América 10 Matthias OBER 2604 Hearthstone, Midland, Michigan 48642, Estados Unidos de América	

5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/US2009/035475</u> Fecha: <u>27 de febrero de 2009</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2009/111309 A1</u> Fecha: <u>11 de septiembre de 2009</u>		
6	Título (54) <u>PLAGUICIDAS</u> (folio 247)		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07C 381/010</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>US</u>	(32) Fecha <u>03 de marzo de 2008</u>
			(31) Número de Solicitud <u>61/067,874</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>10-67,888</u> Fecha: <u>18 de agosto de 2010</u> Comprobante de pago No.: <u>10-67,830</u> Fecha: <u>18 de agosto de 2010</u> Comprobante de pago No.: <u>10-67,958</u> Fecha: <u>18 de agosto de 2010</u> Comprobante de pago No.: <u>10-69,569</u> Fecha: <u>23 de agosto de 2010</u>		
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 554.000.oo. ☒ Comprobante de pago por 4 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$104.000.oo. ☒ 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		

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

FIRMA :

Lu2 Clemencia De Paez
C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P. 23.555

SCT

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2009/111309 A1

Descripción:

Páginas 91 en el idioma original

Páginas 156 en español

Reivindicaciones: Número (s) 14

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, S - COLOMBIA

REPRESENTACION, RATIFICACION Y PODER

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION, RATIFICATION AND POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned / Yo (nosotros), abajo firmado (s)
Dow AgroSciences LLC

of / domiciliado (s) en 9330 Zionsville Road,
Indianapolis, Indiana 46268, United
States of America,

por el presente ratificamos la _____
presentada por _____
como agente oficioso ante _____
en _____
el _____

y por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 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 al 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.

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 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, 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 o judicial, nulidad,

hereby ratify the _____
_____ filed without a Power of Attorney by _____
_____ before _____
_____ in _____
_____ on _____

and do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, in due compliance with the terms of Paragraph 1st. of Article 543 of the Commercial Code, 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 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 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.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named _____ to obtain the protection of _____ against the unfair competition, _____ the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, especially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of _____ and industrial designs; the registration of trademarks, _____ and service marks, slogans, _____ trade emblems, 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

A la vuelta →

Over →

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.

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.

Given and signed this/Dado y firmado hoy _____

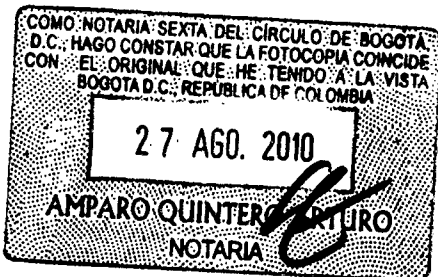
February 6, 1978

in/en Indianapolis, Indiana 46268

United States of America

Kenneth L. Loertscher Firma

Signature
Kenneth L. Loertscher
Assistant Secretary
& General Patent Counsel





Consulado General de Colombia

500 NORTH MICHIGAN AVENUE, SUITE 2040
CHICAGO, ILLINOIS 60611

TEL (312) 923-1196 FAX (312) 923-1197

No. 254

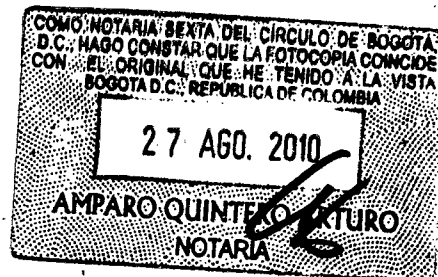
Chicago, FEB 20 1998

El suscrito Cónsul General de Colombia, CERTIFICA, que el señor (a) MARY REEVER, quien como SECRETARIA DELEGADA ESTADO, IN., autenticó la firma del signatario del poder precedente, ejercía en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la compañía DOW AGROSCIENCES LLC es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes de DELAWARE y cumple su objeto conforme a las mismas; que el (a) señor (a) KENNETH L. LOERTSCHER, quien en su carácter de REPRESENTANTE LEGAL de la citada compañía confiere el poder precedente, es su representante legal en este país.

El Cónsul General no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE Y DERECHOS CONSULARES
US\$56.00 (Cincuenta y seis dólares)

CARLOS ALFONSO NEGRETTE
Cónsul General



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

1998 MAR 11 11:55

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

221220
Veg
FIRMA PARECE EL
DOCUMENTO DESLEMPERNA
FUNCIONES INDICADAS

Bernarda R. de Martínez
Traductora e Interprete Oficial
Resolución 683 Minjusticia 1991

COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA
D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTA D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA
27 AGO. 2010
AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

visto los sigula
CADO DE CO
CADO DE MO
ION JUNTA
IMIENTO ES

chos document

Dow Agro

riedad/Comp

do con las ley
dos Unidos

Sue Ar

rdi record

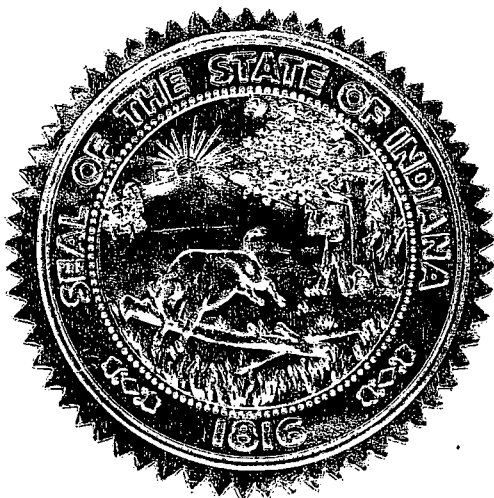
ppointed to th

that th term

I, Sue Anne Gilroy, Secretary of State of Indiana, DO HEREBY CERTIFY: That, according to records on file in my office, Lydia S. Owens was duly elected or appointed to the office of Notary Public in and for Hendricks County and that the term of said office included the date of February 6, 1998: that to all his/her official acts as said official,

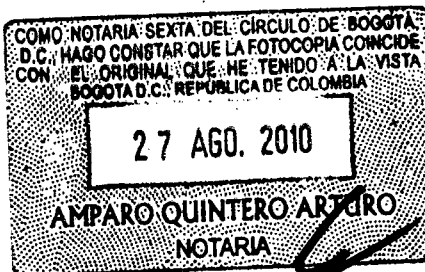
full faith and credit ought to be given in all Courts of Justice and elsewhere. In testimony whereof, I have hereunto set my hand and affixed the Great Seal of the State of Indiana, at Indianapolis, this Tenth day of

February, 1998



Sue Anne Gilroy
Secretary of State

by: *Mary Beever*
Deputy



CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO)

A los 6 días del mes de FEBRERO de 19 98
ante mí, Notario Público de ESTADO DE INDIANA
compareció(eron) personalmente KENNETH L. LOERTSCHER

a quien(es) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y quien(es)
tiene(n) capacidad legal para otorgarlo.

Notario Público — Notary Public

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

Hoy, 6 de FEBRERO de 19 98
compareció(eron) ante mí
KENNETH L. LOERTSCHER

a quien(es) conozco personalmente y que firma(n) este documen
to en representación de la Sociedad/compañía
denominada Dow AgroSciences LLC

Artifico:

1. Que he visto los siguientes documentos:*

CERTIFICADO DE CONSTITUCION, FECHADO 1 JULIO 1997
CERTIFICADO DE MODIFICACION, FECHADO 1 OCT. 1997
RESOLUCION JUNTA DIRECTIVA, FECHADO 23 OCT, 1991
CONSENTIMIENTO ESCRITO DE LA JUNTA, 1 JULIO 1997

2. Que dichos documentos prueban lo siguiente:

2.1. Que Dow AgroSciences LLC
es una Sociedad/Compañía legalmente constituida y existente
de acuerdo con las leyes de 1 Estado de Delaware,
Estados Unidos de América

2.2. Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, Estados Unidos de America.

2.3. Que el objeto u objeto para los cuales se otorga el presente
poder están comprendidos dentro del objeto social de la
mencionada Sociedad/Compañía.

2.4. Que el(los) Sr.(Sres.) KENNETH L. LOERTSCHER
SECRETARIO ASISTENTE Y ASESOR LEGAL PATENTES
está(n) autorizado(s) para otorgar el presente Poder.

Ciudad INDIANAPOLIS
Estado INDIANA

Hoy 6 FEB. de 19 98

Notario Público — Notary Public

* Los documentos deben identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL CERTIFICATE (INDIVIDUAL)

On this 6th day of February 19 98
before me, a Notary Public of State of Indiana.
personally appeared Kenneth L. Loertscher

to me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who has(have) legal
capacity to execute it.

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

On this 6th day of February 19 98
appeared before me
Kenneth L. Loertscher

who(m) I know personally and who(m) signed this document as
representative(s) of the ~~Corporation/Company~~ Limited
Liability
named Dow AgroSciences LLC Company.

I Certify:

1. That I have seen the following documents:*

Certificate of formation, dated July 1, 1997
Certificate of amendment, dated October 1, 1997
Board resolution, dated October 23, 1991
Board written consent, dated July 1, 1997

2. That the above documents duly prove the following:

2.1. That Dow AgroSciences LLC
Limited Liability
is a ~~Corporation/Company~~ Company legally constituted and in existence
in accordance with the laws of the State of Delaware,
United States of America

2.2. That the domicile of said ~~Corporation/Company~~ Limited Liability
Company is
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, United States of America.

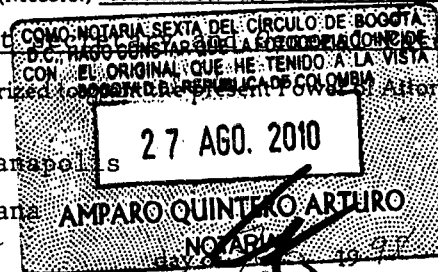
2.3. That the purpose of purposes for which the present Power
of Attorney is granted are comprised within the corporation
purposes set forth in the charter of the mentioned
~~Corporation/Company.~~ limited liability company.

2.4. That Mr.(Messrs.) Kenneth L. Loertscher
Assistant is Authorized to execute the present Power of Attorney.

City Indianapolis

State Indiana

This 6th



Lydia S. Owens

Lydia S. Owens
Notary Public, State of Indiana
Hendricks County
My Commission Expires 03/05/00

* Documents must be identified with date and origin.

11

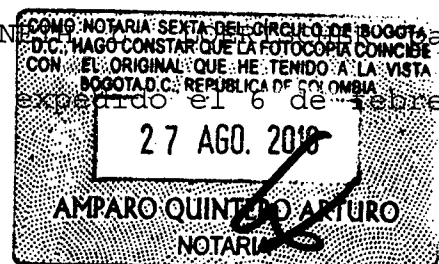
TRADUCCION OFICIAL No.03.075.98 de un documento escrito en inglés el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente. Esta traducción ha sido preparada por Bernarda R. de Martínez, Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia de Colombia mediante Resolución No. 683 de 1991.

(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuación de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Dow AgroSciences LLC, otorga Poder a favor de GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, EMILIO FERRERO y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ.)

Dado y firmado hoy 6 de febrero de 1998, en Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., por Kenneth L. Loertscher, Subsecretario y Asesor General de Patentes.

(Sellos parciales en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO), en inglés y español referente a la capacidad legal que tenía KENNETH L. LOERTSCHER para otorgar el documento antes mencionado, expedido el 6 de febrero de 1998 en el Estado de Indiana.



CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD), en inglés y español referente a la existencia legal de la sociedad Dow AgroSciences LLC, expedido en la Ciudad de Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., el 6 de febrero de 1998.

12

(Firmado), Lydia S. Owens, Notario Público
(Sello notarial en tinta), LYDIA S. OWENS Notario Público,
Estado de Indiana, Condado de Hendricks Mi comisión expira el
03/05/00
(Sello notarial seco), LYDIA S. OWENS NOTARIO PUBLICO INDIANA
(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en
Chicago.)

ESTADO UNIDOS DE AMERICA
CERTIFICADO DEL CARGO
ESTADO DE INDIANA

Yo, SUE ANN GILROY, Secretario de Estado de Indiana, POR EL
PRESENTE CERTIFICO: que, de acuerdo con los archivos que obran
en mi oficina, LYDIA S. OWENS fue debidamente elegido y
nombrado para el cargo de NOTARIO PUBLICO en y para el Condado
de Hendricks y que el término de dicho cargo incluía la fecha
del 6 de febrero de 1998: que a todos sus actos oficiales se
les debe dar completa fe y crédito dentro y fuera de todas las
Corte de Justicia. EN TESTIMONIO DE LO CUAL y
estampado el Gran Sello del Estado de Indiana, en Indianapolis,
hoy 10 de febrero de 1998.

(Firma facsimilar), Sue Ann Gilroy

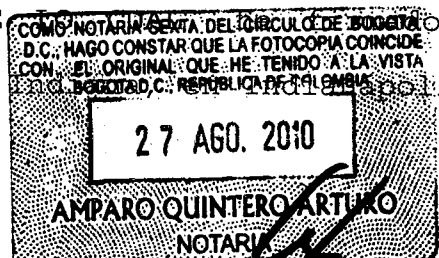
Secretario de Estado

(Firmado),

Por: Mary Reeve

Suplente

(Adherido se encuentra sello de oblea dorado con texto en
relieve), SELLO DEL ESTADO DE INDIANA 1816



(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

(En español), Certificación de la firma y cargo de MARY REEVER, de la existencia legal de la compañía DOW AGROSCIENCES LLC y de la autoridad que tenía su representante Legal, KENNETH L. LOERTSCHER, para otorgar el poder mencionado arriba. Esta certificación fue expedida por el CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA EN CHICAGO, ILLINOIS, bajo el N° 254, de fecha 20 de febrero de 1998 y firmada por Carlos Alfonso Negret Mosquera, Cónsul General. Pagados Impuesto de Timbre y Derechos Consulares por valor de veintiún dólares.

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

(al dorso), Legalización de la firma que antecede expedida por el MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES bajo el No. 221220, de fecha 11 de marzo de 1998 y firmada por el Jefe de Legalizaciones.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en los archivos de esta oficina para su AMPARO QUINTERO MARTINEZ, la cual me remito.

Bogotá, 17 de marzo de 1998

COLO 6641-801-001-3

BRM.137

COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA
D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTA D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA

27 AGO 2010

AMPARO QUINTERO MARTINEZ
NOTARIA

Bernarda R. de Martinez

Bernarda R. de Martinez

Traductora e Interprete Oficial

Resolución 683 Minjusticia 1991

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIOR(ES) FIRMA(S) PUESTA(S) POR

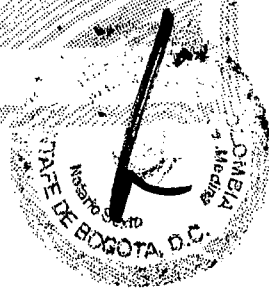
[Signature]

IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)

ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 17 MAR 1998





NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

98 MAR 18 AM 11:56

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

[Signature]

022686

[Signature]

CUYA FIRMA PARACE EN
DOCUMENTOS DE
LAS FUENTES

COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA D.C., HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA BOGOTA D.C., REPUBLICA DE COLOMBIA

27 AGO. 2010

AMPARO QUINTERO NOTARIO

CAVELIER
ABOGADOS

TENET ®
CABLES: CAVELEYES
TELEX: 45479 CAVE-CO
TELEX: (23) 7407375 CAVE-UC

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

14
TELEFONOS: (57) (1) 347-36 11
(57) (1) 212-01 00
TELEFAX: (57) (1) 217-92 11
(57) (1) 235-88 50

Señor Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Poderdante: DOW AGROSCIENCES LLC

Poder conferido el: 06-02-98

Yo, GERMAN CAVELIER, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor EMILIO FERRERO, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

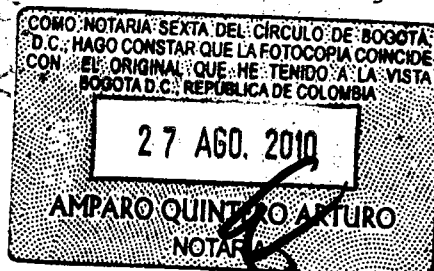
Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señor Jefe,

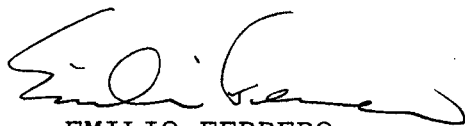

GERMAN CAVELIER

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá



Acepto:


EMILIO FERRERO

T.P.A. No 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén

2e-780-2

NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Bogotá, D. C.

25 FEB 1998

Año M, PABLO MENDEZ BARAJAS S.

NOTARIO SEXTO ENCARGADO DEL CIRCULO DE BOGOTA.

Comparecencia (eron)

[Signature]

[Signature]

que (n) es (son) la(s) C. C.

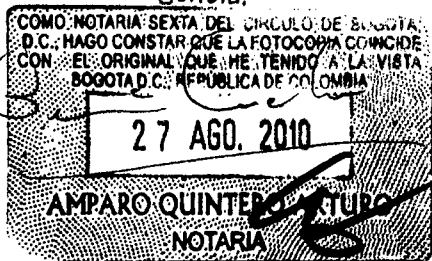
478019

2877924

77832 7721229

domiciliado(s) en Bogotá y donó(aron) que la(s) firma(s) que
aparecen(n) en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
que el contenido del mismo es cierto.

En constancia se firma esta Diligencia.



[Signature]

NOTARIA SEXTA
PABLO MENDEZ
BARAJAS
Notario Sexto Encargado

CAVELIER

ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

TELEFONO: (57) (1) 347-3611
TELEFAX: (57) (1) 217-9211 (57) (1) 310-4995

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

Poderdante : DOW AGROSCIENCES LLC

Poder conferido el : 06/02/1998

Yo, EMILIO FERRERO, obrando como apoderado principal del poderdante arriba mencionado, mediante el presente escrito sustituyo el poder a mi otorgado a la doctora LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, identificada con cédula de ciudadanía No. 35.456.344 y Tarjeta Profesional N°23.555, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil.



EMILIO FERRERO

T.P.A. N° 31.929

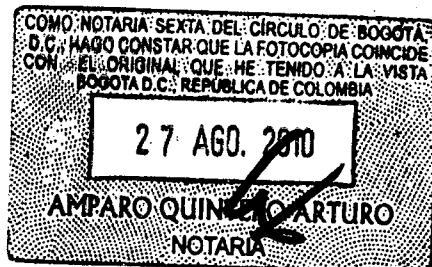
C.C. N° 438.019 de Usaquén

Acepto:


LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

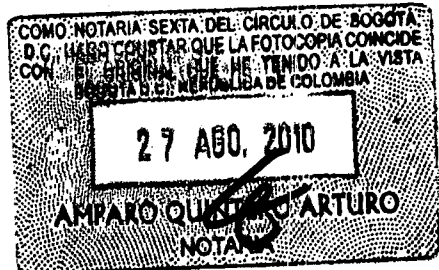
T.P.A. N° 23.555

C.C. No. 35.456.344 de Usaquén



NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
 Bogotá, D.C.
 Ante mi AMPARO QUINTERO ARTURO
 NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE
 BOGOTA, D.C.
 Comparado(aron) *Emilio Ferrero*
Williamson y Luz Clemencia
Guarez de Paez
 Quien(es) exhibi(eron) la(s) C.C.
CC 438019 TP 31929
CC 35456344 TP 23555
 Y declaré(aron) que la(s) firme(s) que acompaña(n)
 en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
 que el contenido del mismo es cierto.
 En constancia se firma esta diligencia.

Emilio Ferrero
Luz Clemencia Guarez de Paez



(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
11 September 2009 (11.09.2009)

(10) International Publication Number
WO 2009/111309 A1

(51) International Patent Classification:

C07C 381/10 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01)
C07D 213/14 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
C07D 213/75 (2006.01) A01N 43/40 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) A01N 47/00 (2006.01)
C07D 407/12 (2006.01)

(21) International Application Number:

PCT/US2009/035475

(22) International Filing Date:

27 February 2009 (27.02.2009)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

61/067,874 3 March 2008 (03.03.2008) US

(71) Applicant (for all designated States except US): DOW AGROSCIENCES LLC [US/US]; 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268-1054 (US).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): BREAU, Nneka [US/US]; 1526 East Sturm Avenue, Indianapolis, IN 46201 (US). LOSO, Michael [US/US]; 11439 Sutton Place Drive, Carmel, IN 46032 (US). JOHNSON, Timothy [US/US]; 2010 Brewster Road, Indianapolis, IN 46260 (US). BABCOCK, Jonathan [US/US]; 13668 Magic Stallion Drive, Carmel, IN 46032 (US). NUGENT, Benjamin [US/US]; 5325 Michael Court, Brownsburg, IN 46112 (US). MARTIN, Timothy [US/US]; 6095 Ramsey Drive, Noblesville, IN 46062 (US). BROWN, Annette [US/US]; 8132 Shutterly Terrace, Indianapolis, IN 46268 (US). ROSS, Ronald [US/US]; 445 West Hawthorne Street, Zionsville, IN

46077 (US). LO, William [US/US]; 12027 Weathered Edge Drive, Fishers, IN 46037 (US). OBER, Matthias [DE/US]; 2604 Hearthstone, Midland, MI 48642 (US).

(74) Agent: CORVIN, Carl; 9330 Zionsville Rd, Indianapolis, Indiana 46268 (US).

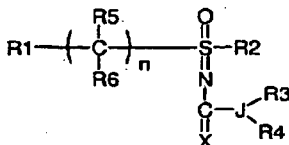
(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM,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

(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, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, 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 (Art. 21(3))
- before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments (Rule 48.2(h))

(54) Title: PESTICIDES



(57) Abstract: Compounds having the following generic Formula (I) and their use in controlling pests are disclosed.

PESTICIDES

Cross Reference to Related Application

This application claims the benefit of United States Provisional Application Serial Number 61/067,874 filed on March 3, 2008.

5 Field of the Invention

The invention disclosed in this document is related to the field of pesticides and their use in controlling pests.

Background of the Invention

Pests cause millions of human deaths around the world each year.
10 Furthermore, there are more than ten thousand species of pests that cause losses in agriculture. These agricultural losses amount to billions of U.S. dollars each year. Termites cause damage to various structures such as homes. These termite damage losses amount to billions of U.S. dollars each year. As a final note, many stored food pests eat and adulterate stored food. These stored food losses amount to
15 billions of U.S. dollars each year, but more importantly, deprive people of needed food.

There is an acute need for new pesticides. Insects are developing resistance to pesticides in current use. Hundreds of insect species are resistant to one or more pesticides. The development of resistance to some of the older pesticides, such as
20 DDT, the carbonates, and the organophosphates, is well known. But resistance has even developed to some of the newer pesticides. Therefore, a need exists for new pesticides and particularly for pesticides that have new modes of action.

Substituents (Non Exhaustive List)

The examples given for the substituents are (except for halo) non-exhaustive and must not be construed as limiting the invention disclosed in this document.

5 **“alkenyl”** means an acyclic, unsaturated (at least one carbon-carbon double bond), branched or unbranched, substituent consisting of carbon and hydrogen, for example, vinyl, allyl, butenyl, pentenyl, hexenyl, heptenyl, octenyl, nonenyl, and decenyl.

“alkenyloxy” means an alkenyl further consisting of a carbon-oxygen
10 single bond, for example, allyloxy, butenyloxy, pentenyloxy, hexenyloxy, heptenyloxy, octenyloxy, nonenyloxy, and decenyloxy.

“alkoxy” means an alkyl further consisting of a carbon-oxygen single bond, for example, methoxy, ethoxy, propoxy, isopropoxy, 1-butoxy, 2-butoxy, isobutoxy, *tert*-butoxy, pentoxy, 2-methylbutoxy, 1,1-dimethylpropoxy, hexoxy,
15 heptoxy, octoxy, nonoxy, and decoxy.

“alkyl” means an acyclic, saturated, branched or unbranched, substituent consisting of carbon and hydrogen, for example, methyl, ethyl, propyl, isopropyl, 1-butyl, 2-butyl, isobutyl, *tert*-butyl, pentyl, 2-methylbutyl, 1,1-dimethylpropyl, hexyl, heptyl, octyl, nonyl, and decyl.

20 **“alkynyl”** means an acyclic, unsaturated (at least one carbon-carbon triple bond, and any double bonds), branched or unbranched, substituent consisting of carbon and hydrogen, for example, ethynyl, propargyl, butynyl, pentynyl, hexynyl, heptynyl, octynyl, nonynyl, and decynyl.

“alkynyloxy” means an alkynyl further consisting of a carbon-oxygen single bond, for example, pentynyloxy, hexynyloxy, heptynyloxy, octynyloxy, nonynyloxy, and decynyloxy.

“aryl” means a cyclic, aromatic substituent consisting of hydrogen and
5 carbon, for example, phenyl, naphthyl, fluorenyl, and biphenyl.

“cycloalkenyl” means a monocyclic or polycyclic, unsaturated (at least one carbon-carbon double bond) substituent consisting of carbon and hydrogen, for example, cyclobutenyl, cyclopentenyl, cyclohexenyl, cycloheptenyl, cyclooctenyl, cyclodecenyl, norbornenyl, bicyclo [2.2.2] octenyl,
10 tetrahydronaphthyl, hexahydronaphthyl, and octahydronaphthyl.

“cycloalkenyloxy” means a cycloalkenyl further consisting of a carbon-oxygen single bond, for example, cyclobutenyloxy, cyclopentenyl, cyclohexenyloxy, cycloheptenyloxy, cyclooctenyloxy, cyclodecenyloxy, norbornenyloxy, and bicyclo [2.2.2] octenyloxy.

“cycloalkyl” means a monocyclic or polycyclic, saturated substituent consisting of carbon and hydrogen, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl, cyclooctyl, cyclodecyl, norbornyl, bicyclo [2.2.2] octyl, and decahydronaphthyl.
15

“cycloalkoxy” means a cycloalkyl further consisting of a carbon-oxygen
20 single bond, for example, cyclopropyloxy, cyclobutyloxy, cyclopentyloxy, cyclohexyloxy, cycloheptyloxy, cyclooctyloxy, cyclodecyloxy, norbornyloxy, and bicyclo [2.2.2] octyloxy.

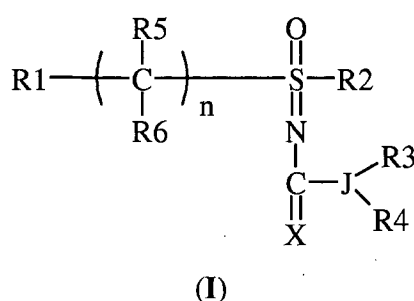
“halo” means fluoro, chloro, bromo, and iodo.

“haloalkyl” means an alkyl further consisting of, from one to the maximum possible number of, identical or different, halos, for example, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, 1-fluoromethyl, 2-fluoroethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, chloromethyl, trichloromethyl, and 1,1,2,2-tetrafluoroethyl.

5 “heterocyclyl” means a cyclic substituent that may be fully saturated, partially unsaturated, or fully unsaturated, where the cyclic structure contains at least one carbon and at least one heteroatom, where said heteroatom is nitrogen, sulfur, or oxygen, for example, benzofuranyl, benzoisothiazolyl, benzoisoxazolyl, benzoxazolyl, benzothienyl, benzothiazolyl cinnoliny, furanyl, indazolyl, indolyl,
10 imidazolyl, isoindolyl, isoquinoliny, isothiazolyl, isoxazolyl, oxiranyl, 1,3,4-oxadiazolyl, oxazoliny, oxazolyl, phthalazinyl, pyrazinyl, pyrazoliny, pyrazolyl, pyridazinyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrrolyl, quinazoliny, quinoliny, quinoxaliny, 1,2,3,4-tetrazolyl, thiazoliny, thiazolyl, thienyl, 1,2,3-triazinyl, 1,2,4-triazinyl, 1,3,5-triazinyl, 1,2,3-triazolyl, and 1,2,4-triazolyl.

15 Detailed Description of the Invention

The compounds of this invention have the following generic formula (I)



wherein:

(a) R1 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy,
20 C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio,

- aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl;
- (b) R₂ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₂ and R₅ may also form a 4, 5, or 6 membered ring;
- (c) R₃ is F, Cl, Br, I, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ aryl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H, F, Cl, Br, I) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆

haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy) C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₃ and R₄ may also form a 4, 5, or 6 membered ring;

(d) R₄ is F, Cl, Br, I, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ aryl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H, F, Cl, Br, I) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy) C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₃ and R₄ may also form a 4, 5, or 6 membered ring;

(e) R₅ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl,

C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n1=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n1=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₃-C₈ cycloalkyl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₂ and R₅ may also form a 4, 5, or 6 membered ring, and wherein R₅ and R₆ may also form a 3, 4, 5, or 6 membered ring;

(f) R₆ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n1=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n1=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₃-C₈ cycloalkyl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₂ and R₅ may also form a 4, 5, or 6 membered ring, and wherein R₅ and R₆ may also form a 3, 4, 5, or 6 membered ring;

(g) n is 0 to 4;

(h) X is NR₈, O, or S;

(i) J is N or CR₇;

(j) R₇ is H, F, Cl, Br, I, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈

- cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H, F, Cl, Br, I) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl;
- (k) R₈ is H, OH, OC(=O)C₁-C₆ alkyl, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy), C₁-C₆ hydroxyalkyl, and heterocyclyl;
- (l) R₉ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆

alkyl (where $n1=0-2$), $S(=O)_{n1}C_1-C_6$ haloalkyl (where $n1=0-2$), $OSO_2C_1-C_6$ haloalkyl, $C(=O)OC_1-C_6$ alkyl, $C(=O)C_1-C_6$ alkyl, $C(=O)C_1-C_6$ haloalkyl, aryl, C_1-C_6 hydroxyalkyl, and heterocyclyl, and wherein R9 and R10 may also form a 4, 5, or 6 membered ring; and

- 5 (m) R10 is C_2-C_8 alkenyl, C_2-C_8 alkenyloxy, C_2-C_8 alkenylthio, C_1-C_8 alkoxy, C_1-C_8 alkyl, C_1-C_8 alkylthio, C_2-C_8 alkynyl, C_2-C_8 alkynyloxy, C_2-C_8 alkynylthio, aryl, C_3-C_8 cycloalkenyl, C_3-C_8 cycloalkenyloxy, C_3-C_8 cycloalkenylthio, C_3-C_8 cycloalkyl, C_3-C_8 cycloalkoxy, C_3-C_8 cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following
- 10 substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , C_1-C_6 alkyl, C_2-C_6 alkenyl, C_2-C_6 alkynyl, C_1-C_6 alkoxy, C_1-C_6 haloalkyl, C_1-C_6 haloalkoxy, C_1-C_6 haloalkylthio, $S(=O)_{n1}C_1-C_6$ alkyl (where $n1=0-2$), $S(=O)_{n1}C_1-C_6$ haloalkyl (where $n1=0-2$), $OSO_2C_1-C_6$ haloalkyl, $C(=O)OC_1-C_6$ alkyl, $C(=O)C_1-C_6$ alkyl, $C(=O)C_1-C_6$ haloalkyl, aryl, C_1-C_6 hydroxyalkyl, and heterocyclyl, and wherein R9 and R10 may also form a
- 15 4, 5, or 6 membered ring.

In another embodiment of this invention, R1 is aryl or heterocyclyl, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents F, Cl, Br, I, C_1-C_6 alkyl or C_1-C_6 haloalkyl.

- In another embodiment of this invention, R1 is an heterocyclyl, wherein
- 20 said heterocyclyl may be independently substituted with one or more of the following substituents F, Cl, Br, I, C_1-C_6 alkyl or C_1-C_6 haloalkyl.

In another embodiment of this invention, R1 is pyridyl, wherein said pyridyl may be independently substituted with one or more of the following substituents Cl, CH_3 , or CF_3 .

In another embodiment of this invention, R1 is pyridyl, wherein said pyridyl is substituted with one of the following substituents Cl, CH₃, or CF₃ are attached to the carbon atom the sixth position.

In another embodiment of this invention, R2 is a C₁-C₈ alkyl.

5 In another embodiment of this invention, R2 is a CH₃.

In another embodiment of this invention, R2 and R5 form a six-membered ring composed of carbon, hydrogen, and the sulfur atom.

In another embodiment of this invention, R3 is H, F, or C₁-C₈ alkyl.

10 In another embodiment of this invention, R3 and R4 form a five or six-membered ring composed of carbon, hydrogen, and a nitrogen atom.

In another embodiment of this invention, R3 and R4 form a six-membered ring composed of carbon, hydrogen, a nitrogen atom, and an oxygen atom.

15 In another embodiment, R4 is H, F, aryl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, heterocyclyl, C₁-C₈ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl, C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, C(=O)C₁-C₆ aryl, wherein each of which may be independently substituted (except for H and F) with one or more of the following substituents, Cl, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C(=O)C₁-C₆ alkyl, NR₉R₁₀, and aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy).

20 In another embodiment, R4 is H or C₁-C₈ alkyl (wherein said alkyl may be independently substituted with one or more of the following substituents, Cl, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ alkoxy, C(=O)C₁-C₆ alkyl, and aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy).

In another embodiment of this invention, R5 is H, C₁-C₈ alkyl, C₂-C₈ alkenyl, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, or C₃-C₈ cycloalkyl.

In another embodiment of this invention, R5 is H or C₁-C₈ alkyl.

5 In another embodiment of this invention R6 is H.

In another embodiment of this invention n is 0 or 1.

In another embodiment of this invention, X is NR₈ or S.

In another embodiment of this invention J is N.

10 In another embodiment of this invention, R7 is H, F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkyl.

In another embodiment of this invention, R7 is H.

15 In another embodiment of this invention, R8 is H, OH, OC(=O)C₁-C₆ alkyl, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkoxy, C₂-C₈ alkenyloxy, wherein each of which may be independently substituted (except for H and OH) with one or more of the following substituents, aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, C₁-C₈ alkoxy), C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl, F, Cl, Br, I, C₁-C₆ alkoxy,

In another embodiment of the invention:

20 (a) R1 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-

C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where
 5 n=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl;

(b) R₂ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈
 10 cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where
 15 n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl, and wherein R₂ and R₅ may also form a 4, 5, or 6, membered ring;

(c) R₃ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈
 20 cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl,

NR9R10 and heterocyclyl, and wherein R3 and R4 may also form a 4, 5, or 6, membered ring;

- (d) R4 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, 5 aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR8, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, 10 C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n1=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n1=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR9R10 and heterocyclyl, and wherein R3 and R4 may also form a 4, 5, or 6, membered ring;
- (e) R5 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, 15 aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR8, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, 20 C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n1=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n1=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, 25 NR9R10 and heterocyclyl, and wherein R2 and R5 may also form a 4, 5, or 6, membered ring, and wherein R5 and R6 may also form a 3, 4, 5, or 6, membered ring;

- (f) R6 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n1=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n1=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl, and wherein R₅ and R₆ may also form a 3, 4, 5, or 6, membered ring;
- (g) n is 0 to 4;
- (h) X is NR₈, O or S;
- (i) J is N or CR₇;
- (j) R₇ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n1=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n1=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl;

(k) R8 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein
 5 each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl,
 10 C₁-C₆ hydroxyalkyl, and heterocyclyl;

(l) R9 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein
 15 each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl,
 20 C₁-C₆ hydroxyalkyl, and heterocyclyl, and wherein R9 and R10 may also form a 4, 5, or 6 membered ring; and

(m) R10 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein
 25 each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-

In another embodiment of the invention, R3 is a C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted
5 (except for H) with one or more of the following substituents F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl, also
10 R3 and R4 may form a 4, 5, or 6 membered ring.

In another embodiment of the invention, R4 is a C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted
15 (except for H) with one or more of the following substituents F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl, also
20 R3 and R4 may form a 4, 5, or 6 membered ring.

In another embodiment of the invention, X is S.

In another embodiment of the invention, R5 and R6 are independently selected from H, methyl, ethyl, F, Cl, and Br.

In another embodiment of the invention, n is 1, and R5 is CH₃ and R6 is H.

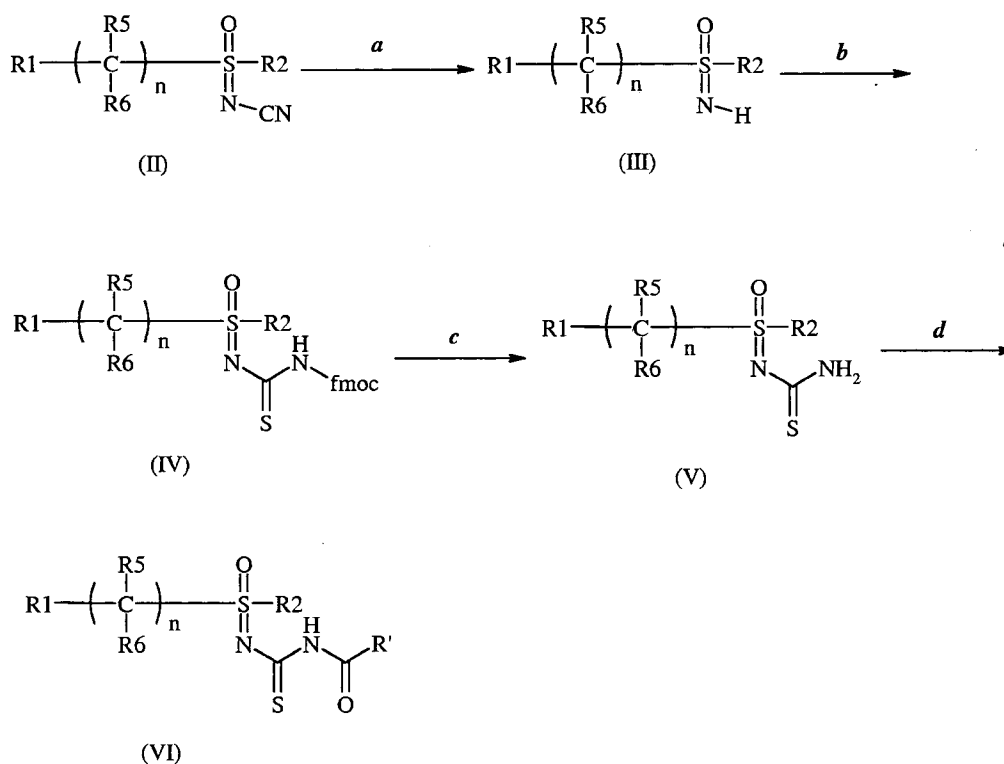
While these embodiments have been expressed, other embodiments and combinations of these expressed embodiments and other embodiments, are possible.

Throughout this document, all temperatures are given in degrees Celsius,
5 and all percentages are weight percentages unless otherwise stated.

The compounds of this invention can be made in a variety of ways. One general way is to start with a molecule formed as in WO 2007/095229 A2 entitled "Insecticidal N-substituted (6-haloalkylpyridin-3-yl) alkyl sulfoximines" published 23 AUG 2007 and to follow the general methods illustrated in Schemes
10 A-F below.

The compounds of formula (I), wherein R1, R2, R4, R5, R6, and n are as previously defined and wherein X=S, J=N, and R3 is H, can be prepared by the methods illustrated in Scheme A.

Scheme A



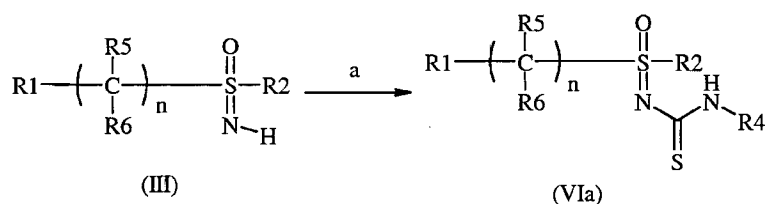
In step *a* of Scheme A, compounds of formula (II) can be converted to compounds of formula (III) as known in the art (for example see *Org. Lett.* **2007**, 9, 3809) when treated with trifluoroacetic anhydride in a polar aprotic solvent such as dichloromethane (CH_2Cl_2) followed by a base such as potassium carbonate in a polar protic solvent such as methanol. The reactions are typically conducted at temperatures ranging from $-20\text{ }^{\circ}C$ to $50\text{ }^{\circ}C$ and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods. Cyano sulfoximine (II) (also known as “sulfoxaflo”) can be prepared by methods known in the art (for example see WO 2007095229 A2). In step *b* of Scheme A, compounds of formula (III) are allowed to react with 9-fluorenylmethoxycarbonyl (Fmoc) isothiocyanate in a mixture of polar aprotic solvents such as tetrahydrofuran (THF) and *N,N*-dimethylformamide (DMF) to

give compounds of formula (IV) as known in the art (for example see *Heterocycles* **1998**, 49, 181). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from 0 °C to 100 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods. In step *c* of Scheme A, compounds of formula (IV) can be treated with a base such as piperidine, in a polar aprotic solvent such as DMF to give compounds of formula (V). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from -20 °C to 50 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods. In step *d* of Scheme A, compounds of formula (V) can be allowed to react with an acid chloride such as acetyl chloride in an organic solvent such as acetone and in the presence of a base such as triethylamine to give compounds of formula (VI) as known in the art (for example see *Inorg. Chem. Commun.* **2000**, 3, 630). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from 0 °C to 100 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods.

The compounds of formula (I), wherein R1, R2, R4, R5, R6, and n are as previously defined and wherein X=S, J=N, and R3 is H, can be prepared by the methods illustrated in Scheme B.

20

Scheme B



In step *a* of Scheme B, compounds of formula (III) are treated with an isothiocyanate such as ethyl isothiocyanate in a mixture of polar aprotic solvents

38

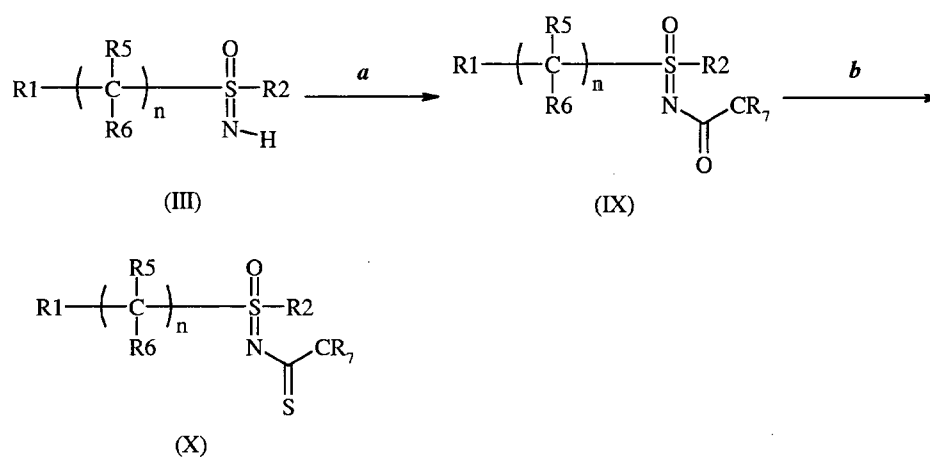


15

temperatures ranging from 0 °C to 100 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods.

The compounds of formula (I), wherein R1, R2, R5, R6, R7 and n are as previously defined and wherein X=O or S, can be prepared by the methods
5 illustrated in Scheme D.

Scheme D

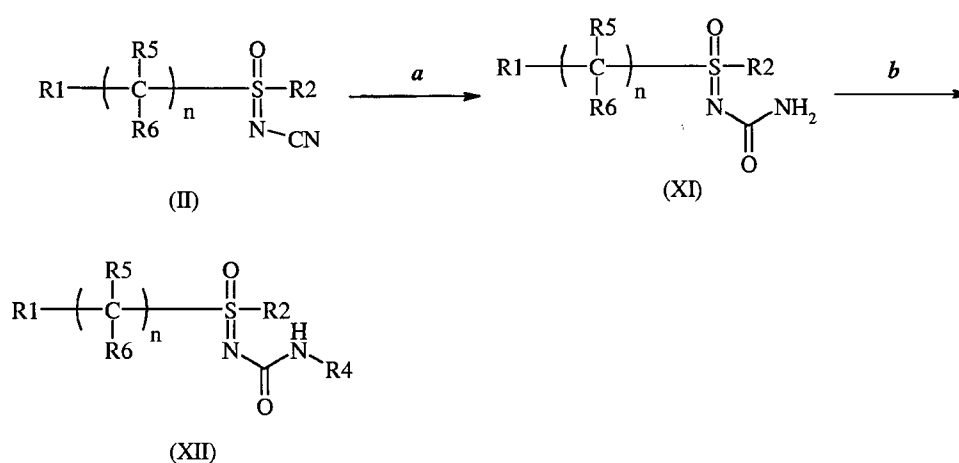


In step *a* of Scheme D, compounds of formula (III) can be treated with an anhydride such as acetic anhydride in the presence of an organic solvent such as pyridine to give compounds of formula (IX) as known in the art (for example see
10 *Heterocycles* **1998**, 49, 181). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from 0 °C to 100 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods. In step *b* of Scheme D, compounds of formula (IX) can be thionated by treatment
15 with reagents such as Lawesson's reagent in organic solvents such as 1,4-dioxane to give compounds of formula (X). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from 0 °C to 100 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods.

40

The compounds of formula (I), wherein R1, R2, R4, R5, R6, and n are as previously defined and wherein X=O, J=N, and R3 is H, can be prepared by the methods illustrated in Scheme E.

Scheme E



5

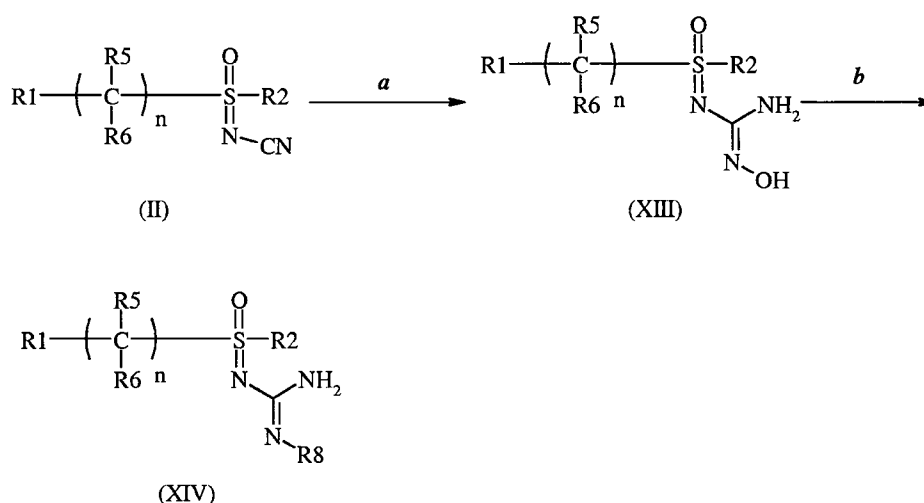
In step *a* of Scheme E, compounds of formula (II) can be hydrolyzed in the presence of a strong acid such as concentrated sulfuric acid in an organic solvent such as acetonitrile to give compounds of formula (XI). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from 0 °C to 100 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods. In step *b* of Scheme E, compounds of formula (XI) can be treated with an acid chloride such as acetyl chloride in a nonpolar organic solvent such as anhydrous benzene to give compounds of formula (XII). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from 0 °C to 150 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods.

10

15

The compounds of formula (I), wherein R1, R2, R5, R6, R8, and n are as previously defined and wherein X=NR8 and J=N, can be prepared by the methods illustrated in Scheme F.

Scheme F



5

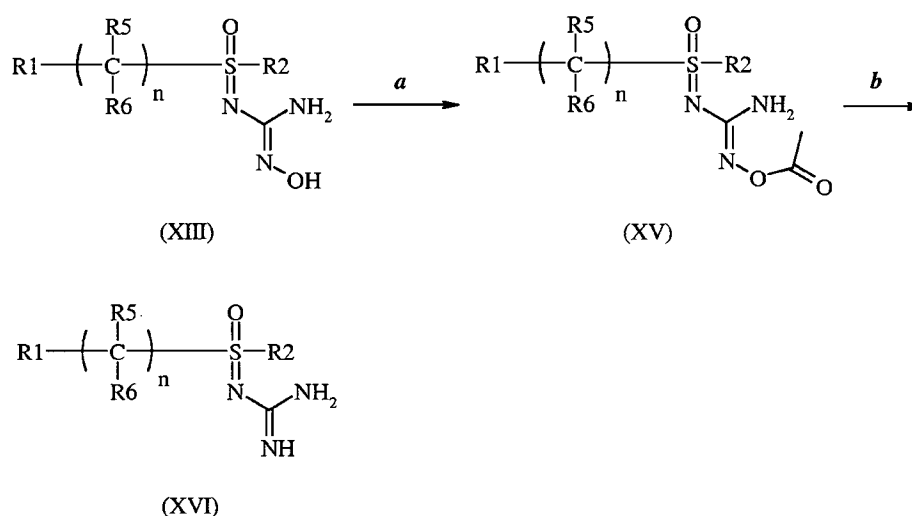
In step *a* of Scheme F, compounds of formula (II) can be allowed to react with a nucleophile such as hydroxylamine hydrochloride in the presence of a base such as sodium carbonate in a mixed polar protic solvent system such as ethanol and water to give compounds of formula (XIII) as known in the art (for example see *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1* **2001**, 1321). The reactions are typically conducted at temperatures ranging from 0 °C to 150 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods. Similarly, compounds of formula (IX) in Scheme D can be converted to the corresponding oximes under these conditions. In step *b* of Scheme F, compounds of formula (XIII) can be allowed to react with bases such as sodium hydride or potassium carbonate in polar aprotic solvents such as THF or acetonitrile in the presence of an alkyl halide such as methyl iodide to give compounds of formula (XIV). The reactions are typically conducted at

15

temperatures ranging from 0 °C to 150 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods.

The compounds of formula (I), wherein R1, R2, R5, R6, and n are as previously defined and wherein X=NH and J=N, can be prepared by the methods
5 illustrated in Scheme G.

Scheme G



In step *a* of Scheme G, compounds of formula (XIII) can be allowed to react with an anhydride such as acetic anhydride in the presence of an acid such as glacial acetic acid to give compounds of formula (XV). The reactions are typically
10 conducted at temperatures ranging from 0 °C to 150 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods. In step *b* of Scheme G, compounds of formula (XV) can be hydrogenated in the presence of a catalyst such as palladium on carbon in a polar
15 protic solvent such as glacial acetic acid and an anhydride such as acetic anhydride to give compounds of formula (XVI) as known in the art (for example see *Synth. Commun.* **2007**, 37, 4157). The reactions are typically conducted at

temperatures ranging from 0 °C to 150 °C and are generally complete in one to 18 hours. The compounds can be recovered and purified by conventional methods.

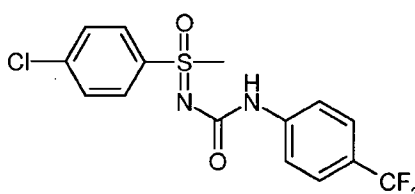
Examples

The examples are for illustration purposes and are not to be construed as
5 limiting the invention disclosed in this document to only the embodiments disclosed in these examples.

List of Abbreviations

tetrahydrofuran	THF
<i>N,N</i> -dimethylformamide	DMF
10 electrospray ionization mass spectrometry	ESIMS
relative humidity	RH

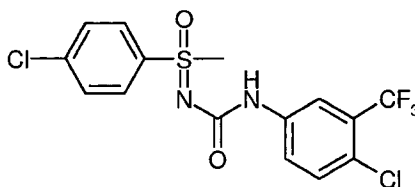
Example 1: Preparation of *N*-[(4-chlorophenyl)(methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N'*-[4-(trifluoromethyl)phenyl] urea (1).



15 1-Chloro-4-(methylsulfonimidoyl)benzene (0.37 g, 1.9 mmol) was dissolved in CH₂Cl₂ (16 mL) at room temperature. To this solution was added 60% sodium hydride in mineral oil (68 mg, 1.7 mmol) which caused bubbling. When the bubbling subsided, 4-trifluoromethyl phenyl isocyanate (0.42 g, 1.9 mmol) was added, and the mixture was allowed to stir for 2 h at room temperature. The

reaction was then quenched with brine (10 mL) and the mixture was extracted with ethyl acetate (3 x 10 mL). The organic extracts were combined, dried (MgSO₄), filtered, and concentrated *in vacuo* to furnish *N*-[(4-chlorophenyl)(methyl)oxido-λ⁴-sulfanylidene]-*N'*-[4-(trifluoromethyl)phenyl]urea (1) as a white solid (0.466 g, 76%): mp 131–134 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 7.95 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.59 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.52 (s, 4H), 3.39 (s, 3H); ESIMS *m/z* 376 ([M]⁺).

Example 2: Preparation of *N*-[(4-chlorophenyl)(methyl)oxido-λ⁴-sulfanylidene]-*N'*-[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl]urea (2).

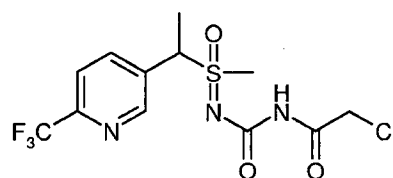


10

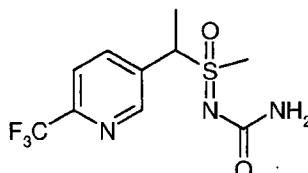
N-[(4-Chlorophenyl)(methyl)oxido-λ⁴-sulfanylidene]-*N'*-[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl]urea (2) was synthesized from 1-chloro-4-(methylsulfonimidoyl)benzene according to the procedure described in Example 1. The compound was isolated as a colorless oil (0.319 g, 54%): ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 7.95 (d, *J* = 9.0 Hz, 2H), 7.77 (br s, 1H), 7.59 (d, *J* = 8.7 Hz, 2H), 7.54 (br s, 1H), 7.36 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 3.36 (s, 3H); ESIMS *m/z* 410 ([M]⁺).

15

Example 3: Preparation of *N*-(chloroacetyl)-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)urea (3).

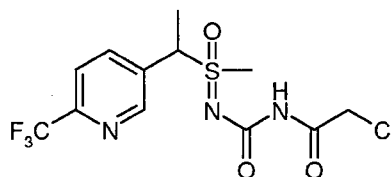


Step A. Preparation of *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)urea.



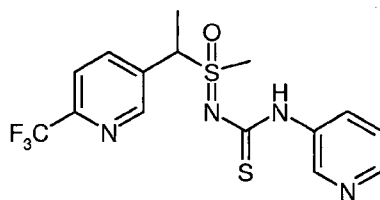
To a vigorously stirred solution of methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylideneurea (100 g, 0.36 mol) in acetonitrile (500 mL) was added dropwise concentrated sulfuric acid (25 mL) at a rate to maintain the temperature below 40 °C. (A little external cooling was required initially.) Upon completion of the addition, the reaction mixture (now cloudy, with some separated oil) was stirred for another hour at ambient temperature until starting material was consumed. The mixture was then cooled to 5 °C, and 50% NaOH was added dropwise (exothermic) until the solution was neutral by pH paper. The resulting solid was filtered, and the filtrate was transferred to a separatory funnel. The layers were separated, and the organic layer was washed with brine, dried (MgSO₄), filtered, and concentrated *in vacuo* to afford *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)urea as a white solid (99.4 g, 93%); ESIMS *m/z* 296 ([M+H]⁺).

Step B. Preparation of *N*-(chloroacetyl)-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)urea (3).

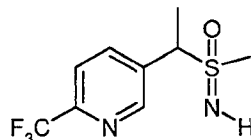


A suspension of *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)urea (2.0 g, 6.78 mmol) and chloroacetyl chloride (0.92 g, 8.14 mmol) in anhydrous benzene (50 mL) was heated to reflux under N₂ for 2 h. The reaction mixture was cooled externally with an ice-water bath and hexane (100 mL) was added to precipitate the product. The reaction mixture was stirred for an additional 15 min, and the solid was collected via suction filtration and rinsed with ether to furnish *N*-(chloroacetyl)-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)urea (**3**) as a white solid (1.37 g, 54%); mp 178–179 °C; ¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ (1:1 mixture of two diastereomers) 10.4 (s, 1H), 8.9 (m, 1H), 8.3 (m, 1H), 8.0 (m, 1H), 5.1 (q, 1H), 4.5 (s, 2H), 3.4 (s, 3H), 1.8 (d, 3H); ESIMS *m/z* 372 ([M+H]⁺).

Example 4: Preparation of *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)-*N'*-pyridin-3-ylthiourea (**4**).



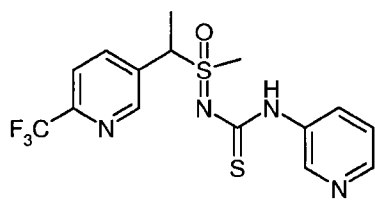
15 Step A. Preparation of 5-[1-(methylsulfonimidoyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)pyridine.



To a stirred solution of methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylideneurea (5 g, 18 mmol) in CH₂Cl₂ (300 mL) at 0 °C was added

trifluoroacetic anhydride (7.5 mL, 54 mmol). The mixture was allowed to react at 25 °C until the starting material was fully consumed. The reaction mixture was concentrated *in vacuo*, dissolved in methanol (125 mL) and treated with potassium carbonate (12.5 g, 90 mmol). The mixture was allowed to stir at 25 °C until the starting material was consumed. The crude reaction mixture was filtered, concentrated and purified by chromatography (acetone–hexanes) to furnish 5-[1-(methylsulfonimidoyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)pyridine as a white solid (3.5 g, 77%): ESIMS *m/z* 253 ([M+H]⁺).

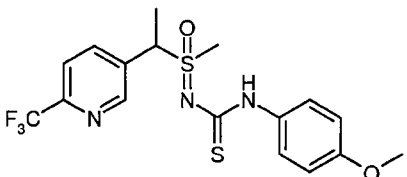
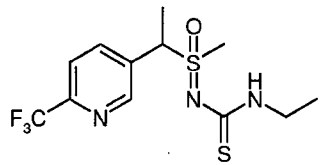
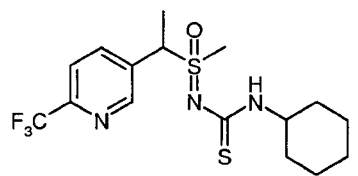
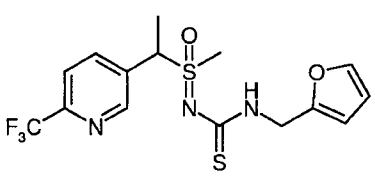
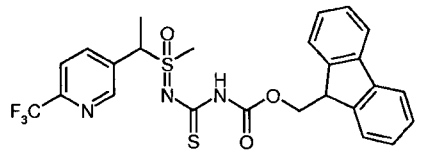
Step B. Preparation of *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)-*N'*-pyridin-3-ylthiourea (4).



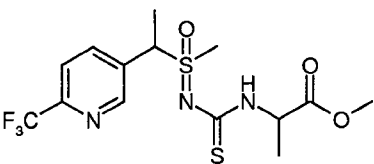
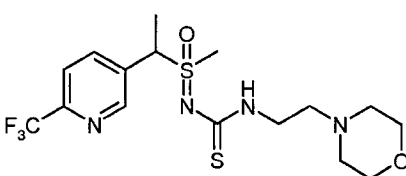
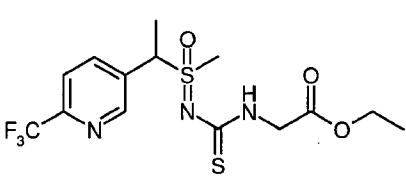
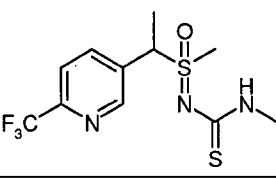
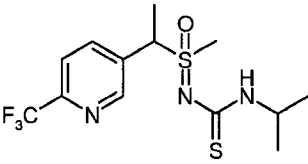
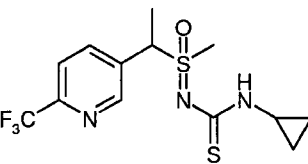
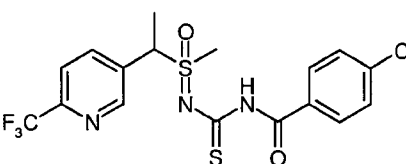
In a 50 mL round bottom flask charged with a magnetic stirbar, 5-[1-(methylsulfonimidoyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)pyridine (0.200 g, 0.793 mmol) was dissolved in THF (4.17 mL) and DMF (0.83 mL) at 25 °C. Next, 3-isothiocyanatopyridine (0.132 mL, 1.11 mmol) was added to the reaction flask. Following addition, the reaction was warmed to 80 °C for 12 h. Upon completion of reaction, the mixture was diluted with ethyl acetate and brine. The layers were separated, and the aqueous layer was extracted with ethyl acetate. The organic extracts were combined and washed with brine, dried (Na₂SO₄), filtered, and concentrated *in vacuo*. The crude material was purified using reverse-phase HPLC eluting with acetonitrile–water mixtures to furnish *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)-*N'*-pyridin-3-ylthiourea (4) as a white solid (0.191 g, 62%): mp 92–94 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ

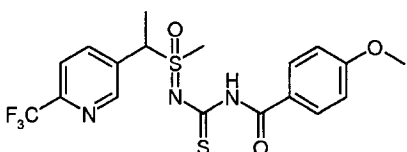
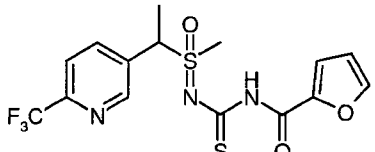
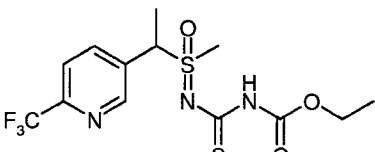
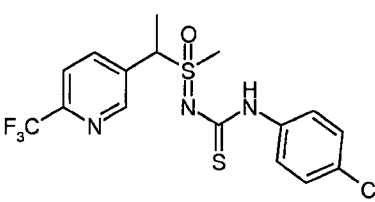
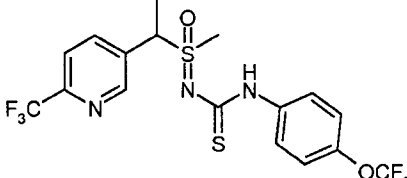
(mixture of diastereomers) 8.82 & 8.76 (s, 1H), 8.5 (m, 2H), 8.07 (m, 2H), 7.74 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 5.89 & 5.61 (m, 1H), 3.55 & 3.35 (s, 3H), 1.94 & 1.85 (m, 3H); ESIMS m/z 389 ($[M+H]^+$).

Table 1: Insecticidal Compounds

Cmpd #	Structure	Route	Characterization
5		A	white solid; mp 167–169 °C; ESIMS m/z 418 ($[M+H]^+$)
6		A	light yellow foam; ESIMS m/z 340 ($[M+H]^+$)
7		A	white solid; mp 170–172 °C; ESIMS m/z 394 ($[M+H]^+$)
8		A	light brown oil; ESIMS m/z 392 ($[M+H]^+$)
9		A	yellow solid; mp 105–107 °C; ESIMS m/z 534 ($[M+H]^+$)

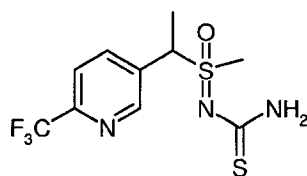
49

10		A	light brown semi-solid; ESIMS m/z 398 ([M+H] ⁺)
11		A	golden yellow oil; ESIMS m/z 425 ([M+H] ⁺)
12		A	orange semi-solid; ESIMS m/z 398 ([M+H] ⁺)
13		A	white semi-solid; ESIMS m/z 326 ([M+H] ⁺)
14		A	white solid; mp 153–155 °C; ESIMS m/z 354 ([M+H] ⁺)
15		A	off-white solid; mp 154– 156 °C; ESIMS m/z 352 ([M+H] ⁺)
16		A	light yellow semi-solid; ESIMS m/z 450 ([M+H] ⁺)

17		A	light yellow semi-solid; ESIMS m/z 446 ([M+H] ⁺)
18		A	light yellow semi-solid; ESIMS m/z 406 ([M+H] ⁺)
19		A	white solid; ESIMS m/z 384 [M+H] ⁺)
20		A	white solid; mp 181–183 °C; ESIMS m/z 422 ([M+H] ⁺)
21		A	off-white solid; mp 149– 151 °C; ESIMS m/z 472 ([M+H] ⁺)

A = Route used for Example 4

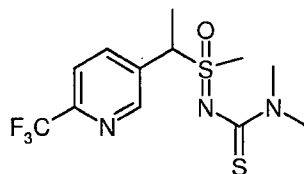
Example 5: Preparation of N-(methyl (oxido) {1-[6-(trifluoromethyl) pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)thiourea (22).



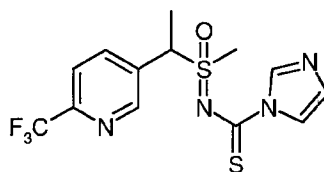
51

Compound **9** (0.100 g, 0.187 mmol) was dissolved with stirring in 20% piperidine/DMF (2 mL) at 25 °C. Upon completion of the reaction, the mixture was concentrated *in vacuo*. The crude material was purified using reverse-phase HPLC eluting with acetonitrile–water mixtures to furnish *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene) thiourea (**22**) as an off-white solid (0.043 g, 74%): mp 145–147 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (mixture of diastereomers) 8.86 (s, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.76 (m, 1H), 6.09 & 5.94 (m, 1H), 3.52 & 3.24 (s, 3H), 1.93 & 1.83 (d, $J = 7.3\text{Hz}$, 3H); ESIMS m/z 312 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

10 Example 6: Preparation of *N,N*-dimethyl-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)thiourea (**23**).



Step A. Preparation of *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)-1*H*-imidazole-1-carbothioamide.

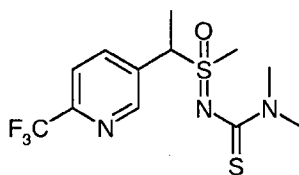


15

5-[1-(Methylsulfonimidoyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)pyridine (2.1 g, 8.3 mmol) was dissolved in acetonitrile (17 mL) at room temperature. To this mixture was added thiocarbonyl diimidazole (3 g, 17 mmol) in a single portion. The mixture was heated to 80 °C for 12 h. The mixture was then filtered to remove all solids,

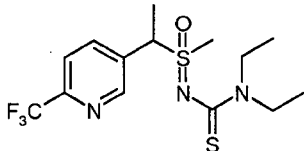
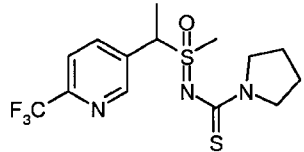
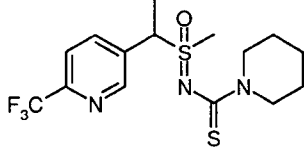
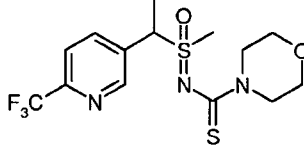
and the filtrate was concentrated *in vacuo*. The residue was redissolved in CH₂Cl₂ and washed with brine. The organic extracts were combined, dried (Na₂SO₄), filtered, and concentrated *in vacuo* to furnish *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)-1*H*-imidazole-1-carbothioamide as a brown oil (2.78 g, 93%) which was used without further purification: ESIMS *m/z* 363 ([M+H]⁺).

Step B. Preparation of *N,N*-dimethyl-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)thiourea (23).



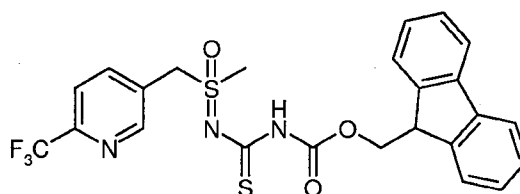
N-(Methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)-1*H*-imidazole-1-carbothioamide (0.088 g, 0.243 mmol) was dissolved in acetonitrile (0.486 mL) with stirring at room temperature. The mixture was then cooled in an ice bath. To this cooled solution was added 40% dimethylamine in water (0.031 mL, 0.243 mmol). Upon completion of reaction, any solids were filtered away from the mixture, and the filtrate was concentrated *in vacuo*. The remaining crude material was redissolved in ethyl acetate and washed with 1 N HCl and brine. The organic layer was then dried (Na₂SO₄), filtered, and concentrated *in vacuo* to furnish *N,N*-dimethyl-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)thiourea (23) as a yellow oil (0.044 g, 54%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ (mixture of diastereomers) 8.83 (s, 1H), 8.08 (m, 1H), 7.74 (m, 1H), 5.97 & 5.73 (m, 1H), 3.52 & 3.41 (s, 3H), 3.34 & 3.25 (s, 3H), 3.26 & 3.03 (s, 3H), 1.92 & 1.81 (d, *J* = 7.3 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 340 ([M+H]⁺).

Table 2: Insecticidal Compounds

Cmpd #	Structure	Route	Characterization
24		B	brown oil; ESIMS m/z 368 ([M+H] ⁺)
25		B	yellow oil; ESIMS m/z 366 ([M+H] ⁺)
26		B	yellow oil; ESIMS m/z 379 ([M+H] ⁺)
27		B	yellow oil; ESIMS m/z 381 ([M+H] ⁺)

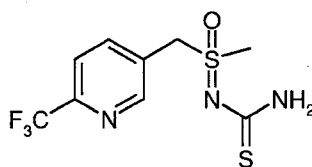
B = route used in Example 6

Example 7: Preparation of 9H-fluoren-9-ylmethyl [(methyl(oxido){[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]methyl}-λ⁴-sulfanylidene)amino] carbonothioylcarbamate (28).



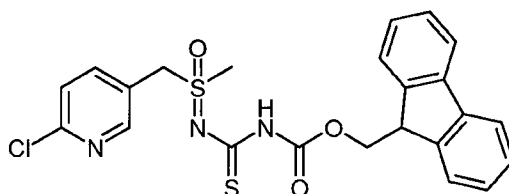
9H-Fluoren-9-ylmethyl [(methyl(oxido){[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]methyl}- λ^4 -sulfanylidene)amino]carbonothioylcarbamate (**28**) was synthesized from the corresponding sulfoximide according to the procedure described in Example 4. The compound was isolated as light yellow foam (14.6 g, 100%): mp
 5 92–97 °C; ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 11.18 (s, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.29 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.83 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 7.43 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 7.34 (dt, J = 1.3, 6.3 Hz, 2H), 5.21 (d, J = 2.3 Hz, 2H), 4.33–4.24 (m, 3H), 3.66 (s, 3H); ESIMS m/z 520 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Example 8: Preparation of N-(methyl(oxido){[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]methyl}- λ^4 -sulfanylidene)thiourea (**29**).
 10



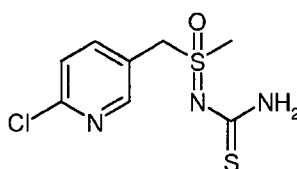
N-(Methyl(oxido){[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]methyl}- λ^4 -sulfanylidene)thiourea (**29**) was synthesized from Compound **28** according to the procedure described in Example 5. The compound was isolated as a white solid (8.18 g,
 15 92%): mp 107–109 °C; ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.82 (s, 1H), 8.11 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.36 (br s, 1H), 6.19 (br s, 1H), 5.52 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 5.06 (d, J = 13.5 Hz, 1H), 3.39 (s, 3H); ESIMS m/z 340 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Example 9: Preparation of 9H-fluoren-9-ylmethyl [[[6-chloropyridin-3-yl)methyl](methyl) oxido- λ^4 -sulfanylidene]amino}carbonothioylcarbamate (30).



5 9H-Fluoren-9-ylmethyl{[[[(6-chloropyridin-3-yl)methyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]amino}carbonothioylcarbamate (30) was synthesized from the corresponding sulfoximide according to the procedure described in Example 4. The compound was isolated as a light yellow foam (14.8 g, 92%): mp 98–101 °C; ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 11.15 (s, 1H), 8.56 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.05(dd, J = 2.3, 8.2 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.84 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 7.34 (dt, J = 1.0, 7.6 Hz, 2H), 5.09 (s, 2H),
10 4.32-4.26 (m, 3H), 3.61 (s, 3H); ESIMS m/z 486 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

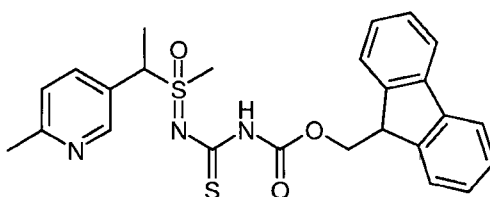
Example 10: Preparation of N-[[[(6-chloropyridin-3-yl)methyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene] thiourea (31).



15 N-[[[(6-Chloropyridin-3-yl)methyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]thiourea (31) was synthesized from Compound 30 according to the procedure described in Example 5. The compound was isolated as a light-orange solid (4.96 g, 62%): mp 155–158 °C; ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.51 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.12 (br

s, 1H), 7.79 (m, 2H), 7.61 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.36 (s, 3H); ESIMS m/z 264 ($[M+H]^+$).

5 Example 11: Preparation of 9H-fluoren-9-ylmethyl ({methyl[1-(6-methylpyridin-3-yl)ethyl] oxido- λ^4 -sulfanylidene}amino)carbonothioylcarbamate (32).



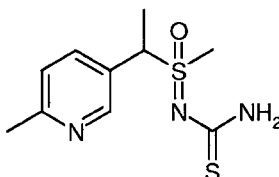
9H-Fluoren-9-ylmethyl({methyl[1-(6-methylpyridin-3-yl)ethyl]oxido- λ^4 -sulfanylidene}amino)carbonothioylcarbamate (32) was synthesized from the corresponding sulfoximide according to the procedure described in Example 4.

10 The compound was isolated as a tan foam (2.61 g, 54%): mp 101–106 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.59 (dd, $J = 2.3, 5.5$ Hz, 1H), 8.30 (d, $J = 14.1$ Hz, 1H), 8.06 (dd, $J = 2.3, 8.2$ Hz, 0.5H), 7.85 (dd, $J = 2.5, 8.1$ Hz, 0.5H), 7.78 (d, $J = 7.3$ Hz, 2H), 7.59 (d, $J = 7.6$ Hz, 2H), 7.42 (t, $J = 7.6$ Hz, 2H), 7.33 (t, $J = 7.6$ Hz, 2H), 7.23 (d, $J = 8.3$ Hz, 0.5H), 7.20 (d, $J = 8.1$ Hz, 0.5H), 5.16 (q, $J = 7.1$ Hz, 0.5H), 4.71 (q, $J = 7.1$ Hz, 0.5H), 4.51–4.43 (m, 2H), 4.26–4.23 (m, 1H), 3.34 (s, 3H), 2.59 (s, 1.5H), 2.56 (s, 1.5H), 1.93 (d, $J = 7.1$ Hz, 1.5H), 1.87 (d, $J = 7.1$ Hz, 1.5H); ESIMS m/z 480 ($[M+H]^+$).

15

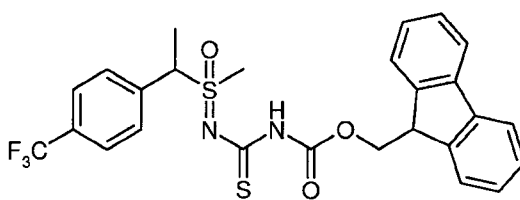
86

Example 12: Preparation of *N*-{methyl[1-(6-methylpyridin-3-yl)ethyl]oxido- λ^4 -sulfanylidene}-thiourea (33).



N-{Methyl[1-(6-methylpyridin-3-yl)ethyl]oxido- λ^4 -sulfanylidene}-thiourea (33) was synthesized from Compound 32 according to the procedure described in Example 5. The compound was isolated as a tan solid (0.78 g, 57%): mp 137–140 °C; ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.57 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 11.4 Hz, 1H), 7.91-7.83 (m, 2H), 7.30 (t, J = 8.0 Hz, 1H), 5.28 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.36 (s, 1.5H), 3.34 (s, 1.5H), 2.48 (s, 1.5 H), 2.48 (s, 1.5H), 1.73 (d, J = 6.3 Hz, 1.5H), 1.72 (d, J = 6.6 Hz, 1.5H); ESIMS m/z 258 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Example 13: Preparation of 9*H*-fluoren-9-ylmethyl [(methyl(oxido){1-[4-(trifluoromethyl) phenyl]-ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)amino]carbonothioylcarbamate (34).

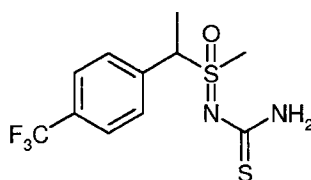


9*H*-Fluoren-9-ylmethyl [(methyl(oxido){1-[4-(trifluoromethyl)phenyl]-ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)amino]carbonothioylcarbamate (34) was synthesized from the corresponding sulfoximide according to the procedure described in Example 4. The compound was isolated as a yellow foam (4.19 g, 99%): mp 86–93 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.29 (br s, 0.5H), 8.24 (br s, 0.5H), 7.80-7.75 (m,

57

3.5H), 7.65 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 7.60-7.58 (m, 2.5H), 7.44-7.38 (m, 2.5H), 7.35-7.29 (m, 2.5H), 5.32 (q, $J = 7.3$ Hz, 0.5H), 4.86 (q, $J = 6.8$ Hz, 0.5H), 4.52-4.44 (m, 2H), 4.26-4.23 (m, 1H), 3.32 (s, 1.5H), 3.32 (s, 1.5H), 1.94 (d, $J = 7.1$ Hz, 1.5H), 1.88 (d, $J = 7.3$ Hz, 1.5H); ESIMS m/z 533 ($[M+H]^+$).

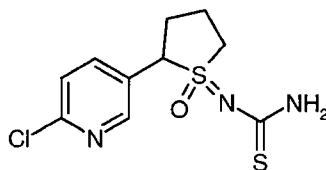
- 5 Example 14: Preparation of N -(methyl(oxido){1-[4-(trifluoromethyl)phenyl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)thiourea (35).



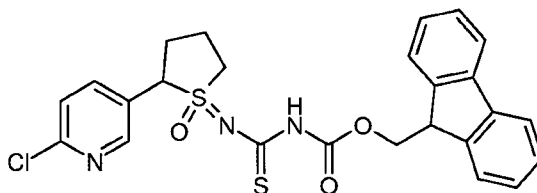
N -(Methyl(oxido){1-[4-(trifluoromethyl)phenyl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)thiourea (35) was synthesized from Compound 34 according to the procedure described in

- 10 Example 5. The compound was isolated as a white solid (1.62 g, 67%): mp 166–168 °C; ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.04 (d, $J = 13.6$ Hz, 1H), 7.90 (dd, $J = 2.3, 19.2$ Hz, 1H), 7.80-7.75 (m, 4H), 5.49-5.44 (m, 1H), 3.37 (s, 1.5H), 3.34 (s, 1.5H), 1.76 (d, $J = 7.3$ Hz, 1.5H), 1.74 (d, $J = 8.1$ Hz, 1.5H); ESIMS m/z 311 ($[M+H]^+$).

- 15 Example 15: Preparation of N -[2-(6-chloropyridin-3-yl)-1-oxidotetrahydro-1H-1 λ^4 -thien-1-ylidene]thiourea (36).

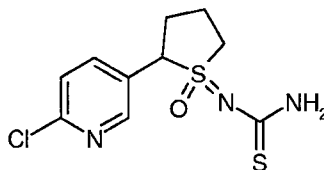


Step A. Preparation of 9H-fluoren-9-ylmethyl[[2-(6-chloropyridin-3-yl)-1-oxidotetrahydro-1H-1 λ^4 -thien-1-ylidene]amino]carbonothioylcarbamate.



9H-Fluoren-9-ylmethyl[[2-(6-chloropyridin-3-yl)-1-oxidotetrahydro-1H-1 λ^4 -thien-1-ylidene]amino]carbonothioylcarbamate was synthesized from the corresponding sulfoximide according to the procedure described in Example 4. The compound was isolated as an off-white solid (4.4 g, 99%): mp 86–95°C; ESIMS m/z 512 ($[M+H]^+$).

Step B. Preparation of N-[2-(6-chloropyridin-3-yl)-1-oxidotetrahydro-1H-1 λ^4 -thien-1-ylidene]thiourea (36)

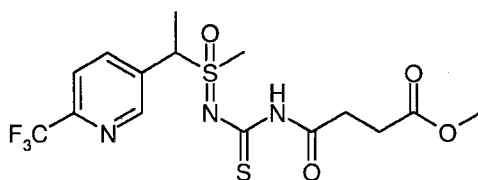


N-[2-(6-Chloropyridin-3-yl)-1-oxidotetrahydro-1H-1 λ^4 -thien-1-ylidene]thiourea (36) was synthesized from 9H-fluoren-9-ylmethyl[[2-(6-chloropyridin-3-yl)-1-oxidotetrahydro-1H-1 λ^4 -thien-1-ylidene]amino]carbonothioylcarbamate according to the procedure described in Example 5. The compound was isolated as an off-white solid (0.51 g, 20%): mp 168–172°C; 1H NMR (300 MHz, acetone- d_6) δ (2:1 mixture of two diastereomers) 8.50 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 8.5, 2.5 Hz, 1H), 7.86 (dd, J = 6.6, 1.1 Hz, 1H), 7.68 (br d, J = 20.3 Hz, 2H), 7.51 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 5.14 (dd, J = 11.8, 7.4

Hz, 2H), 4.60 (m, 2H), 4.26 (m, 2H), 2.20-2.65 (m, 8H); ESIMS m/z 290 ($[M+H]^+$).

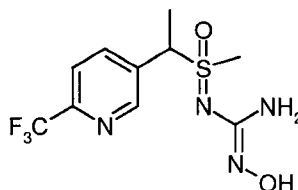
Example 16: Preparation of methyl 4-([[(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -

5 sulfanylidene)amino]carbonothioyl]amino)-4-oxobutanoate (37).



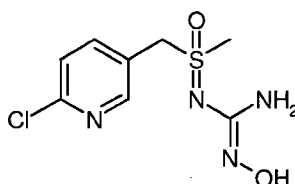
Methyl chlorosuccinate (0.099 mL, 0.803 mmol) was dissolved in acetone (2.7 mL) at 25 °C with stirring. To this solution was added Compound **22** (0.250 g, 0.803 mmol) in acetone (4 mL). Next, triethylamine (0.112 mL, 0.803 mmol) was added to the reaction mixture which was warmed to 45 °C for 6 h. The warm solution was then filtered, and the residue was washed with warm acetone. The filtrate was concentrated *in vacuo* to furnish methyl 4-([[(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)amino]carbonothioyl]amino)-4-oxobutanoate (**37**) as a yellow solid (0.342 g, >99%): mp 131–133 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ (mixture of diastereomers) 8.81 (m, 1H), 8.39 & 8.23 (m, 1H), 7.78 (m, 1H), 5.32 & 5.10 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.71 (m, 2H), 3.46 (m, 3H), 3.11 (m, 2H), 2.67 (m, 3H), 1.97 & 1.92 (d, J = 7.1 Hz, 3H); ESIMS m/z 426 ($[M+H]^+$).

Example 17: Preparation of *N*'-hydroxy-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)guanidine (38).



- Methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene
- 5 cyanamide (0.200 g, 0.721 mmol) was dissolved in ethanol (2.7 mL) at room temperature. In a separate flask, hydroxylamine hydrochloride (0.099 g, 1.44 mmol) and Na_2CO_3 (0.229 g, 2.16 mmol) were dissolved in water (0.9 mL) and then added to the reaction mixture which was heated to reflux for 8 h. Upon completion of reaction, the solvent was removed *in vacuo*. Water was added to the
- 10 residue and solids were collected via vacuum filtration to furnish *N*'-hydroxy-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)guanidine (38) as a white powder (0.070 g, 31%): mp 157–159 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (mixture of diastereomers) 8.79 (s, 1H), 8.06 (m, 1H), 7.74 (m, 1H), 5.11 & 4.98 (m, 1H), 4.52 (br s, 1H), 4.44 (br s, 1H), 3.09 & 2.96 (s, 3H),
- 15 1.89 & 1.86 (d, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESIMS m/z 311 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

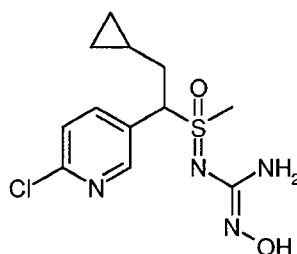
Example 18: Preparation of *N*-[[[6-chloropyridin-3-yl)methyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N*'-hydroxyguanidine (39).



61

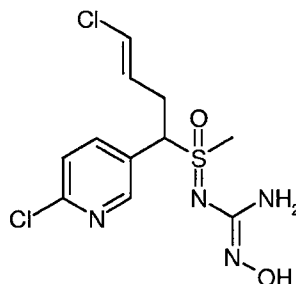
N-[[1-(6-Chloropyridin-3-yl)methyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N*'-hydroxyguanidine (**39**) was synthesized from the corresponding *N*-cyano sulfoximine according to the procedure described in Example 17. The compound was isolated as a white solid (0.184 g, 54%): mp 156–158 °C; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (mixture of diastereomers) 8.40 (s, 1H), 7.81 (m, 1H), 7.42 (m, 1H), 4.75 (m, 2H), 3.10 & 3.01 (s, 3H); ESIMS m/z 263 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

Example 19: Preparation of *N*-[[1-(6-chloropyridin-3-yl)-2-cyclopropylethyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N*'-hydroxyguanidine (**40**).



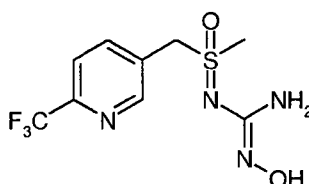
10 *N*-[[1-(6-Chloropyridin-3-yl)-2-cyclopropylethyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N*'-hydroxyguanidine (**40**) was synthesized from the corresponding *N*-cyano sulfoximine according to the procedure described in Example 17. The compound was isolated as a light yellow semi-solid (0.142 g, 34%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (mixture of diastereomers) 8.47 (s, 1H), 7.91 (m, 1H), 7.41 (m, 1H), 3.04 & 2.94 (s, 3H), 2.43 & 2.31 (m, 1H), 2.00 (m, 2H), 0.45 (m, 3H), 0.14 (m, 2H); ESIMS m/z 317 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Example 20: Preparation of *N*-[[*(3E)*-4-chloro-1-(6-chloropyridin-3-yl)but-3-enyl](methyl) oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N''*-hydroxyguanidine (**41**).



N-[[*(3E)*-4-Chloro-1-(6-chloropyridin-3-yl)but-3-enyl](methyl)oxido- λ^4 -
 5 sulfanylidene]-*N''*-hydroxyguanidine (**41**) was synthesized from the corresponding
N-cyano sulfoximine according to the procedure described in Example 17. The
 compound was isolated as a light yellow semi-solid (0.182 g, 50%): ^1H NMR (400
 MHz, CDCl_3) δ (mixture of diastereomers) 8.42 (m, 1H), 7.83 (m, 1H), 7.43 (m,
 1H), 6.07 (m, 1H), 5.64 (m, 1H), 4.58 & 4.49 (m, 2H), 3.22 (m, 1H), 3.05 & 2.94
 10 (s, 3H); ESIMS m/z 337 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Example 21: Preparation of *N''*-hydroxy-*N*-(methyl(oxido){[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]methyl}- λ^4 -sulfanylidene)guanidine (**42**).

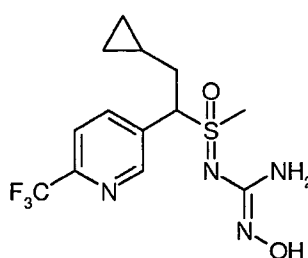


N''-Hydroxy-*N*-(methyl(oxido){[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]methyl}- λ^4 -
 15 sulfanylidene)guanidine (**42**) was synthesized from the corresponding *N*-cyano
 sulfoximine according to the procedure described in Example 17. The compound
 was isolated as a white solid (0.188 g, 56%): mp 118–120 °C; ^1H NMR (400

63

MHz, CDCl₃) δ (mixture of diastereomers) 8.74 (s, 1H), 8.04 (m, 1H), 7.77 (m, 1H), 4.34 (s, 2H), 3.14 & 2.91 (s, 3H); ESIMS m/z 297 ([M+H]⁺).

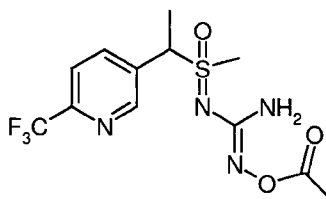
Example 22: Preparation of *N*-[2-cyclopropyl-1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl] (methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N'*-hydroxyguanidine (43)



5

N-[2-Cyclopropyl-1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N'*-hydroxyguanidine (**43**) was synthesized from the corresponding *N*-cyano sulfoximine according to the procedure described in Example 17. The compound was isolated as a brown semi-solid (0.323 g, 51%): ¹H NMR (400
10 MHz, CDCl₃) δ (mixture of diastereomers) 8.82 (m, 1H), 8.13 (m, 1H), 7.76 (m, 1H), 3.06 & 2.96 (s, 3H), 2.48 & 2.36 (m, 1H), 1.97 (m, 2H), 0.45 (m, 3H), 0.15 (m, 2H); ESIMS m/z 351 ([M+H]⁺).

Example 23: Preparation of *N'*-(acetyloxy)-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)guanidine (44).



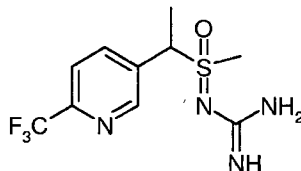
15

Compound **38** (0.300 g, 0.967 mmol) was dissolved in glacial acetic acid (48 mL) at 25 °C. To this solution was added acetic anhydride (0.100 mL, 1.06 mmol). The

mixture was allowed to stir for 1 h at room temperature under N₂. The mixture was then poured slowly into saturated aqueous NaHCO₃. Once pH 6-7 was reached, the solution was extracted with CH₂Cl₂. The organic extracts were combined, washed with brine, dried (Na₂SO₄), and concentrated *in vacuo* to furnish

5 *N*'-(acetyloxy)-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)guanidine (**44**) as a white semi-solid (0.038 g, 13%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.81 (s, 1H), 8.13 (m, 1H), 7.77 (m, 1H), 4.88 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H), 3.14 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 1.97 (d, *J* = 7.1 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 353 ([M+H]⁺).

10 Example 24: Preparation of *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)guanidine (**45**).



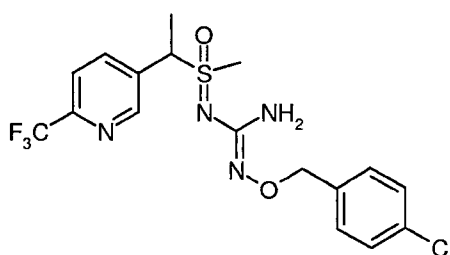
Compound **38** (0.300 g, 0.967 mmol) was dissolved in glacial acetic acid (48 mL) at room temperature. To this solution was added acetic anhydride (0.100 mL, 1.06 mmol). The mixture was allowed to stir for 1 h at room temperature under N₂. Next, 5% Pd/C (2 g, 0.967 mmol) was added, and the mixture was hydrogenated (30 psi). The Pd/C was filtered through a pad of Celite[®] and the filtrate was poured slowly into saturated aqueous NaHCO₃. Once pH>7 was reached, the solution was extracted with CH₂Cl₂. The organic extracts were combined, washed

15 with brine, dried (Na₂SO₄), and concentrated *in vacuo* to furnish *N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}-λ⁴-sulfanylidene)guanidine (**45**) as a crude yellow oil (0.111 g, 39%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ (mixture of diastereomers) 8.82 (s, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.74 (m, 1H), 5.39 & 5.27

20

(q, $J = 7.3$ Hz, 1H), 3.19 & 3.00 (s, 3H), 1.90 & 1.85 (d, $J = 7.1$ Hz, 3H); ESIMS m/z 295 ($[M+H]^+$).

Example 25: Preparation of N'' -[(4-chlorobenzyl)oxy]- N -(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)guanidine (46).



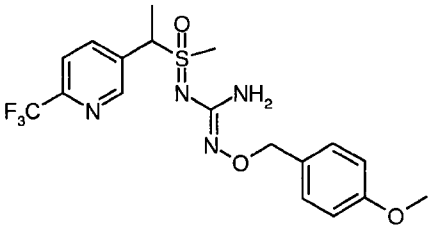
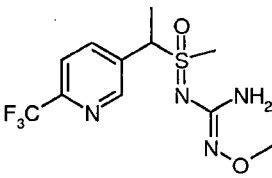
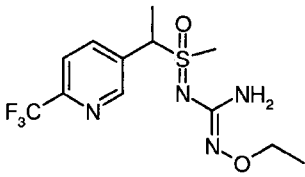
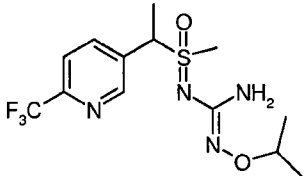
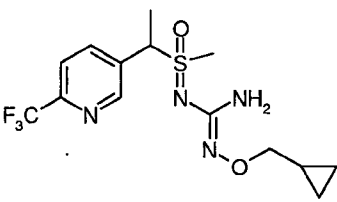
5

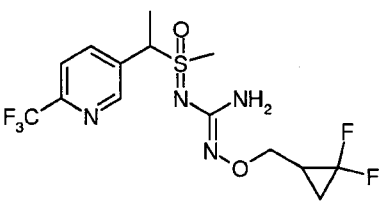
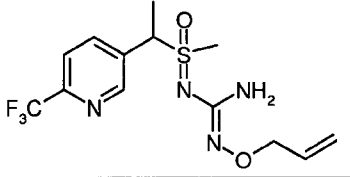
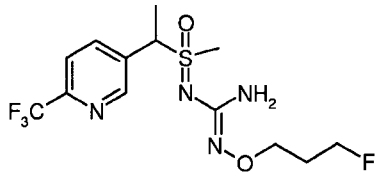
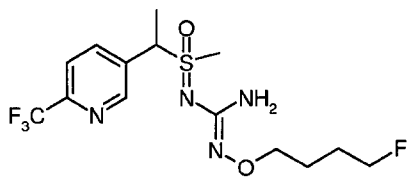
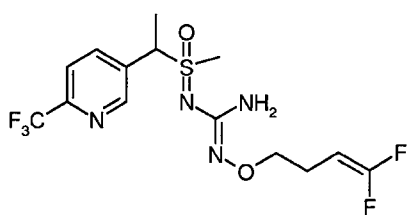
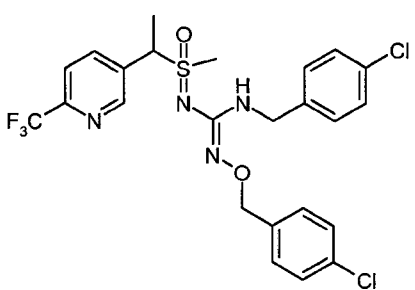
NaH (60% dispersion in mineral oil, 0.026 g, 0.644 mmol) was suspended in THF (1.6 mL) and cooled to 0 °C. Compound **38** (0.200 g, 0.644 mmol) was added, and after 15 min, 4-chlorobenzyl chloride (0.104 g, 0.644 mmol) dissolved in THF (1 mL) was then added dropwise to the reaction mixture. The ice bath was removed, and the mixture was allowed to warm to room temperature. The mixture was quenched with saturated aqueous NH_4Cl solution and diluted with ethyl acetate. The layers were separated, and the organic layer was washed with saturated aqueous NH_4Cl solution and brine. The organic layer was then concentrated *in vacuo*. The crude material was purified using reverse-phase HPLC eluting with acetonitrile/water mixtures to furnish N'' -[(4-chlorobenzyl)oxy]- N -(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)guanidine (**46**) as a tan semi-solid (0.012 g, 4%): ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ (mixture of diastereomers) 8.58 (m, 1H), 7.97 (m, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.30 (m, 2H), 7.20 (m, 2H), 4.89 (m, 1H), 4.74 (s, 2H), 2.89 & 2.82 (s, 3H), 1.68 & 1.64 (d, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESIMS m/z 435 ($[M+H]^+$).

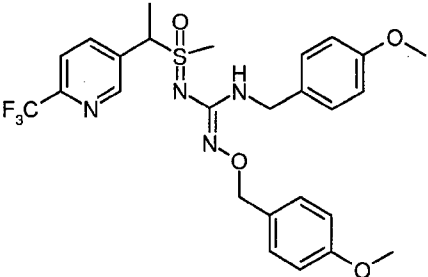
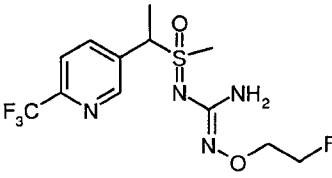
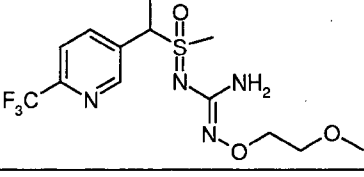
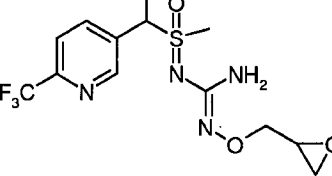
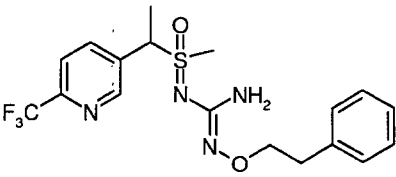
20

66

Table 3: Insecticidal Compounds

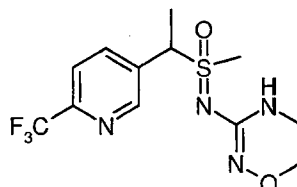
Cmpd #	Structure	Route	Characterization
47		C	brown oil; ESIMS m/z 431 ($[M+H]^+$)
48		C	yellow semi-solid; ESIMS m/z 325 ($[M+H]^+$)
49		C	pale yellow semi-solid; ESIMS m/z 339 ($[M+H]^+$)
50		C	yellow semi-solid; ESIMS m/z 353 ($[M+H]^+$)
51		C	pale yellow semi-solid; ESIMS m/z 365 ($[M+H]^+$)

52		C	pale yellow semi-solid; ESIMS m/z 401 ($[M+H]^+$)
53		C	light yellow oil; ESIMS m/z 351 ($[M+H]^+$)
54		C	orange oil; ESIMS m/z 371 ($[M+H]^+$)
55		C	light brown oil; ESIMS m/z 385 ($[M+H]^+$)
56		C	light brown oil; ESIMS m/z 401 ($[M+H]^+$)
57		C	white semi-solid; ESIMS m/z 559 ($[M+H]^+$)

58		C	light yellow semi-solid; ESIMS m/z 551 ($[M+H]^+$)
59		C	brown oil; ESIMS m/z 357 ($[M+H]^+$)
60		C	orange oil; ESIMS m/z 369 ($[M+H]^+$)
61		C	brown oil; ESIMS m/z 367 ($[M+H]^+$)
62		C	yellow oil; ESIMS m/z 413 ($[M+H]^+$)

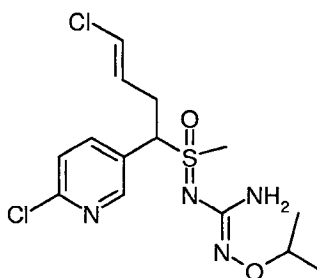
C = Route used in Example 25

Example 26: Preparation of *N'*-methoxy-*N*-methyl-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)guanidine (63).



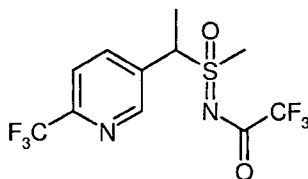
Potassium carbonate (0.044 g, 0.322 mmol) was suspended in acetonitrile (0.644 mL) at room temperature. To this mixture was added Compound **38** (0.100 g, 0.322 mmol). The solution was allowed to stir at room temperature for 30 min before addition of methyl iodide (0.020 mL, 0.322 mmol). Upon completion of addition, the reaction was allowed to stir overnight. The mixture was filtered and concentrated *in vacuo* to furnish *N'*-methoxy-*N*-methyl-*N'*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene) guanidine (**63**) as a yellow semi-solid (0.215 g, >99%): ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ (mixture of diastereomers) 9.05 (s, 1H), 8.41 (m, 1H), 7.81 (m, 1H), 6.31 & 6.20 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H), 3.87 & 3.83 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.47 & 3.36 (s, 3H), 1.97 & 1.95 (m, 3H); ESIMS *m/z* 339 ([M+H]⁺).

Example 27: Preparation of *N*-[[(3*E*)-4-chloro-1-(6-chloropyridin-3-yl)but-3-enyl](methyl oxido- λ^4 -sulfanylidene)]-*N'*-isopropoxyguanidine (64)



N-[[*(3E)*-4-Chloro-1-(6-chloropyridin-3-yl)but-3-enyl](methyl)oxido- λ^4 -sulfanylidene]-*N'*-isopropoxyguanidine (**64**) was synthesized from Compound **41** according to the procedure described in Example 25. The compound was isolated as a golden semi-solid (0.080 g, 44%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (mixture of diastereomers) 8.37 (s, 1H), 7.82 (m, 1H), 7.44 (m, 1H), 6.05 (m, 1H), 5.65 (m, 1H), 4.53 & 4.44 (m, 2H), 4.10 (m, 1H), 3.20 (m, 1H), 3.09 & 2.93 (s, 3H), 1.22 (m, 3H), 0.86 (m, 3H); ESIMS m/z 379 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Example 28: Preparation of 2,2,2-trifluoro-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)acetamide (**65**).

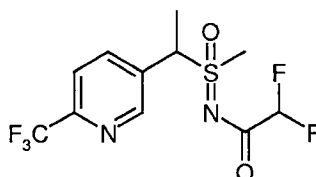


10

5-[1-(Methylsulfonimidoyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)pyridine (0.075 g, 0.297 mmol) was dissolved in pyridine (0.24 mL) at 25 °C. Next, trifluoroacetic anhydride (0.471 mL, 2.58 mmol) was added to the reaction mixture which was then allowed to stir for 2 h. The mixture was diluted with ethyl acetate, washed with 5% citric acid, brine, and saturated aqueous NaHCO_3 . The organic layer was dried (MgSO_4) and concentrated *in vacuo* to furnish 2,2,2-trifluoro-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)acetamide (**65**) as a yellow oil (43 mg, 42%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ (mixture of diastereomers) 8.80 (m, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.82 (m, 1H), 4.90 (m, 1H), 3.32 & 3.21 (s, 3H), 2.01 & 1.95 (d, $J = 7.3$ Hz, 3H); ESIMS m/z 347 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

20

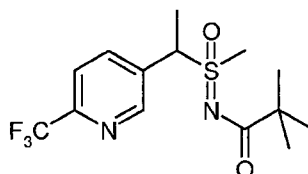
Example 29: Preparation of 2,2-difluoro-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)acetamide (**66**).



N-(Methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)-
 5 1*H*-imidazole-1-carbothioamide (300 mg, 0.83 mmol) was dissolved in acetonitrile (10 mL) and cooled to 0 °C. While stirring, hydrazine (64-65% solution in water, 30.8 μ L, 31.9 mg, 0.64 mmol) was added via syringe. After 10 min, the mixture was poured into a saturated aqueous solution of NH_4Cl (100 mL) which was extracted once with CHCl_3 (100 mL). The organic phase was washed
 10 with several aliquots of saturated aqueous NH_4Cl until the aqueous phase was slightly acidic, and then dried (Na_2SO_4). After filtration, difluoroacetic anhydride (154 μ L, 216 mg, 1.24 mmol) was added dropwise to the organic phase, which was then stirred at 25 °C for 20 min. The solvent was removed under reduced pressure. The crude concentrate contained the unstable
 15 difluoroacetylsemicarbazide and difluoroacetamide as the main products according to LC-MS analysis of the crude reaction mixture. The mixture was added slowly to saturated aqueous NaHCO_3 and extracted with CHCl_3 (3 $\times$ 50 mL). The combined organic extracts were washed with saturated aqueous ammonium hydroxide (4 $\times$ 50 mL), saturated aqueous NH_4Cl (50 mL aliquots,
 20 until neutral), dried (Na_2SO_4) and concentrated under reduced pressure. The compound was purified by reverse-phase chromatography (water-acetonitrile gradient) to furnish pure 2,2-difluoro-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl]ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)acetamide (**66**) as a yellowish oil (38 mg, 13%): $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): δ 8.79 (d, J = 2.1 Hz,

0.33H), 8.74 (d, $J = 2.1$ Hz, 0.67H), 8.09 (dd, $J = 8.2$ Hz, $J = 2.1$ Hz, 0.33H), 8.04 (dd, $J = 8.2$ Hz, $J = 2.1$ Hz, 0.67H), 7.79 (d, $J = 8.2$ Hz, 0.33H), 7.76 (d, $J = 8.2$ Hz, 0.67H), 5.83 (t, $J = 54.5$ Hz, 0.33H), 5.73 (t, $J = 54.5$ Hz, 0.67H), 4.95 (q, $J = 7.2$ Hz, 0.33H), 4.91 (q, $J = 7.2$ Hz, 0.67H), 3.28 (s, 2H), 3.14 (s, 1H), 1.97 (d, $J = 7.2$ Hz, 2H), 1.89 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H); ESIMS m/z 331 ($[M+H]^+$)

Example 30: Preparation of 2,2-dimethyl-*N*-(methyl(oxido){1-[6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl] ethyl}- λ^4 -sulfanylidene)propanamide (67).



5-[1-(Methylsulfonimidoyl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)pyridine (300 mg, 1.19 mmol) in pyridine (1 mL) and pivalic anhydride (244 mg, 1.31 mmol, 1.1 eq) were stirred at 90 °C for 1 h. Hünig's base (2 drops) was added, and the mixture was heated to reflux for 2 h. The solvent was removed under reduced pressure and the residue purified by column chromatography (methanol-methylene chloride gradient). The product was obtained as a white to off-white powder (125 mg, 31%); ^1H NMR (400MHz, CDCl_3): δ 8.78 (d, $J = 1.9$ Hz, 0.6H), 8.74 (d, $J = 1.9$ Hz, 0.4H), 8.07 (dd, $J = 8.1$ Hz, $J = 2.1$ Hz, 0.6H), 8.01 (dd, $J = 8.1$ Hz, $J = 2.1$ Hz, 0.4H), 7.76 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.71 (d, $J = 8.2$ Hz, 0.4H), 5.03 (q, $J = 7.2$ Hz, 0.6H), 4.97 (q, $J = 7.2$ Hz, 0.4H), 3.20 (s, 1.2H), 3.01 (s, 1.8H), 1.90 (d, $J = 7.2$ Hz, 1.2H), 1.80 (d, $J = 7.2$ Hz, 1.8H), 1.22 (s, 5.4H), 1.07 (s, 3.6H); ESIMS m/z 337 ($[M+H]^+$).

73

Example 31: Insecticidal Testing

Compounds **1-67** were tested against green peach aphid using procedures described hereinafter.

Insecticidal test for green peach aphid (*Myzus persicae*) in foliar spray assay

- 5 Cabbage seedlings grown in 3-inch pots, with 2-3 small (3-5 cm) true leaves, were used as test substrate. The seedlings were infested with 20-50 green peach aphids (wingless adult and nymph) 1-2 d prior to chemical application. Four seedlings were used for each treatment. Compounds (2 mg) were dissolved in 2 mL of acetone-methanol (1:1) solvent, forming stock solutions of 1000 ppm. The
- 10 stock solutions were diluted 5X with 0.025% Tween 20 in H₂O to obtain a solution at 200 ppm. A hand-held Devilbiss aspirator sprayer was used for spraying a solution to both sides of cabbage leaves until runoff. Reference plants (solvent check) were sprayed with the diluent only. Treated plants were held in a holding room for 3 d at approximately 23 °C and 40% RH prior to grading.
- 15 Evaluation was conducted by counting the number of live aphids per plant under a microscope. Insecticidal activity was measured by using Abbott's correction formula:

$$\text{Corrected \% Control} = 100 * (X - Y) / X$$

where X = No. of live aphids on solvent check plants

20 Y = No. of live aphids on treated plants

Table 4: Insecticidal Activity

	Rating against green peach aphid on cabbage (foliar spray)
Cmpd #	200 ppm
1	C
2	C
3	A
4	B
5	B
6	A
7	A
8	A
9	A
10	A
11	A
12	A
13	A
14	A
15	A
16	A
17	A
18	A
19	A
20	B
21	B
22	A
23	A
24	A
25	A
26	A

75

27	A
28	B
29	A
30	B
31	A
32	B
33	A
34	B
35	B
36	A
37	A
38	A
39	A
40	B
41	B
42	A
43	A
44	A
45	B
46	A
47	A
48	A
49	A
50	A
51	A
52	A
53	A
54	A
55	A
56	A
57	B

58	A
59	A
60	A
61	A
62	A
63	A
64	B
65	C
66	A
67	B

In each case of Table 4 the rating scale is as follows:

% Control (or Mortality)	Rating
80-100	A
Less than 80	B
Not tested	C

Acid & Salt Derivatives, and Solvates

The compounds disclosed in this invention can be in the form of pesticidally acceptable acid addition salts.

- 5 By way of non-limiting example, an amine function can form salts with hydrochloric, hydrobromic, sulfuric, phosphoric, acetic, benzoic, citric, malonic, salicylic, malic, fumaric, oxalic, succinic, tartaric, lactic, gluconic, ascorbic, maleic, aspartic, benzenesulfonic, methanesulfonic, ethanesulfonic, hydroxymethanesulfonic, and hydroxyethanesulfonic, acids.
- 10 Additionally, by way of non-limiting example, an acid function can form salts including those derived from alkali or alkaline earth metals and those derived

37

from ammonia and amines. Examples of preferred cations include sodium, potassium, magnesium, and aminium cations.

The salts are prepared by contacting the free base form with a sufficient amount of the desired acid to produce a salt. The free base forms may be
5 regenerated by treating the salt with a suitable dilute aqueous base solution such as dilute aqueous NaOH, potassium carbonate, ammonia, and sodium bicarbonate.

As an example, in many cases, a pesticide is modified to a more water soluble form e.g. 2,4-dichlorophenoxy acetic acid dimethyl amine salt is a more water soluble form of 2,4-dichlorophenoxy acetic acid a well known herbicide.

10 The compounds disclosed in this invention can also form stable complexes with solvent molecules that remain intact after the non-complexed solvent molecules are removed from the compounds. These complexes are often referred to as "solvates".

Stereoisomers

15 Certain compounds disclosed in this invention can exist as one or more stereoisomers. The various stereoisomers include geometric isomers, diastereomers, and enantiomers. Thus, the compounds disclosed in this invention include racemic mixtures, individual stereoisomers, and optically active mixtures.

It will be appreciated by those skilled in the art that one stereoisomer may
20 be more active than the others. Individual stereoisomers and optically active mixtures may be obtained by selective synthetic procedures, by conventional synthetic procedures using resolved starting materials, or by conventional resolution procedures.

78

Pests

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests.

5 In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Phylum Nematoda.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Phylum Arthropoda.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Subphylum Chelicerata.

10 In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Class Arachnida.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Subphylum Myriapoda.

15 In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Class Symphyla.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Subphylum Hexapoda.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control pests of the Class Insecta.

20 In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Coleoptera (beetles)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Acanthoscelides spp. (weevils), Acanthoscelides

79

- obtectus (common bean weevil), *Agrilus planipennis* (emerald ash borer),
Agriotes spp. (wireworms), *Anoplophora glabripennis* (Asian longhorned beetle),
Anthonomus spp. (weevils), *Anthonomus grandis* (boll weevil), *Aphidius* spp.,
Apion spp. (weevils), *Apogonia* spp. (grubs), *Ataenius spretulus* (Black Turgrass
5 *Ataenius*), *Atomaria linearis* (pygmy mangold beetle), *Aulacophore* spp.,
Bothynoderes punctiventris (beet root weevil), *Bruchus* spp. (weevils), *Bruchus*
pisorum (pea weevil), *Cacoesia* spp., *Callosobruchus maculatus* (southern cow pea
weevil), *Carpophilus hemipteras* (dried fruit beetle), *Cassida vittata*, *Cerosterna*
spp., *Cerotoma* spp. (chrysomelids), *Cerotoma trifurcata* (bean leaf beetle),
10 *Ceutorhynchus* spp. (weevils), *Ceutorhynchus assimilis* (cabbage seedpod weevil),
Ceutorhynchus napi (cabbage curculio), *Chaetocnema* spp. (chrysomelids),
Colaspis spp. (soil beetles), *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmosus*,
Conotrachelus nenuphar (plum curculio), *Cotinus nitidis* (Green June beetle),
Crioceris asparagi (asparagus beetle), *Cryptolestes ferrugineus* (rusty grain
15 beetle), *Cryptolestes pusillus* (flat grain beetle), *Cryptolestes turcicus* (Turkish
grain beetle), *Ctenicera* spp. (wireworms), *Curculio* spp. (weevils), *Cyclocephala*
spp. (grubs), *Cylindrocpturus adpersus* (sunflower stem weevil), *Deporaus*
marginatus (mango leaf-cutting weevil), *Dermestes lardarius* (larder beetle),
Dermestes maculatus (hide beetle), *Diabrotica* spp. (chrysolemids), *Epilachna*
20 *varivestis* (Mexican bean beetle), *Faustinus cubae*, *Hylobius pales* (pales weevil),
Hypera spp. (weevils), *Hypera postica* (alfalfa weevil), *Hyperdoes* spp.
(*Hyperodes* weevil), *Hypothenemus hampei* (coffee berry beetle), *Ips* spp.
(engravers), *Lasioderma serricorne* (cigarette beetle), *Leptinotarsa decemlineata*
(Colorado potato beetle), *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus*
25 *oryzophilus* (rice water weevil), *Lyctus* spp. (wood beetles/powder post beetles),
Maecolaspis joliveti, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp.,
Meligethes aeneus (blossom beetle), *Melolontha melolontha* (common European
cockchafer), *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros* (date palm

beetle), *Oryzaephilus mercator* (merchant grain beetle), *Oryzaephilus surinamensis* (sawtoothed grain beetle), *Otiorhynchus* spp. (weevils), *Oulema melanopus* (cereal leaf beetle), *Oulema oryzae*, *Pantomorus* spp. (weevils), *Phyllophaga* spp. (May/June beetle), *Phyllophaga cuyabana*, *Phyllotreta* spp. (chrysomelids), *Phynchites* spp., *Popillia japonica* (Japanese beetle), *Prostephanus truncatus* (larger grain borer), *Rhizopertha dominica* (lesser grain borer), *Rhizotrogus* spp. (European chafer), *Rhynchophorus* spp. (weevils), *Scolytus* spp. (wood beetles), *Shenophorus* spp. (Billbug), *Sitona lineatus* (pea leaf weevil), *Sitophilus* spp. (grain weevils), *Sitophilus granaries* (granary weevil), *Sitophilus oryzae* (rice weevil), *Stegobium paniceum* (drugstore beetle), *Tribolium* spp. (flour beetles), *Tribolium castaneum* (red flour beetle), *Tribolium confusum* (confused flour beetle), *Trogoderma variable* (warehouse beetle), and *Zabrus tenebrioides*.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Dermaptera (earwigs)**.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Dictyoptera (cockroaches)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, *Blattella germanica* (German cockroach), *Blatta orientalis* (oriental cockroach), *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana* (American cockroach), *Periplaneta australoasiae* (Australian cockroach), *Periplaneta brunnea* (brown cockroach), *Periplaneta fuliginosa* (smokybrown cockroach), *Pycnoselus suninamensis* (Surinam cockroach), and *Supella longipalpa* (brownbanded cockroach).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Diptera (true flies)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, *Aedes* spp. (mosquitoes), *Agromyza frontella* (alfalfa blotch

leafminer), *Agromyza* spp. (leaf miner flies), *Anastrepha* spp. (fruit flies),
Anastrepha suspensa (Caribbean fruit fly), *Anopheles* spp. (mosquitoes),
Batrocera spp. (fruit flies), *Bactrocera cucurbitae* (melon fly), *Bactrocera dorsalis*
(oriental fruit fly), *Ceratitis* spp. (fruit flies), *Ceratitis capitata* (Mediterranean fruit
5 fly), *Chrysops* spp. (deer flies), *Cochliomyia* spp. (screwworms), *Contarinia* spp.
(Gall midges), *Culex* spp. (mosquitoes), *Dasineura* spp. (gall midges), *Dasineura*
brassicae (cabbage gall midge), *Delia* spp., *Delia platura* (seedcorn maggot),
Drosophila spp. (vinegar flies), *Fannia* spp. (filth flies), *Fannia canicularis* (little
house fly), *Fannia scalaris* (latrine fly), *Gasterophilus intestinalis* (horse bot fly),
10 *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans* (horn fly), *Hylemyia* spp. (root maggots),
Hypoderma lineatum (common cattle grub), *Liriomyza* spp. (leafminer flies),
Liriomyza brassica (serpentine leafminer), *Melophagus ovinus* (sheep ked),
Musca spp. (muscid flies), *Musca autumnalis* (face fly), *Musca domestica* (house
fly), *Oestrus ovis* (sheep bot fly), *Oscinella frit* (frit fly), *Pegomyia betae* (beet
15 leafminer), *Phorbia* spp., *Psila rosae* (carrot rust fly), *Rhagoletis cerasi* (cherry
fruit fly), *Rhagoletis pomonella* (apple maggot), *Sitodiplosis mosellana* (orange
wheat blossom midge), *Stomoxys calcitrans* (stable fly), *Tabanus* spp. (horse
flies), and *Tipula* spp. (crane flies).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be
20 used to control **Hemiptera (true bugs)**. A non-exhaustive list of these pests
includes, but is not limited to, *Acrosternum hilare* (green stink bug), *Blissus*
leucopterus (chinch bug), *Calocoris norvegicus* (potato mirid), *Cimex hemipterus*
(tropical bed bug), *Cimex lectularius* (bed bug), *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops*
furcatus, *Dysdercus suturellus* (cotton stainer), *Edessa meditabunda*, *Eurygaster*
25 *maura* (cereal bug), *Euschistus heros*, *Euschistus servus* (brown stink bug),
Helopeltis antonii, *Helopeltis theivora* (tea blight plantbug), *Lagynotomus* spp.
(stink bugs), *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus* spp. (plant
bugs), *Lygus hesperus* (western tarnished plant bug), *Maconellicoccus hirsutus*,

Neurocolpus longirostris, Nezara viridula (southern green stink bug), Phytocoris spp. (plant bugs), Phytocoris californicus, Phytocoris relativus, Piezodorus guildingi, Poecilopsus lineatus (fourlined plant bug), Psallus vaccinicola, Pseudacysta perseae, Scaptocoris castanea, and Triatoma spp. (bloodsucking
 5 conenose bugs/kissing bugs).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Homoptera (aphids, scales, whiteflies, leafhoppers)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Acrythosiphon pisum (pea aphid), Adelges spp. (adelgids), Aleurodes proletella (cabbage whitefly),
 10 Aleurodicus disperses, Aleurothrixus floccosus (woolly whitefly), Aluacaspis spp., Amrasca bigutella bigutella, Aphrophora spp. (leafhoppers), Aonidiella aurantii (California red scale), Aphis spp. (aphids), Aphis gossypii (cotton aphid), Aphis pomi (apple aphid), Aulacorthum solani (foxglove aphid), Bemisia spp. (whiteflies), Bemisia argentifolii, Bemisia tabaci (sweetpotato whitefly),
 15 Brachycolus noxius (Russian aphid), Brachycorynella asparagi (asparagus aphid), Brevennia rehi, Brevicoryne brassicae (cabbage aphid), Ceroplastes spp.(scales), Ceroplastes rubens (red wax scale), Chionaspis spp.(scales), Chrysomphalus spp. (scales), Coccus spp. (scales), Dysaphis plantaginea (rosy apple aphid), Empoasca spp. (leafhoppers), Eriosoma lanigerum (woolly apple aphid), Icerya purchasi
 20 (cottony cushion scale), Idioscopus nitidulus (mango leafhopper), Laodelphax striatellus (smaller brown planthopper), Lepidosaphes spp., Macrosiphum spp., Macrosiphum euphorbiae (potato aphid), Macrosiphum granarium (English grain aphid), Macrosiphum rosae (rose aphid), Macrosteles quadrilineatus (aster leafhopper), Mahanarva frimbiolata, Metopolophium dirhodum (rose grain aphid),
 25 Mictis longicornis, Myzus persicae (green peach aphid), Nephotettix spp. (leafhoppers), Nephotettix cinctipes (green leafhopper), Nilaparvata lugens (brown planthopper), Parlatoria pergandii (chaff scale), Parlatoria ziziphi (ebony scale), Peregrinus maidis (corn delphacid), Philaenus spp. (spittlebugs),

- Phylloxera vitifoliae (grape phylloxera), Physokermes piceae (spruce bud scale), Planococcus spp. (mealybugs), Pseudococcus spp. (mealybugs), Pseudococcus brevipes (pine apple mealybug), Quadraspidiotus perniciosus (San Jose scale), Rhapalosiphum spp. (aphids), Rhapalosiphum maidi (corn leaf aphid),
- 5 Rhapalosiphum padi (oat bird-cherry aphid), Saissetia spp. (scales), Saissetia oleae (black scale), Schizaphis graminum (greenbug), Sitobion avenae (English grain aphid), Sogatella furcifera (white-backed planthopper), Therioaphis spp. (aphids), Toumeyella spp. (scales), Toxoptera spp. (aphids), Trialeurodes spp. (whiteflies), Trialeurodes vaporariorum (greenhouse whitefly), Trialeurodes
- 10 abutiloneus (bandedwing whitefly), Unaspis spp. (scales), Unaspis yanonensis (arrowhead scale), and Zulia entreriana.

- In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Hymenoptera (ants, wasps, and bees)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Acromyrmex spp., Athalia rosae, Atta
- 15 spp. (leafcutting ants), Camponotus spp. (carpenter ants), Diprion spp. (sawflies), Formica spp. (ants), Iridomyrmex humilis (Argentine ant), Monomorium spp., Monomorium minimum (little black ant), Monomorium pharaonis (Pharaoh ant), Neodiprion spp. (sawflies), Pogonomyrmex spp. (harvester ants), Polistes spp. (paper wasps), Solenopsis spp. (fire ants), Tapinoma sessile (odorous house ant),
- 20 Tetranorium spp. (pavement ants), Vespula spp. (yellow jackets), and Xylocopa spp. (carpenter bees).

- In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Isoptera (termites)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Coptotermes spp., Coptotermes curvignathus, Coptotermes
- 25 frenchii, Coptotermes formosanus (Formosan subterranean termite), Cornitermes spp. (nasute termites), Cryptotermes spp. (drywood termites), Heterotermes spp. (desert subterranean termites), Heterotermes aureus, Kalotermea spp. (drywood

84

- termites), *Incistitermes* spp. (drywood termites), *Macrotermes* spp. (fungus growing termites), *Marginitermes* spp. (drywood termites), *Microcerotermes* spp. (harvester termites), *Microtermes obesi*, *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp. (subterranean termites), *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*,
5 *Reticulitermes flavipes* (eastern subterranean termite), *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus* (western subterranean termite), *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, *Reticulitermes virginicus*, *Schedorhinotermes* spp., and *Zootermopsis* spp. (rotten-wood termites).
- 10 In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Lepidoptera (moths and butterflies)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, *Achoea janata*, *Adoxophyes* spp., *Adoxophyes orana*, *Agrotis* spp. (cutworms), *Agrotis ipsilon* (black cutworm), *Alabama argillacea* (cotton leafworm), *Amorbia cuneana*, *Amyelosis transitella*
15 (navel orangeworm), *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella* (peach twig borer), *Anomis sabulifera* (jute looper), *Anticarsia gemmatalis* (velvetbean caterpillar), *Archips argyrospila* (fruittree leafroller), *Archips rosana* (rose leaf roller), *Argyrotaenia* spp. (tortricid moths), *Argyrotaenia citrana* (orange tortrix), *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara* (rice leaf folder),
20 *Bucculatrix thurberiella* (cotton leafperforator), *Caloptilia* spp. (leaf miners), *Capua reticulana*, *Carposina niponensis* (peach fruit moth), *Chilo* spp., *Chlumetia transversa* (mango shoot borer), *Choristoneura rosaceana* (oblique banded leafroller), *Chrysodeixis* spp., *Cnaphalocerus medinalis* (grass leafroller), *Colias* spp., *Conpomorpha cramerella*, *Cossus cossus* (carpenter moth), *Crambus* spp.
25 (Sod webworms), *Cydia funebrana* (plum fruit moth), *Cydia molesta* (oriental fruit moth), *Cydia nignicana* (pea moth), *Cydia pomonella* (codling moth), *Darna diducta*, *Diaphania* spp. (stem borers), *Diatraea* spp. (stalk borers), *Diatraea saccharalis* (sugarcane borer), *Diatraea graniosella* (southwester corn borer),

85

- Earias spp. (bollworms), Earias insulata (Egyptian bollworm), Earias vitella (rough northern bollworm), Ecdytopopha aurantianum, Elasmopalpus lignosellus (lesser cornstalk borer), Epiphysias postruttana (light brown apple moth), Ephestia spp. (flour moths), Ephestia cautella (almond moth), Ephestia elutella (tobacco moth), Ephestia kuehniella (Mediterranean flour moth), Epimeces spp., Epinotia aporema, Erionota thrax (banana skipper), Eupoecilia ambiguella (grape berry moth), Euxoa auxiliaris (army cutworm), Feltia spp. (cutworms), Gortyna spp. (stemborers), Grapholita molesta (oriental fruit moth), Hedylepta indicata (bean leaf webber), Helicoverpa spp. (noctuid moths), Helicoverpa armigera (cotton bollworm), Helicoverpa zea (bollworm/corn earworm), Heliothis spp. (noctuid moths), Heliothis virescens (tobacco budworm), Hellula undalis (cabbage webworm), Indarbela spp. (root borers), Keiferia lycopersicella (tomato pinworm), Leucinodes orbonalis (eggplant fruit borer), Leucoptera malifoliella, Lithocolletis spp., Lobesia botrana (grape fruit moth), Loxagrotis spp. (noctuid moths), Loxagrotis albicosta (western bean cutworm), Lymantria dispar (gypsy moth), Lyonetia clerkella (apple leaf miner), Mahasena corbetti (oil palm bagworm), Malacosoma spp. (tent caterpillars), Mamestra brassicae (cabbage armyworm), Maruca testulalis (bean pod borer), Metisa plana (bagworm), Mythimna unipuncta (true armyworm), Neoleucinodes elegantalis (small tomato borer), Nymphula depunctalis (rice caseworm), Operophtera brumata (winter moth), Ostrinia nubilalis (European corn borer), Oxydia vesulia, Pandemis cerasana (common currant tortrix), Pandemis heparana (brown apple tortrix), Papilio demodocus, Pectinophora gossypiella (pink bollworm), Peridroma spp. (cutworms), Peridroma saucia (variegated cutworm), Perileucoptera coffeella (white coffee leafminer), Phthorimaea operculella (potato tuber moth), Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp. (leafminers), Pieris rapae (imported cabbageworm), Plathypena scabra, Plodia interpunctella (Indian meal moth), Plutella xylostella (diamondback moth), Polychrosis viteana (grape berry moth),

Prays endocarpa, Prays oleae (olive moth), Pseudaletia spp. (noctuid moths), Pseudaletia unipunctata (armyworm), Pseudoplusia includens (soybean looper), Rachiplusia nu, Scirpophaga incertulas, Sesamia spp. (stemborers), Sesamia inferens (pink rice stem borer), Sesamia nonagrioides, Setora nitens, Sitotroga
 5 cerealella (Angoumois grain moth), Sparganothis pilleriana, Spodoptera spp. (armyworms), Spodoptera exigua (beet armyworm), Spodoptera fugiperda (fall armyworm), Spodoptera oridania (southern armyworm), Synanthedon spp. (root borers), Thecla basilides, Thermisia gemmatilis, Tineola bisselliella (webbing clothes moth), Trichoplusia ni (cabbage looper), Tuta absoluta, Yponomeuta spp.,
 10 Zeuzera coffeae (red branch borer), and Zeuzera pyrina (leopard moth).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Mallophaga (chewing lice)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Bovicola ovis (sheep biting louse), Menacanthus stramineus (chicken body louse), and Menopon gallinea (common hen house).

15 In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Orthoptera (grasshoppers, locusts, and crickets)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Anabrus simplex (Mormon cricket), Gryllotalpidae (mole crickets), Locusta migratoria, Melanoplus spp.(grasshoppers), Microcentrum retinerve (angular winged katydid), Pterophylla
 20 spp. (kaydids), chistocerca gregaria, Scudderia furcata (forktailed bush katydid), and Valanga nigricorni.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Phthiraptera (sucking lice)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Haematopinus spp. (cattle and hog lice),
 25 Linognathus ovillus (sheep louse), Pediculus humanus capitis (human body

87

louse), *Pediculus humanus humanus* (human body lice), and *Pthirus pubis* (crab louse),

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Siphonaptera (fleas)**. A non-exhaustive list of these pests
5 includes, but is not limited to, *Ctenocephalides canis* (dog flea), *Ctenocephalides felis* (cat flea), and *Pulex irritans* (human flea).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Thysanoptera (thrips)**. A non-exhaustive list of these pests
includes, but is not limited to, *Frankliniella fusca* (tobacco thrips), *Frankliniella*
10 *occidentalis* (western flower thrips), *Frankliniella shultzei* *Frankliniella williamsi* (corn thrips), *Heliothrips haemorrhoidalis* (greenhouse thrips), *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Scirtothrips citri* (citrus thrips), *Scirtothrips dorsalis* (yellow tea thrips), *Taeniothrips rhopalantennalis*, and *Thrips* spp.

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be
15 used to control **Thysanura (bristletails)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, *Lepisma* spp. (silverfish) and *Thermobia* spp. (firebrats).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Acarina (mites and ticks)**. A non-exhaustive list of these pests
20 includes, but is not limited to, *Acarapsis woodi* (tracheal mite of honeybees), *Acarus* spp. (food mites), *Acarus siro* (grain mite), *Aceria mangiferae* (mango bud mite), *Aculops* spp., *Aculops lycopersici* (tomato russet mite), *Aculops pelekasi*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali* (apple rust mite), *Amblyomma americanum* (lone star tick), *Boophilus* spp. (ticks), *Brevipalpus obovatus* (privet mite),
25 *Brevipalpus phoenicis* (red and black flat mite), *Demodex* spp. (mange mites), *Dermacentor* spp. (hard ticks), *Dermacentor variabilis* (american dog tick),

Dermatophagoides pteronyssinus (house dust mite), Eotetranychus spp., Eotetranychus carpini (yellow spider mite), Epitimerus spp., Eriophyes spp., Ixodes spp. (ticks), Metatetranychus spp., Notoedres cati, Oligonychus spp., Oligonychus coffee, Oligonychus ilicus (southern red mite), Panonychus spp.,
5 Panonychus citri (citrus red mite), Panonychus ulmi (European red mite), Phyllocoptruta oleivora (citrus rust mite), Polyphagotarsonemus latus (broad mite), Rhipicephalus sanguineus (brown dog tick), Rhizoglyphus spp. (bulb mites), Sarcoptes scabiei (itch mite), Tegolophus perseae, Tetranychus spp., Tetranychus urticae (twospotted spider mite), and Varroa destructor (honey bee
10 mite).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Nematoda (nematodes)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Aphelenchoides spp. (bud and leaf & pine wood nematodes), Belonolaimus spp. (sting nematodes), Cricone-mella spp. (ring
15 nematodes), Dirofilaria immitis (dog heartworm), Ditylenchus spp. (stem and bulb nematodes), Heterodera spp. (cyst nematodes), Heterodera zeae (corn cyst nematode), Hirschmanniella spp. (root nematodes), Hoplolaimus spp. (lance nematodes), Meloidogyne spp. (root knot nematodes), Meloidogyne incognita (root knot nematode), Onchocerca volvulus (hook-tail worm), Pratylenchus spp.
20 (lesion nematodes), Radopholus spp. (burrowing nematodes), and Rotylenchus reniformis (kidney-shaped nematode).

In another embodiment, the invention disclosed in this document can be used to control **Symphyla (symphylans)**. A non-exhaustive list of these pests includes, but is not limited to, Scutigera immaculata.

For more detailed information consult "Handbook of Pest Control – The Behavior, Life History, and Control of Household Pests" by Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 by GIE Media Inc.

Mixtures

- 5 Some of the pesticides that can be employed beneficially in combination with the invention disclosed in this document include, but are not limited to the following:

1,2 dichloropropane, 1,3 dichloropropene,

- 10 abamectin, acephate, acequinocyl, acetamiprid, acethion, acetoprole, acrinathrin, acrylonitrile, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, aldrin, allethrin, allosamidin, allyxycarb, alpha-cypermethrin, alpha-ecdysone, alpha-endosulfan AKD-1022, amidithion, amidoflumet, aminocarb, amiton, amitraz, anabasine, arsenous oxide, athidathion, azadirachtin, azamethiphos, azinphos ethyl, azinphos methyl, azobenzene, azocyclotin, azothoate,

- 15 *Bacillus thuringiensis*, barium hexafluorosilicate, barthrin, benclothiaz, bendiocarb, benfuracarb, benomyl, benoxafos, bensultap, benzoximate, benzyl benzoate, beta-cyfluthrin, beta-cypermethrin, bifenazate, bifenthrin, binapacryl, bioallethrin, bioethanomethrin, biopermethrin, bistrifluron, borax, boric acid, bromfenvinfos, bromo DDT, bromocyclen, bromophos, bromophos ethyl, 20 bromopropylate, bufencarb, buprofezin, butacarb, butathiofos, butocarboxim, butonate, butoxycarboxim,

- cadusafos, calcium arsenate, calcium polysulfide, camphechlor, carbanolate, carbaryl, carbofuran, carbon disulfide, carbon tetrachloride, carbophenothion, carbosulfan, cartap, chinomethionat, chlorantraniliprole, 25 chlorbenseide, chlorbicyclen, chlordane, chlordecone, chlordimeform,

chlorethoxyfos, chlorfenapyr, chlorfenethol, chlorfenson, chlorfensulphide,
 chlorfenvinphos, chlorfluazuron, chlormephos, chlorobenzilate, 3-(4-chloro-2,6-
 diemthylphenyl)-4-hydroxy-8-oxa-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-2-one, 3-(4'-chloro-
 2,4-dimethyl[1,1'-biphenyl]-3-yl)-4-hydroxy-8-oxa-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-2-
 5 one, 4-[[[(6-chloro-3-pyridinyl)methyl]methylamino]-2(5H)-furanone, 4-[[[(6-
 chloro-3-pyridinyl)methyl]cyclopropylamino]-2(5H)-furanone, 3-chloro-N2-
 [(1S)-1-methyl-2-(methylsulfonyl)ethyl]-N1-[2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-
 (trifluoromethyl)ethyl]phenyl]-1,2-benzenedicarboxamide, chloroform,
 chloromebuform, chloromethiuron, chloropicrin, chloropropylate, chlorphoxim,
 10 chlorprazophos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, chlorthiophos,
 chromafenozide, cinerin I, cinerin II, cismethrin, cloethocarb, clofentezine,
 closantel, clothianidin, copper acetoarsenite, copper arsenate, copper naphthenate,
 copper oleate, coumaphos, coumithoate, crotamiton, crotoxyphos, cruentaren A
 &B, crufomate, cryolite, cyanofenphos, cyanophos, cyanthoate, cyanthraniliprole,
 15 cyclethrin, cycloprothrin, cyenopyrafen, cyflumetofen, cyfluthrin, cyhalothrin,
 cyhexatin, cypermethrin, cyphenothrin, cyromazine, cythioate, 2-cyano-N-ethyl-4-
 fluoro-3-methoxy-benzenesulfonamide, 2-cyano-N-ethyl-3-methoxy-
 benzenesulfonamide, 2-cyano-3-difluoromethoxy-N-ethyl-4-fluoro-
 benzenesulfonamide, 2-cyano-3-fluoromethoxy-N-ethyl-benzenesulfonamide, 2-
 20 cyano-6-fluoro-3-methoxy-N,N-dimethyl-benzenesulfonamide, 2-cyano-N-ethyl-
 6-fluoro-3-methoxy-N-methyl-benzenesulfonamide, 2-cyano-3-difluoromethoxy-
 N,N-diemthyl-benzenesulfonamide.

d-limonene, dazomet, DBCP, DCIP, DDT, decarbofuran, deltamethrin,
 demephion, demephion O, demephion S, demeton, demeton methyl, demeton O,
 25 demeton O methyl, demeton S, demeton S methyl, demeton S methylsulphon,
 diafenthion, dialifos, diamidafos, diazinon, dicapthion, dichlofenthion,
 dichlofluanid, dichlorvos, dicofol, dicresyl, dicrotophos, dicyclanil, dieldrin,
 dienochlor, diflovidazin, diflubenzuron, 3-(difluoromethyl)-N-[2-(3,3-

dimethylbutyl)phenyl]-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide dilor, dimefluthrin, dimefox, dimetan, dimethoate, dimethrin, dimethylvinphos, dimetilan, dinex, dinobuton, dinocap, dinocap 4, dinocap 6, dinocaton, dinopenton, dinoprop, dinosam, dinosulfon, dinotefuran, dinoterbon, diofenolan, dioxabenzofos, 5 dioxacarb, dioxathion, diphenyl sulfone, disulfiram, disulfoton, dithicrofos, DNOC, dofenapyn, doramectin,

ecdysterone, emamectin, EMPC, empenthrin, endosulfan, endothion, endrin, EPN, epofenonane, eprinomectin, esfenvalerate, etaphos, ethiofencarb, ethion, ethiprole, ethoate methyl, ethoprophos, ethyl DDD, ethyl formate, ethylene 10 dibromide, ethylene dichloride, ethylene oxide, etofenprox, etoxazole, etrimfos, EXD,

F1050, famphur, fenamiphos, fenazaflor, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenchlorphos, fenethacarb, fenfluthrin, fenitrothion, fenobucarb, fenothiocarb, fenoxacrim, fenoxycarb, fenpirithrin, fenpropathrin, fenpyroximate, fenson, 15 fensulfothion, fenthion, fenthion ethyl, fentrifanil, fenvalerate, fipronil, FKI-1033, flonicamid, fluacrypyrim, fluazuron, flubendiamide, flubenzimine, flucofuron, flucycloxuron, flucythrinate, fluenetil, flufenerim, flufenoxuron, flufenprox, flumethrin, fluorbenside, fluvalinate, fonofos, formetanate, formothion, formparanate, fosmethilan, fospirate, fosthiazate, fosthietan, fosthietan, 20 furathiocarb, furethrin, furfural,

Gamma-cyhalothrin, gamma-HCH,

halfenprox, halofenozide, HCH, HEOD, heptachlor, heptenophos, heterophos, hexaflumuron, hexythiazox, HHDN, hydramethylnon, hydrogen cyanide, hydroprene, hyquincarb,

imicyafos, imidacloprid, imiprothrin, indoxacarb, iodomethane, IPSP, isamidofos, isazofos, isobenzan, isocarbophos, isodrin, isofenphos, isoprocarb, isoprothiolane, isothioate, isoxathion, ivermectin,

jasmolin I, jasmolin II, jodfenphos, juvenile hormone I, juvenile hormone
5 II, juvenile hormone III, JS118,

kelevan, kinoprene,

lambda-cyhalothrin, lead arsenate, lepimectin, leptophos, lindane, lirimfos, lufenuron, lythidathion,

malathion, malonoben, mazidox, mecarbam, mecarphon, menazon,
10 mephosfolan, mercurous chloride, mesulfen, mesulfenfos, metaflumizone, metam, methacrifos, methamidophos, methidathion, methiocarb, methocrotophos, methomyl, methoprene, methoxychlor, methoxyfenozide, methyl bromide, methyl isothiocyanate, methylchloroform, methylene chloride, metofluthrin, metolcarb, metoxadiazone, mevinphos, mexacarbate, milbemectin, milbemycin oxime,
15 mipafox, mirex, MNAF, monocrotophos, morphothion, moxidectin,

naftalofos, naled, naphthalene, N-ethyl-2,2-dimethylpropionamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -thrifluoro-p-tolyl) hydrazone, N-ethyl-2,2-dichloro-1-methylcyclopropane-carboxamide-2-(2,6-dichloro- α,α,α -thrifluoro-p-tolyl) hydrazone, nicotine, nifluridide, nikkomycins, nitenpyram, nithiazine, nitrilacarb,
20 novaluron, noviflumuron,

omethoate, oxamyl, oxydemeton methyl, oxydeprofos, oxydisulfoton,

paradichlorobenzene, parathion, parathion methyl, penfluron, pentachlorophenol, permethrin, phenkapton, phenothrin, phenthoate, phorate, phosalone, phosfolan, phosmet, phosnichlor, phosphamidon, phosphine,

93

- phosphocarb, phoxim, phoxim methyl, pirimetaphos, pirimicarb, pirimiphos ethyl, pirimiphos methyl, potassium arsenite, potassium thiocyanate, pp' DDT, prallethrin, precocene I, precocene II, precocene III, primidophos, proclonol, profenofos, profluthrin, promacyl, promecarb, propaphos, propargite, 5 propetamphos, propoxur, prothidathion, prothiofos, prothoate, protrifenbutate, pyraclofos, pyrafluprole, pyrazophos, pyresmethrin, pyrethrin I, pyrethrin II, pyridaben, pyridalyl, pyridaphenthion, pyrifluquinazon, pyrimidifen, pyrimitate, pyriprole, pyriproxifen,
- Qcide, quassia, quinalphos, quinalphos, quinalphos methyl, quinothion, 10 quantifies,
- rafoxanide, resmethrin, rotenone, ryania,
- sabadilla, schradan, selamectin, silafluofen, sodium arsenite, sodium fluoride, sodium hexafluorosilicate, sodium thiocyanate, sophamide, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulcofuron, sulfiram, 15 sulfluramid, sulfotep, sulfoxafur, sulfur, sulfuric acid, sulprofos,
- tau-fluvalinate, tazimcarb, TDE, tebufenozide, tebufenpyrad, tebupirimfos, teflubenzuron, tefluthrin, temephos, TEPP, terallethrin, terbufos, tetrachloroethane, tetrachlorvinphos, tetradifon, tetramethrin, tetranactin, tetrasul, theta cypermethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thicofos, thiocarbonyl, 20 thiocyclam, thiodicarb, thiofanox, thiometon, thionazin, thioquinox, thiosultap, thuringiensin, tolfenpyrad, tralomeethrin, transfluthrin, transpermethrin, triarathene, triazamate, triazophos, trichlorfon, trichlorometaphos 3, trichloronate, trifenofos, triflumuron, trimethacarb, triprene,
- vamidothion, vamidothion, vaniliprole, vaniliprole,
- 25 XDE-208, XMC, xylylcarb,

94

Zeta-cypermethrin and zolaprofos.

Additionally, any combination of the above pesticides can be used.

The invention disclosed in this document can also be used with herbicides and fungicides, both for reasons of economy and synergy.

5 The invention disclosed in this document can be used with antimicrobials, bactericides, defoliants, safeners, synergists, algaecides, attractants, desiccants, pheromones, repellants, animal dips, avicides, disinfectants, semiochemicals, and molluscicides (these categories not necessarily mutually exclusive) for reasons of economy, and synergy.

10 For more information consult "Compendium of Pesticide Common Names" located at <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html> as of the filing date of this document. Also consult "The Pesticide Manual" 14th Edition, edited by C D S Tomlin, copyright 2006 by British Crop Production Council.

Synergistic Mixtures

15 The invention disclosed in this document can be used with other compounds such as the ones mentioned under the heading "Mixtures" to form synergistic mixtures where the mode of action of the compounds in the mixtures are the same, similar, or different.

20 Examples of mode of actions include, but are not limited to: acetyl choline esterase inhibitor; sodium channel modulator; chitin biosynthesis inhibitor; GABA-gated chloride channel antagonist; GABA and glutamate-gated chloride channel agonist; acetyl choline receptor agonist; MET I inhibitor; Mg-stimulated ATPase inhibitor; nicotinic acetylcholine receptor; Midgut membrane disrupter; and oxidative phosphorylation disrupter.

9/5

Additionally, the following compounds are known as synergists and can be used with the invention disclosed in this document: piperonyl butoxide, piprotal, propyl isome, sesamex, sesamolin, and sulfoxide.

Formulations

5 A pesticide is rarely suitable for application in its pure form. It is usually necessary to add other substances so that the pesticide can be used at the required concentration and in an appropriate form, permitting ease of application, handling, transportation, storage, and maximum pesticide activity. Thus, pesticides are formulated into, for example, baits, concentrated emulsions, dusts, emulsifiable
10 concentrates, fumigants, gels, granules, microencapsulations, seed treatments, suspension concentrates, suspoemulsions, tablets, water soluble liquids, water dispersible granules or dry flowables, wettable powders, and ultra low volume solutions.

For further information on formulation types see "Catalogue of pesticide
15 formulation types and international coding system" Technical Monograph n°2, 5th Edition by CropLife International (2002).

Pesticides are applied most often as aqueous suspensions or emulsions prepared from concentrated formulations of such pesticides. Such water-soluble, water-suspendable, or emulsifiable formulations, are either solids, usually known
20 as wettable powders, or water dispersible granules, or liquids usually known as emulsifiable concentrates, or aqueous suspensions. Wettable powders, which may be compacted to form water dispersible granules, comprise an intimate mixture of the pesticide, a carrier, and surfactants. The concentration of the pesticide is usually from about 10% to about 90% by weight. The carrier is usually chosen
25 from among the attapulgite clays, the montmorillonite clays, the diatomaceous earths, or the purified silicates. Effective surfactants, comprising from about 0.5%

to about 10% of the wettable powder, are found among sulfonated lignins, condensed naphthalenesulfonates, naphthalenesulfonates, alkylbenzenesulfonates, alkyl sulfates, and nonionic surfactants such as ethylene oxide adducts of alkyl phenols.

5 Emulsifiable concentrates of pesticides comprise a convenient concentration of a pesticide, such as from about 50 to about 500 grams per liter of liquid dissolved in a carrier that is either a water miscible solvent or a mixture of water-immiscible organic solvent and emulsifiers. Useful organic solvents include aromatics, especially xylenes and petroleum fractions, especially the high-boiling
10 naphthalenic and olefinic portions of petroleum such as heavy aromatic naphtha. Other organic solvents may also be used, such as the terpenic solvents including rosin derivatives, aliphatic ketones such as cyclohexanone, and complex alcohols such as 2-ethoxyethanol. Suitable emulsifiers for emulsifiable concentrates are chosen from conventional anionic and nonionic surfactants.

15 Aqueous suspensions comprise suspensions of water-insoluble pesticides dispersed in an aqueous carrier at a concentration in the range from about 5% to about 50% by weight. Suspensions are prepared by finely grinding the pesticide and vigorously mixing it into a carrier comprised of water and surfactants. Ingredients, such as inorganic salts and synthetic or natural gums, may also be
20 added, to increase the density and viscosity of the aqueous carrier. It is often most effective to grind and mix the pesticide at the same time by preparing the aqueous mixture and homogenizing it in an implement such as a sand mill, ball mill, or piston-type homogenizer.

 Pesticides may also be applied as granular compositions that are
25 particularly useful for applications to the soil. Granular compositions usually contain from about 0.5% to about 10% by weight of the pesticide, dispersed in a

carrier that comprises clay or a similar substance. Such compositions are usually prepared by dissolving the pesticide in a suitable solvent and applying it to a granular carrier which has been pre-formed to the appropriate particle size, in the range of from about 0.5 to 3 mm. Such compositions may also be formulated by
5 making a dough or paste of the carrier and compound and crushing and drying to obtain the desired granular particle size.

Dusts containing a pesticide are prepared by intimately mixing the pesticide in powdered form with a suitable dusty agricultural carrier, such as kaolin clay, ground volcanic rock, and the like. Dusts can suitably contain from
10 about 1% to about 10% of the pesticide. They can be applied as a seed dressing, or as a foliage application with a dust blower machine.

It is equally practical to apply a pesticide in the form of a solution in an appropriate organic solvent, usually petroleum oil, such as the spray oils, which are widely used in agricultural chemistry.

15 Pesticides can also be applied in the form of an aerosol composition. In such compositions the pesticide is dissolved or dispersed in a carrier, which is a pressure-generating propellant mixture. The aerosol composition is packaged in a container from which the mixture is dispensed through an atomizing valve.

Pesticide baits are formed when the pesticide is mixed with food or an
20 attractant or both. When the pests eat the bait they also consume the pesticide. Baits may take the form of granules, gels, flowable powders, liquids, or solids. They are used in pest harborages.

Fumigants are pesticides that have a relatively high vapor pressure and hence can exist as a gas in sufficient concentrations to kill pests in soil or enclosed
25 spaces. The toxicity of the fumigant is proportional to its concentration and the

exposure time. They are characterized by a good capacity for diffusion and act by penetrating the pest's respiratory system or being absorbed through the pest's cuticle. Fumigants are applied to control stored product pests under gas proof sheets, in gas sealed rooms or buildings or in special chambers.

- 5 Pesticides can be microencapsulated by suspending the pesticide particles or droplets in plastic polymers of various types. By altering the chemistry of the polymer or by changing factors in the processing, microcapsules can be formed of various sizes, solubility, wall thicknesses, and degrees of penetrability. These factors govern the speed with which the active ingredient within is released, which, in turn, affects the residual performance, speed of action, and odor of the product.

- 10 Oil solution concentrates are made by dissolving pesticide in a solvent that will hold the pesticide in solution. Oil solutions of a pesticide usually provide faster knockdown and kill of pests than other formulations due to the solvents themselves having pesticidal action and the dissolution of the waxy covering of the integument increasing the speed of uptake of the pesticide. Other advantages of oil solutions include better storage stability, better penetration of crevices, and better adhesion to greasy surfaces.

- 20 Another embodiment is an oil-in-water emulsion, wherein the emulsion comprises oily globules which are each provided with a lamellar liquid crystal coating and are dispersed in an aqueous phase, wherein each oily globule comprises at least one compound which is agriculturally active, and is individually coated with a monolamellar or oligolamellar layer comprising: (1) at least one non-ionic lipophilic surface-active agent, (2) at least one non-ionic hydrophilic surface-active agent and (3) at least one ionic surface-active agent, wherein the globules having a mean particle diameter of less than 800 nanometers. Further

99

information on the embodiment is disclosed in U.S. patent publication 20070027034 published February 1, 2007, having Patent Application serial number 11/495,228. For ease of use this embodiment will be referred to as "OIWE".

- 5 For further information consult "Insect Pest Management" 2nd Edition by D. Dent, copyright CAB International (2000). Additionally, for more detailed information consult "Handbook of Pest Control – The Behavior, Life History, and Control of Household Pests" by Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 by GIE Media Inc.

10 **Other Formulation Components**

- Generally, the invention disclosed in this document when used in a formulation, such formulation can also contain other components. These components include, but are not limited to, (this is a non-exhaustive and non-mutually exclusive list) wetters, spreaders, stickers, penetrants, buffers,
15 sequestering agents, drift reduction agents, compatibility agents, anti-foam agents, cleaning agents, and emulsifiers. A few components are described forthwith.

- A wetting agent is a substance that when added to a liquid increases the spreading or penetration power of the liquid by reducing the interfacial tension between the liquid and the surface on which it is spreading. Wetting agents are
20 used for two main functions in agrochemical formulations: during processing and manufacture to increase the rate of wetting of powders in water to make concentrates for soluble liquids or suspension concentrates; and during mixing of a product with water in a spray tank to reduce the wetting time of wettable powders and to improve the penetration of water into water-dispersible granules.
25 Examples of wetting agents used in wettable powder, suspension concentrate, and

water-dispersible granule formulations are: sodium lauryl sulphate; sodium dioctyl sulphosuccinate; alkyl phenol ethoxylates; and aliphatic alcohol ethoxylates.

A dispersing agent is a substance which adsorbs onto the surface of a particles and helps to preserve the state of dispersion of the particles and prevents them from reaggregating. Dispersing agents are added to agrochemical formulations to facilitate dispersion and suspension during manufacture, and to ensure the particles redisperse into water in a spray tank. They are widely used in wettable powders, suspension concentrates and water-dispersible granules. Surfactants that are used as dispersing agents have the ability to adsorb strongly onto a particle surface and provide a charged or steric barrier to reaggregation of particles. The most commonly used surfactants are anionic, non-ionic, or mixtures of the two types. For wettable powder formulations, the most common dispersing agents are sodium lignosulphonates. For suspension concentrates, very good adsorption and stabilization are obtained using polyelectrolytes, such as sodium naphthalene sulphonate formaldehyde condensates. Tristyrylphenol ethoxylate phosphate esters are also used. Non-ionics such as alkylarylethylene oxide condensates and EO-PO block copolymers are sometimes combined with anionics as dispersing agents for suspension concentrates. In recent years, new types of very high molecular weight polymeric surfactants have been developed as dispersing agents. These have very long hydrophobic 'backbones' and a large number of ethylene oxide chains forming the 'teeth' of a 'comb' surfactant. These high molecular weight polymers can give very good long-term stability to suspension concentrates because the hydrophobic backbones have many anchoring points onto the particle surfaces. Examples of dispersing agents used in agrochemical formulations are: sodium lignosulphonates; sodium naphthalene sulphonate formaldehyde condensates; tristyrylphenol ethoxylate phosphate esters; aliphatic alcohol ethoxylates; alky ethoxylates; EO-PO block copolymers; and graft copolymers.

An emulsifying agent is a substance which stabilizes a suspension of droplets of one liquid phase in another liquid phase. Without the emulsifying agent the two liquids would separate into two immiscible liquid phases. The most commonly used emulsifier blends contain alkylphenol or aliphatic alcohol with 12 or more ethylene oxide units and the oil-soluble calcium salt of dodecylbenzene sulphonic acid. A range of hydrophile-lipophile balance ("HLB") values from 8 to 18 will normally provide good stable emulsions. Emulsion stability can sometimes be improved by the addition of a small amount of an EO-PO block copolymer surfactant.

10 A solubilizing agent is a surfactant which will form micelles in water at concentrations above the critical micelle concentration. The micelles are then able to dissolve or solubilized water-insoluble materials inside the hydrophobic part of the micelle. The type of surfactants usually used for solubilization are non-ionics: sorbitan monooleates; sorbitan monooleate ethoxylates; and methyl oleate esters.

15 Surfactants are sometimes used, either alone or with other additives such as mineral or vegetable oils as adjuvants to spray-tank mixes to improve the biological performance of the pesticide on the target. The types of surfactants used for bioenhancement depend generally on the nature and mode of action of the pesticide. However, they are often non-ionics such as: alky ethoxylates; linear 20 aliphatic alcohol ethoxylates; aliphatic amine ethoxylates.

A carrier or diluent in an agricultural formulation is a material added to the pesticide to give a product of the required strength. Carriers are usually materials with high absorptive capacities, while diluents are usually materials with low absorptive capacities. Carriers and diluents are used in the formulation of dusts, 25 wettable powders, granules and water-dispersible granules.

Organic solvents are used mainly in the formulation of emulsifiable concentrates, ULV formulations, and to a lesser extent granular formulations. Sometimes mixtures of solvents are used. The first main groups of solvents are aliphatic paraffinic oils such as kerosene or refined paraffins. The second main group and the most common comprises the aromatic solvents such as xylene and higher molecular weight fractions of C9 and C10 aromatic solvents. Chlorinated hydrocarbons are useful as cosolvents to prevent crystallization of pesticides when the formulation is emulsified into water. Alcohols are sometimes used as cosolvents to increase solvent power.

Thickeners or gelling agents are used mainly in the formulation of suspension concentrates, emulsions and suspoemulsions to modify the rheology or flow properties of the liquid and to prevent separation and settling of the dispersed particles or droplets. Thickening, gelling, and anti-settling agents generally fall into two categories, namely water-insoluble particulates and water-soluble polymers. It is possible to produce suspension concentrate formulations using clays and silicas. Examples of these types of materials, include, but are limited to, montmorillonite, e.g. bentonite; magnesium aluminum silicate; and attapulgite. Water-soluble polysaccharides have been used as thickening-gelling agents for many years. The types of polysaccharides most commonly used are natural extracts of seeds and seaweeds or are synthetic derivatives of cellulose. Examples of these types of materials include, but are not limited to, guar gum; locust bean gum; carrageenan; alginates; methyl cellulose; sodium carboxymethyl cellulose (SCMC); hydroxyethyl cellulose (HEC). Other types of anti-settling agents are based on modified starches, polyacrylates, polyvinyl alcohol and polyethylene oxide. Another good anti-settling agent is xanthan gum.

Microorganisms cause spoilage of formulated products. Therefore preservation agents are used to eliminate or reduce their effect. Examples of such

agents include, but are limited to: propionic acid and its sodium salt; sorbic acid and its sodium or potassium salts; benzoic acid and its sodium salt; p-hydroxy benzoic acid sodium salt; methyl p-hydroxy benzoate; and 1,2-benzisothiazalin-3-one (BIT).

5 The presence of surfactants, which lower interfacial tension, often causes water-based formulations to foam during mixing operations in production and in application through a spray tank. In order to reduce the tendency to foam, anti-foam agents are often added either during the production stage or before filling into bottles. Generally, there are two types of anti-foam agents, namely silicones
10 and non-silicones. Silicones are usually aqueous emulsions of dimethyl polysiloxane while the non-silicone anti-foam agents are water-insoluble oils, such as octanol and nonanol, or silica. In both cases, the function of the anti-foam agent is to displace the surfactant from the air-water interface.

 For further information see "Chemistry and Technology of Agrochemical
15 Formulations" edited by D.A. Knowles, copyright 1998 by Kluwer Academic Publishers. Also see "Insecticides in Agriculture and Environment – Retrospects and Prospects" by A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya, and R. Perry, copyright 1998 by Springer-Verlag.

Applications

20 The actual amount of pesticide to be applied to loci of pests is not critical and can readily be determined by those skilled in the art. In general, concentrations from about 0.01 grams of pesticide per hectare to about 5000 grams of pesticide per hectare are expected to provide good control.

 The locus to which a pesticide is applied can be any locus inhabited by an
25 pest, for example, vegetable crops, fruit and nut trees, grape vines, ornamental

plants, domesticated animals, the interior or exterior surfaces of buildings, and the soil around buildings.

Generally, with baits, the baits are placed in the ground where, for example, termites can come into contact with the bait. Baits can also be applied to
5 a surface of a building, (horizontal, vertical, or slant, surface) where, for example, ants, termites, cockroaches, and flies, can come into contact with the bait.

Because of the unique ability of the eggs of some pests to resist pesticides repeated applications may be desirable to control newly emerged larvae.

Systemic movement of pesticides in plants may be utilized to control pests
10 on one portion of the plant by applying the pesticides to a different portion of the plant. For example, control of foliar-feeding insects can be controlled by drip irrigation or furrow application, or by treating the seed before planting. Seed treatment can be applied to all types of seeds, including those from which plants genetically transformed to express specialized traits will germinate.
15 Representative examples include seeds or plants expressing proteins and/or double stranded RNA toxic to invertebrate pests, such as *Bacillus thuringiensis*, Bt Cry toxins, Bt Vip toxins, RNAi, or other insecticidal toxins, those expressing herbicide resistance, such as "Roundup Ready" seed, or those with "stacked" foreign genes expressing insecticidal toxins, herbicide resistance, nutrition-
20 enhancement or any other beneficial traits. Furthermore, such seed treatments with the invention disclosed in this document can further enhance the ability of a plant to better withstand stressful growing conditions. This results in a healthier, more vigorous plant, which can lead to higher yields at harvest time.

It should be readily apparent that the invention can be used with plants
25 genetically transformed to express specialized traits, such as *Bacillus thuringiensis*, RNAi, or other insecticidal toxins, or those expressing herbicide

resistance, or those with “stacked” foreign genes expressing insecticidal toxins, herbicide resistance, nutrition-enhancement or any other beneficial traits.

The invention disclosed in this document is suitable for controlling endoparasites and ectoparasites in the veterinary medicine sector or in the field of animal keeping (which for the avoidance of doubt includes pets, for example, cats, dogs, and birds). Compounds according to the invention are applied here in a known manner, such as by oral administration in the form of, for example, tablets, capsules, drinks, granules, by dermal application in the form of, for example, dipping, spraying, pouring on, spotting on, and dusting, and by parenteral administration in the form of, for example, an injection.

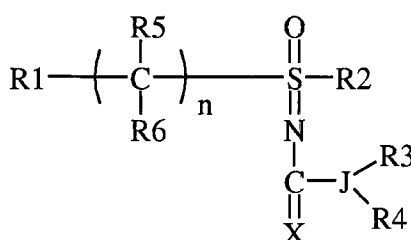
The invention disclosed in this document can also be employed advantageously in livestock keeping, for example, cattle, sheep, pigs, chickens, and geese. Suitable formulations are administered orally to the animals with the drinking water or feed. The dosages and formulations that are suitable depend on the species.

Before a pesticide can be used or sold commercially, such pesticide undergoes lengthy evaluation processes by various governmental authorities (local, regional, state, national, international). Voluminous data requirements are specified by regulatory authorities and must be addressed through data generation and submission by the product registrant or by another on the product registrant's behalf. These governmental authorities then review such data and if a determination of safety is concluded, provide the potential user or seller with product registration approval. Thereafter, in that locality where the product registration is granted and supported, such user or seller may use or sell such pesticide.

The headings in this document are for convenience only and must not be used to interpret any portion thereof.

We claim:

1. A compound having the following formula (I)



(I)

wherein:

- 5 (a) R1 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted with one or
10 more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl;
- 15 (b) R2 is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted with one or
20 more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆

- alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein
- 5 R₂ and R₅ may also form a 4, 5, or 6 membered ring;
- (c) R₃ is F, Cl, Br, I, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H,
- 10 heterocyclyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ aryl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H, F, Cl, Br, I) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy) C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₃ and R₄ may also form a 4, 5, or 6 membered ring;
- 15
- (d) R₄ is F, Cl, Br, I, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ aryl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈,
- 20 wherein each of which may be independently substituted (except for H, F, Cl, Br, I) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆
- 25

haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy) C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₃ and R₄ may also form a 4, 5, or 6 membered ring;

(e) R₅ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₃-C₈ cycloalkyl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₂ and R₅ may also form a 4, 5, or 6 membered ring, and wherein R₅ and R₆ may also form a 3, 4, 5, or 6 membered ring;

(f) R₆ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, H, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2),

S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₃-C₈ cycloalkyl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀, and heterocyclyl, and wherein R₂ and R₅ may also form a 4, 5, or 6 membered ring, and wherein R₅ and R₆ may also form a 3, 4, 5, or 6 membered ring;

(g) n is 0 to 4;

(h) X is NR₈, O, or S;

(i) J is N or CR₇;

(j) R₇ is H, F, Cl, Br, I, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, heterocyclyl, or C₀-C₈ alkyl-C(=O)OR₈, wherein each of which may be independently substituted (except for H, F, Cl, Br, I) with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, NR₉R₁₀ and heterocyclyl;

(k) R₈ is H, OH, OC(=O)C₁-C₆ alkyl, C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,

C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl (wherein said aryl may be substituted with one or more substituents selected from F, Cl, Br, I, or C₁-C₈ alkoxy), C₁-C₆ hydroxyalkyl, and heterocyclyl;

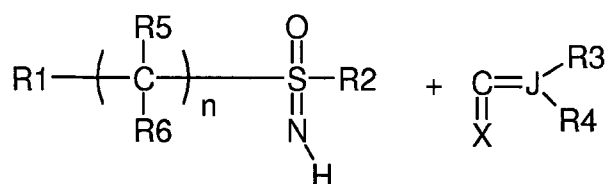
(l) R₉ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl, C₁-C₆ hydroxyalkyl, and heterocyclyl, and wherein R₉ and R₁₀ may also form a 4, 5, or 6 membered ring; and

(m) R₁₀ is C₂-C₈ alkenyl, C₂-C₈ alkenyloxy, C₂-C₈ alkenylthio, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkylthio, C₂-C₈ alkynyl, C₂-C₈ alkynyloxy, C₂-C₈ alkynylthio, aryl, C₃-C₈ cycloalkenyl, C₃-C₈ cycloalkenyloxy, C₃-C₈ cycloalkenylthio, C₃-C₈ cycloalkyl, C₃-C₈ cycloalkoxy, C₃-C₈ cycloalkylthio, or heterocyclyl, wherein each of which may be independently substituted with one or more of the following substituents, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₁-C₆ alkoxy, C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, C₁-C₆ haloalkylthio, S(=O)_{n1}C₁-C₆ alkyl (where n₁=0-2), S(=O)_{n1}C₁-C₆ haloalkyl (where n₁=0-2), OSO₂C₁-C₆ haloalkyl, C(=O)OC₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ alkyl, C(=O)C₁-C₆ haloalkyl, aryl,

C₁-C₆ hydroxyalkyl, and heterocyclyl, and wherein R₉ and R₁₀ may also form a 4, 5, or 6 membered ring.

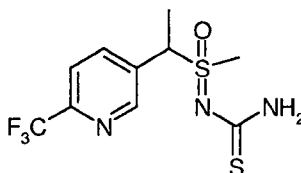
2. A compound that is a pesticidally acceptable acid addition salt of a compound according to claim 1.
- 5 3. A solvate comprising compound according to claim 1.
4. A process comprising applying a compound according to claim 1 to a locus to control pests.
5. A process comprising applying a compound according to claim 1 to a locus to control pests of Phylum Nematoda or Phylum Arthropoda.
- 10 6. A composition comprising a mixture of a compound according to claim 1 with at least one other pesticide.
7. A composition comprising a mixture of a compound according to claim 1 with at least one herbicide, at least one fungicide, or at least one herbicide and fungicide.
- 15 8. A composition comprising a compound according to claim 1 with at least one of the following items: acetyl choline esterase inhibitor; sodium channel modulator; chitin biosynthesis inhibitor; GABA-gated chloride channel antagonist; GABA and glutamate-gated chloride channel agonist; acetyl choline receptor agonist; MET I inhibitor; Mg-stimulated ATPase inhibitor; nicotinic
20 acetylcholine receptor; Midgut membrane disrupter; or oxidative phosphorylation disrupter.
9. A process of applying a compound of claim 1 to a seed.

10. A process of applying a compound of claim 1 to a seed that has been genetically transformed to express one or more specialized traits.
11. A process of applying a compound of claim 1 to a genetically transformed plant that has been genetically transformed to express one or more specialized traits.
- 5 12. A process of orally administering or applying a compound of claim 1 to an animal.
13. A process comprising reacting



- 10 to yield a compound according to claim 1, wherein R1, R2, R3, R4, R5, and R6 are as specified in claim 1.

14. A compound having the following formula



PLAGUICIDAS

Referencia cruzada a solicitud relacionada

La presente solicitud reivindica el beneficio de la solicitud provisional estadounidense Acta número 5 61/067.874, presentada el 3 de marzo de 2008.

Campo de la invención

La invención descrita en este documento se relaciona con el campo de los plaguicidas y su uso en el control de plagas.

10 Antecedentes de la invención

Las plagas causan anualmente millones de muertes de seres humanos en todo el mundo. Además, existen diez mil especies de plagas que ocasionan pérdidas en la agricultura. Estas pérdidas en la agricultura 15 significan mil millones de Dólares estadounidenses por año. Las termitas provocan daños a diversas estructuras como, por ejemplo, casas. Estas pérdidas relacionadas con el daño producido por las termitas ascienden a mil millones anuales de dólares estadounidenses. Como

última observación, muchas plagas de los alimentos almacenados ingieren y adulteran el alimento almacenado. Estas pérdidas de alimentos almacenados significan mil millones de dólares estadounidenses
5 anuales, pero lo más importante, privan a la gente del alimento necesario.

Existe entonces una gran necesidad de nuevos plaguicidas. Los insectos desarrollan resistencia a los plaguicidas de uso actual. Cientos de especies de
10 insectos son resistentes a uno o más plaguicidas. El desarrollo de resistencia a algunos de los plaguicidas más viejos, como, por ejemplo, DDT, los carbonatos y los organofosfatos, es muy conocido. Pero también, han desarrollado resistencia aún a algunos de los
15 plaguicidas más nuevos. Por lo tanto, existe la necesidad de contar con nuevos plaguicidas y, particularmente, plaguicidas con nuevos modos de acción.

Sustituyentes (Lista no exhaustiva)

20 Los ejemplos dados para los sustituyentes (excepto para halo) son no exhaustivos y no deben

interpretarse como limitativos de la invención descripta en este documento.

"**Alquenilo**" significa un sustituyente acíclico, insaturado (por lo menos un doble enlace de carbono-carbono), ramificado o no ramificado, que consta de
5 carbono e hidrógeno, por ejemplo, vinilo, alilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo, y decenilo.

"**Alqueniloxi**" significa un alquenilo que además
10 consta de un único enlace de carbono-oxígeno, por ejemplo, aliloxi, buteniloxi, penteniloxi, hexeniloxi, hepteniloxi, octeniloxi, noneniloxi, y deceniloxi.

"**Alcoxi**" significa un alquilo que además consta de un único enlace de carbono-oxígeno, por ejemplo,
15 metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, 1-butoxi, 2-butoxi, isobutoxi, ter-butoxi, pentoxi, 2-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, hexoxi, heptoxi, octoxi, nonoxi, y decoxi.

"**Alquilo**" significa un sustituyente acíclico,
20 saturado, ramificado o no ramificado, que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, isobutilo,

ter-butilo, pentilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, y decilo.

"**Alquinilo**" significa un sustituyente acíclico, insaturado (por lo menos un triple enlace carbono-carbono, y cualesquiera enlaces dobles), ramificado o
5 no ramificado, que consta de carbono e hidrógeno y, por ejemplo, etinilo, propargilo, butinilo, pentinilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo y decinilo.

"**Alquiniloxi**" significa un alquinilo que además
10 consta de un único enlace carbono-oxígeno, por ejemplo, pentiniloxi, hexiniloxi, heptiniloxi, octiniloxi, noniniloxi, y deciniloxi.

"**Arilo**" significa un sustituyente cíclico, aromático que consta de hidrógeno y carbono, por
15 ejemplo, fenilo, naftilo, fluorenilo y bifenilo.

"**Cicloalquenilo**" significa un sustituyente monocíclico o policíclico, insaturado (por lo menos un doble enlace carbono-carbono) que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclobutenilo, ciclopentenilo,
20 ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, ciclodecenilo, norbornenilo, biciclo [2.2.2] octenilo,

tetrahidronaftilo, hexahidronaftilo, y octahidronaftilo.

"**Cicloalqueniloxi**" significa un cicloalqueno que además consta de un enlace único de carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclobuteniloxi, ciclopenteniloxi, 5 ciclohexeniloxi, ciclohepteniloxi, cicloocteniloxi, ciclodeceniloxi, norborneniloxi, y biciclo [2.2.2] octeniloxi.

"**Cicloalquilo**" significa un sustituyente 10 monocíclico o policíclico, saturado, que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclodecilo, norbornilo, biciclo [2.2.2] octilo, y decahidronaftilo.

15 "**Cicloalcoxi**" significa un cicloalquilo que además consta de un enlace único de carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, cicloheptiloxi, ciclooctiloxi, ciclodeciloxi, norborniloxi, y biciclo [2.2.2] 20 octiloxi.

"**Halo**" significa flúor, cloro, bromo y yodo.

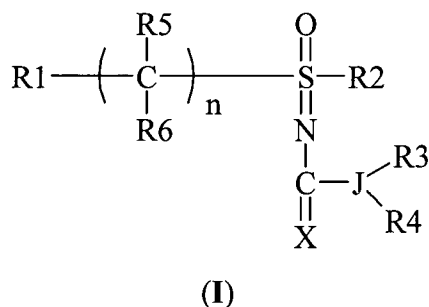
"**Haloalquilo**" significa un alquilo que además consta de uno a la cantidad máxima posible de halos, idénticos o diferentes, por ejemplo, fluormetilo, difluormetilo, trifluormetilo, 1-fluormetilo, 2-fluoretilo, 2,2,2-trifluoretilo, clorometilo, triclorometilo, y 1,1,2,2-tetrafluoretilo.

"**Heterociclilo**" significa un sustituyente cíclico que puede estar completamente saturado, parcialmente insaturado, o completamente insaturado, donde la estructura cíclica contiene por lo menos un carbono y por lo menos un heteroátomo, donde dicho heteroátomo es nitrógeno, azufre, u oxígeno, por ejemplo, benzofuranilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo, benzoxazolilo, benzotienilo, benzotiazolil cinolinilo, furanilo, indazolilo, indolilo, imidazolilo, isoindolilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, oxiraniilo, 1,3,4-oxadiazolilo, oxazolinilo, oxazolilo, ftalazinilo, pirazinilo, pirazolinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinoxalinilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, tiazolinilo, tiazolilo, tienilo, 1,2,3-

triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,3-triazolilo, y 1,2,4-triazolilo.

Descripción detallada de la invención

Los compuestos de la presente invención poseen la
5 siguiente fórmula genérica (I)



en donde:

(a) R1 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈,
alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio
10 C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio
C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-
C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, heterociclilo,
o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede
15 estar independientemente sustituido con uno o más de
los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,

alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , $S(=O)_{n1}$ alquilo C_1-C_6 (donde $n1=0-2$), $S(=O)_{n1}C_1-C_6$ haloalquilo (donde $n1=0-2$), $OSO_2C_1-C_6$ haloalquilo,
5 $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10, y heterociclilo;

(b) R2 es alquenilo C_2-C_8 , alqueniloxi C_2-C_8 , alqueniltio C_2-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , alquiltio
10 C_1-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , alquiniloxi C_2-C_8 , alquiniltio C_2-C_8 , arilo, cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalqueniloxi C_3-C_8 , cicloalqueniltio C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquiltio C_3-C_8 , heterociclilo, o alquilo $C_0-C_8-C(=O)OR8$, donde cada uno de los cuales
15 puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , $S(=O)_{n1}$ alquilo C_1-C_6 (donde $n1=0-2$), $S(=O)_{n1}$
20 haloalquilo C_1-C_6 (donde $n1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10,

y heterociclilo, y donde R2 y R5 pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros;

- (c) R3 es F, Cl, Br, I, alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈,
5 alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O)
10 arilo C₁-C₆, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H, F, Cl, Br, I) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo (donde dicho arilo puede estar
15 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxi C₁-C₈) hidroxialquilo C₁-C₆,
- 20

NR9R10, y heterociclilo, y donde R3 y R4 pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros;

- (d) R4 es F, Cl, Br, I, alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈,
5 alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O)
10 arilo C₁-C₆, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H, F, Cl, Br, I) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo (donde dicho arilo puede estar
15 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxi C₁-C₈) hidroxialquilo C₁-C₆,
- 20

NR9R10, y heterociclilo, y donde R3 y R4 pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros;

(e) R5 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1}alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, cicloalquilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₆, NR9R10, y heterociclilo, y donde R2 y R5 pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros, y donde R5 y R6 pueden formar también un anillo de 3, 4, 5, o 6 miembros;

- (f) R6 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-
5 C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes
10 sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O
15 alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, cicloalquilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀, y heterociclilo, y donde R₂ y R₅ pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros, y donde R₅ y R₆ pueden formar también un anillo de 3, 4, 5, o 6
20 miembros;
- (g) n es 0 a 4;
- (h) X es NR₈, O, o S;

(i) J es N o CR7;

(j) R7 es H, F, Cl, Br, I, alquenilo C₂-C₈,
 alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈,
 alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈,
 5 alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo,
 cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈,
 cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi
 C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, heterociclilo, o alquilo
 C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar
 10 independientemente sustituido (excepto H, F, Cl, Br, I)
 con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl,
 Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆,
 alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆,
 haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo
 15 C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde
 n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆,
 C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo,
 hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo;

(k) R₈ es H, OH, OC(=O)alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₈,
 20 alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈,
 alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈,
 alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo,

cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈,
cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi
C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o heterociclilo, donde cada
uno de ellos puede estar independientemente sustituido
5 con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl,
Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆,
alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈,
halocicloalquilo C₃-C₈, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi
C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde
10 n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂
haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo
C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo (donde dicho arilo
puede estar sustituido con uno o más sustituyentes
seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxi C₁-C₈),
15 hidroxialquilo C₁-C₆, y heterociclilo;
(1) R₉ es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈,
alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio
C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio
C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-
20 C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o
heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar

independientemente sustituido con uno o más de los
siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi
C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio
5 C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}
haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-
C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O)
haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, y
heterociclilo, y donde R₉ y R₁₀ pueden formar también
10 un anillo de 4, 5 o 6 miembros; y
(m) R₁₀ es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈,
alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio
C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio
C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-
15 C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o
heterociclilo, donde cada uno de los cuales puede estar
independientemente sustituido con uno o más de los
siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
20 alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi
C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio
C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}

haloalquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , y heterociclilo, y en donde R_9 y R_{10} pueden formar
5 también un anillo de 4, 5 o 6 miembros.

En otra realización de la presente invención, R_1 es arilo o heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes F, Cl, Br, I, alquilo C_1-
10 C_6 o haloalquilo C_1-C_6 .

En otra realización de la presente invención, R_1 es un heterociclilo, donde dicho heterociclilo puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes F, Cl, Br, I, alquilo C_1-
15 C_6 o haloalquilo C_1-C_6 .

En otra realización de la presente invención, R_1 es piridilo, en donde dicho piridilo puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes Cl, CH_3 , o CF_3 .

20 En otra realización de la presente invención, R_1 es piridilo, donde dicho piridilo está sustituido con uno de los siguientes sustituyentes Cl, CH_3 , o CF_3 que

se encuentran unidos al átomo de carbono en la sexta posición.

En otra realización de la presente invención, R2 es un alquilo C₁-C₈.

5 En otra realización de la presente invención, R2 es un CH₃.

En otra realización de la presente invención, R2 y R5 forman un anillo de seis miembros compuesto de carbono, hidrógeno y el átomo de azufre.

10 En otra realización de la presente invención, R3 es H, F, o alquilo C₁-C₈.

En otra realización de la presente invención, R3 y R4 forman un anillo de cinco o seis miembros compuesto de carbono, hidrógeno y un átomo de nitrógeno.

15 En otra realización de la presente invención, R3 y R4 forman un anillo de seis miembros compuesto de carbono, hidrógeno, un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno.

En otra realización, R4 es H, F, arilo, C(=O)
20 alquilo C₁-C₆, heterociclilo, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, C(=O) arilo C₁-C₆, donde cada uno de ellos puede estar

independientemente sustituido (excepto H y F) con uno o más de los siguientes sustituyentes, Cl, haloalquilo C₁-C₆, alcoxí C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀, y arilo (donde dicho arilo puede estar sustituido con uno o más
5 sustituyentes seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxí C₁-C₈).

En otra realización, R₄ es H o alquilo C₁-C₈ (donde dicho alquilo puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes
10 sustituyentes, Cl, haloalquilo C₁-C₆, alcoxí C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, y arilo (donde dicho arilo puede estar sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxí C₁-C₈).

En otra realización de la presente invención, R₅
15 es H, alquilo C₁-C₈, alquénilo C₂-C₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, o cicloalquilo C₃-C₈.

En otra realización de la presente invención, R₅
20 es H o alquilo C₁-C₈.

En otra realización de la presente invención, R₆ es H.

En otra realización de la presente invención, n es 0 o 1.

En otra realización de la presente invención, X es NR8 o S.

5 En otra realización de la presente invención, J es N.

En otra realización de la presente invención, R7 es H, F, Cl, Br, I, o alquilo C₁-C₈.

10 En otra realización de la presente invención, R7 es H.

En otra realización de la presente invención, R8 es H, OH, OC(=O) alquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H y OH)

15 con uno o más de los siguientes sustituyentes, arilo (donde dicho arilo puede estar sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de F, Cl, Br, I, alcoxi C₁-C₈), cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, F, Cl, Br, I, alcoxi C₁-C₆,

20 En otra realización de la invención:

(a) R1 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio

- C_1-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , alquiniloxi C_2-C_8 , alquiniltio C_2-C_8 , arilo, cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalqueniloxi C_3-C_8 , cicloalqueniltio C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquiltio C_3-C_8 , heterociclilo,
- 5 o alquilo $C_0-C_8-C(=O)OR_8$, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquiltio
- 10 C_1-C_6 , $S(=O)_{n1}$ alquilo C_1-C_6 (donde $n1=0-2$), $S(=O)_{n1}$ haloalquilo C_1-C_6 (donde $n=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR_9R_{10} y heterociclilo;
- 15 (b) R_2 es alquenilo C_2-C_8 , alqueniloxi C_2-C_8 , alqueniltio C_2-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , alquiniloxi C_2-C_8 , alquiniltio C_2-C_8 , arilo, cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalqueniloxi C_3-C_8 , cicloalqueniltio C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 ,
- 20 cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquiltio C_3-C_8 , heterociclilo, o alquilo $C_0-C_8-C(=O)OR_8$, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de

- los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}
- 5 haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo, y donde R₂ y R₅ pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros.
- 10 (c) R₃ es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
- 15 cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆,
- 20 alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo

C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$
 alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo
 C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10 y
 heterociclilo, y donde R3 y R4 pueden formar también un
 5 anillo de 4, 5 o 6 miembros;
 (d) R4 es alquenilo C_2-C_8 , alqueniloxi C_2-C_8 ,
 alqueniltio C_2-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , alquiltio
 C_1-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , alquiniloxi C_2-C_8 , alquiniltio
 C_2-C_8 , arilo, cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalqueniloxi C_3-
 10 C_8 , cicloalqueniltio C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 ,
 cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquiltio C_3-C_8 , H,
 heterociclilo, o alquilo $C_0-C_8-C(=O)OR_8$, donde cada uno
 de ellos puede estar independientemente sustituido
 (excepto H) con uno o más de los siguientes
 15 sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 ,
 alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 ,
 haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 ,
 $S(=O)_{n_1}$ alquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), $S(=O)_{n_1}$ haloalquilo
 C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$
 20 alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo
 C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10 y

heterocicclilo, y en donde R3 y R4 pueden formar también un anillo de 4, 5, o 6 miembros;

(e) R5 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterocicclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterocicclilo, y en donde R2 y R5 pueden formar también un anillo de 4, 5, o 6 miembros, y en donde R5 y R6 pueden formar también un anillo de 3, 4, 5, o 6 miembros;

- (f) R6 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, en donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes
- 10 sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n₁=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n₁=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O
- 15 alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo, y en donde R₅ y R₆ pueden formar también un anillo de 3, 4, 5, o 6 miembros;
- (g) n es 0 a 4;
- 20 (h) X es NR₈, O o S;
- (i) J es N o CR₇;

(k) R8 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o

(k) R8 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o

heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar
independientemente sustituido con uno o más de los
siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi
5 C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio
C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}
haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-
C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O)
haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, y
10 heterociclilo;

(1) R₉ es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈,
alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio
C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio
C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-
15 C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,
cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o
heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar
independientemente sustituido con uno o más de los
siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
20 alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi
C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio
C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}

haloalquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , y heterociclilo, y donde R_9 y R_{10} pueden formar también
5 un anillo de 4, 5 o 6 miembros; y
(m) R_{10} es alquenilo C_2-C_8 , alqueniloxi C_2-C_8 , alqueniltio C_2-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , alquiniloxi C_2-C_8 , alquiniltio C_2-C_8 , arilo, cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalqueniloxi C_3-C_8 ,
10 C_8 , cicloalqueniltio C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquiltio C_3-C_8 , o heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 ,
15 alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , $S(=O)_{n_1}$ alquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), $S(=O)_{n_1}$ haloalquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , y heterociclilo, y donde R_9 y R_{10} pueden formar también
20 un anillo de 4, 5 o 6 miembros.

En otra realización de la invención, R1 es un alcoxí C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, arilo, o heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes

5 sustituyentes F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxí C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxí C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆,

10 C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo.

En otra realización de la invención, R1 es un heterociclilo, que puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes

15 sustituyentes F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxí C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxí C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆,

20 C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo.

En otra realización de la invención, R1 es benzofuranilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo, benzoxazolilo, benzotienilo, benzotiazolilo cinolinilo, furanilo, indazolilo, indolilo, imidazolilo, 5 isoindolilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, oxazolinilo, oxazolilo, ftalazinilo, pirazinilo, pirazolinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinoxalinilo, 1,2,3,4- 10 tetrazolilo, tiazolinilo, tiazolilo, tienilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,3-triazolilo, y 1,2,4-triazolilo, que puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo 15 C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, 20 hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo.

En otra realización de la invención, R1 es piridilo, que puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆,
5 alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo
10 C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo.

En otra realización de la invención, R1 es piridilo, que puede estar independientemente sustituido con uno o más haloalquilos C₁-C₆.

En otra realización de la invención, R1 es un
15 piridilo sustituido con CF₃.

En otra realización de la invención, R2 es alquilo C₁-C₈, que puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆,
20 alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂

haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10 y heterociclilo.

En otra realización de la invención, R3 es un
5 alcoxí C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , arilo, cicloalquénilo C_3-C_8 ,
cicloalquénilo C_3-C_8 , cicloalquéniltio C_3-C_8 ,
cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalcoxí C_3-C_8 , cicloalquiltio
 C_3-C_8 , H, heterociclilo, o alquilo $C_0-C_8-C(=O)OR_8$, donde
cada uno de ellos puede estar independientemente
10 sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes
sustituyentes F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 ,
alquénilo C_2-C_6 , alquínilo C_2-C_6 , alcoxí C_1-C_6 ,
haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxí C_1-C_6 , $S(=O)_{n1}$ alquilo C_1-C_6
 C_6 (donde $n1=0-2$), $S(=O)_{n1}$ haloalquilo C_1-C_6 (donde
15 $n1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 ,
 $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo,
hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10 y heterociclilo, también
R3 y R4 pueden formar un anillo de 4, 5, o 6 miembros.

En otra realización de la invención, R4 es un
20 alcoxí C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , arilo, cicloalquénilo C_3-C_8 ,
cicloalquénilo C_3-C_8 , cicloalquéniltio C_3-C_8 ,
cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalcoxí C_3-C_8 , cicloalquiltio

C₃-C₈, H, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes sustituyentes F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆,
5 alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n₁=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n₁=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo,
10 hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo, también R₃ y R₄ pueden formar un anillo de 4, 5 o 6 miembros.

En otra realización de la invención, X es S.

En otra realización de la invención, R₅ y R₆ se seleccionan de manera independiente de H, metilo,
15 etilo, F, Cl, y Br.

En otra realización de la invención, n es 1, R₅ es CH₃ y R₆ es H.

Mientras se han expresado estas realizaciones, son posibles otras realizaciones y combinaciones de estas
20 realizaciones expresadas.

En todo el presente documento, todas las temperaturas se indican en grados Celsius, y todos los

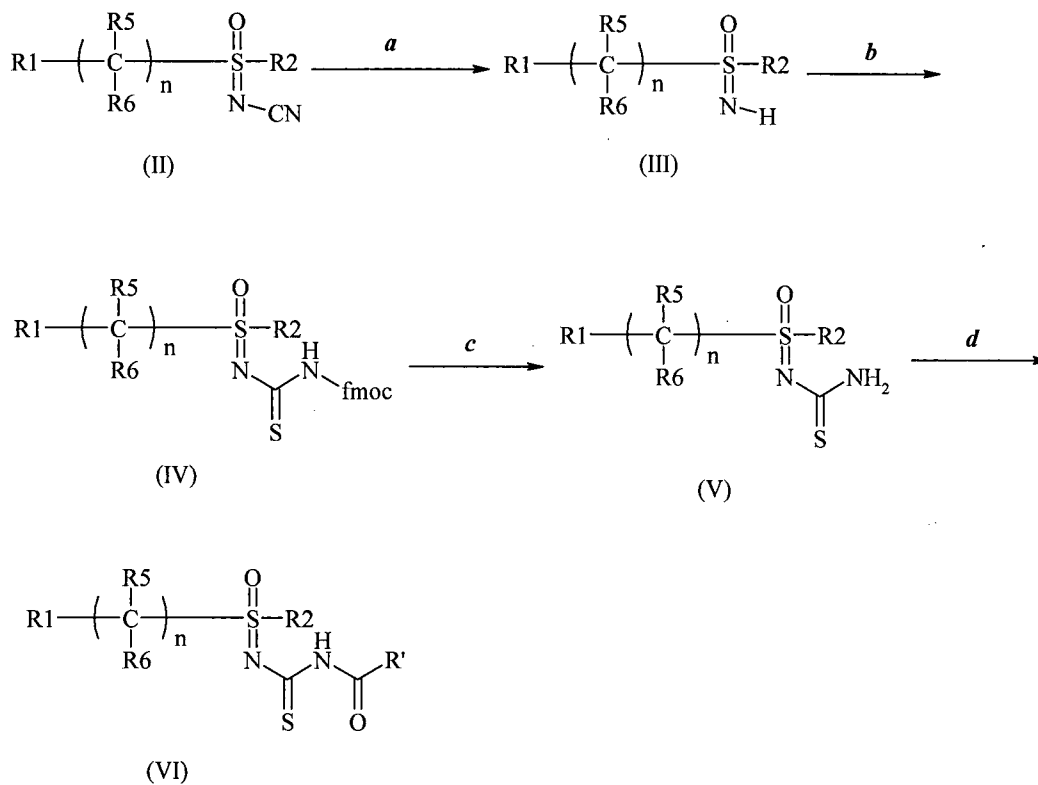
porcentajes se expresan en porcentajes en peso a menos que se indique de otro modo.

Los compuestos de la presente invención se pueden preparar de diversas maneras. Una manera general
5 consiste en comenzar con una molécula formada como en WO 2007/095229 A2, titulado "Insecticidal N-substituted (6-haloalkylpyridin-3-yl)alkyl sulfoximines" publicado el 23 de agosto de 2007, y seguir los métodos generales ilustrados en los esquemas A-F a continuación.

10 Los compuestos de la fórmula (**I**), en la que R1, R2, R4, R5, R6, y n son como se han definido anteriormente y en donde X=S, J=N, y R3 es H, se pueden preparar mediante los métodos ilustrados en el Esquema A.

15

Esquema A



En el paso **a** del Esquema A, los compuestos de la fórmula (II) se pueden convertir a compuestos de fórmula (III) de acuerdo con lo conocido en la técnica

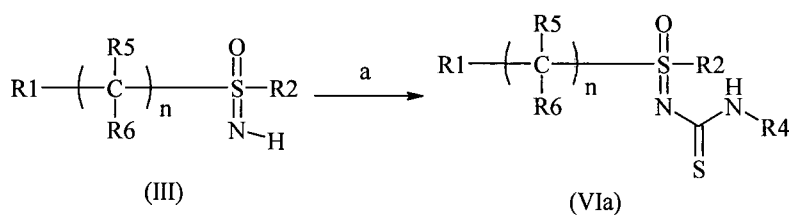
5 (por ejemplo, véase *Org. Lett.* **2007**, 9, 3809) cuando se tratan con anhídrido trifluoracético en un solvente aprótico polar como, por ejemplo, diclorometano (CH₂Cl₂) seguido por una base como, por ejemplo, carbonato de potasio en un solvente prótico polar como,

10 por ejemplo, metanol. Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde -20°C

hasta 50°C y se completan generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales. Ciano sulfoximina (II) (también conocida como "sulfoxaflor") se puede preparar
5 mediante métodos conocidos en la técnica (por ejemplo, véase WO 2007095229 A2). En el paso **b** del Esquema A, los compuestos de fórmula (III) se dejan reaccionar con isotiocianato de 9-fluorenilmetoxycarbonilo (Fmoc) en una mezcla de solventes apróticos polares como, por
10 ejemplo, tetrahidrofurano (THF) y *N,N*-dimetilformamida (DMF) para proporcionar compuestos de fórmula (IV) como se sabe en la técnica (por ejemplo, véase *Heterocycles* **1998**, 49, 181). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 100°C y se
15 completan generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales. En el paso **c** del Esquema A, los compuestos de fórmula (IV) se pueden tratar con una base como, por ejemplo, piperidina, en un solvente
20 aprótico polar como, por ejemplo, DMF para proporcionar compuestos de fórmula (V). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde -20°C

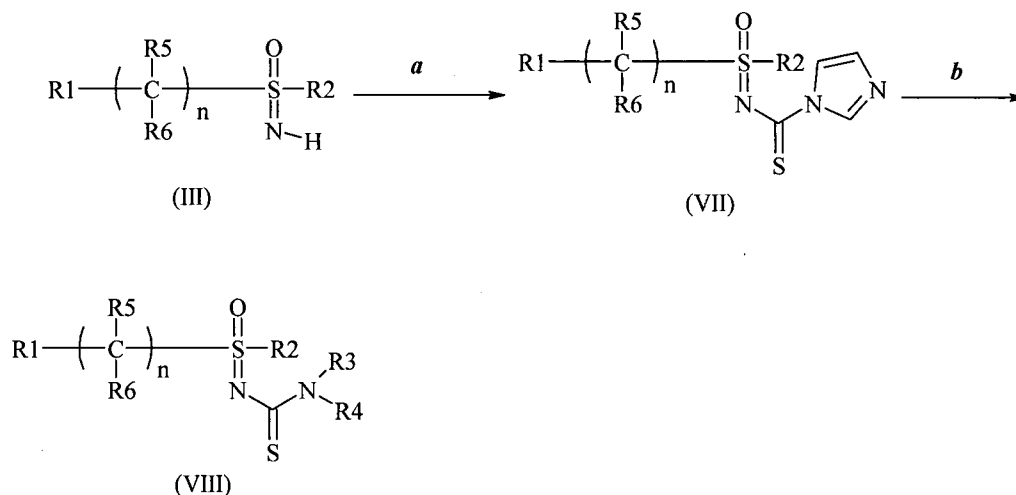
hasta 50°C y se completan generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales. En el paso **d** del Esquema A, los compuestos de fórmula (V) se pueden
5 dejar reaccionar con un cloruro de ácido como, por ejemplo, cloruro de acetilo en un solvente orgánico como, por ejemplo, acetona y en presencia de una base como, por ejemplo, trietiloamina para proporcionar compuestos de fórmula (VI) como se sabe en la técnica
10 (por ejemplo, véase *Inorg. Chem. Commun.* **2000**, 3, 630). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C a 100°C y se completan generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos
15 convencionales.

Los compuestos de fórmula (**I**), en donde R1, R2, R4, R5, R6, y n son como se han definido anteriormente y en donde X=S, J=N, y R3 es H, se pueden preparar mediante los métodos ilustrados en el Esquema B.



En el paso **a** del Esquema B, los compuestos de fórmula (III) se tratan con un isotiocianato como, por ejemplo, isotiocianato de etilo en una mezcla de
 5 solventes apróticos polares como, por ejemplo, THF y DMF para proporcionar compuestos de fórmula (IVa) de acuerdo con lo descrito en el Esquema A. Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 100°C y se completan
 10 generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales.

Los compuestos de fórmula (I), en donde R1, R2, R3, R4, R5, R6, y n son como se han definido
 15 anteriormente y en donde X=S y J=N, se pueden preparar mediante los métodos ilustrados en el Esquema C.

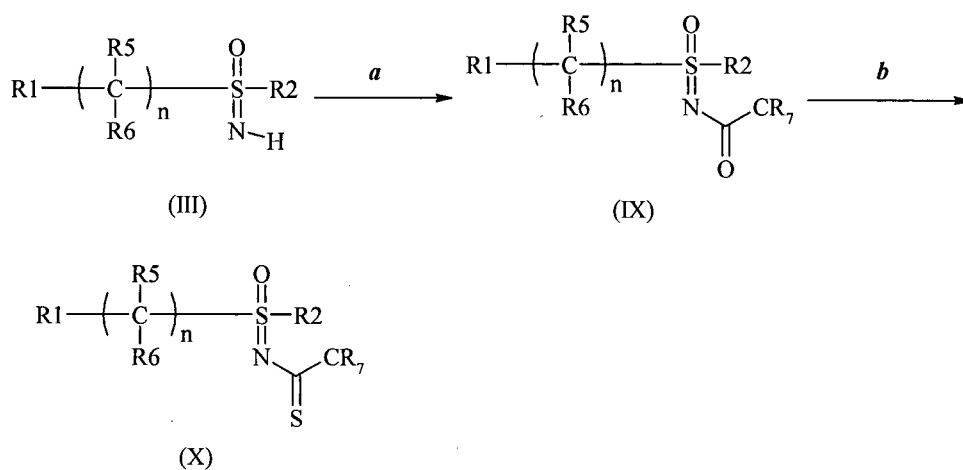
Esquema C

En el paso **a** del Esquema C, los compuestos de fórmula (III) se pueden hacer reaccionar con diimidazol de tiocarbonilo en un solvente orgánico como, por ejemplo, acetonitrilo para proporcionar compuestos de fórmula (VII) como se sabe en la técnica (por ejemplo véase *Letters in Drug Design and Discovery* **2007**, 4, 318). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 100°C y se completan generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales. En el paso **b** del Esquema C, los compuestos de fórmula (VII) se pueden tratar con una amina como, por ejemplo, dimetilamina en un solvente

orgánico como, por ejemplo, acetonitrilo para proporcionar compuestos de fórmula (VIII). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 100°C y se completan
5 generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales.

Los compuestos de fórmula (I), en donde R1, R2, R5, R6, R7 y n son como se han definido anteriormente y
10 en donde X=O o S, se pueden preparar mediante los métodos ilustrados en el Esquema D.

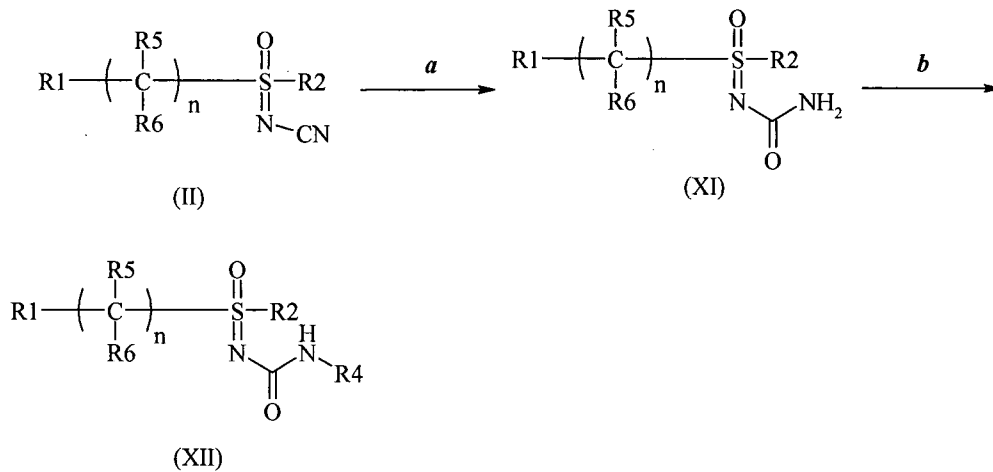
Esquema D



En el paso **a** del Esquema D, los compuestos de
15 fórmula (III) se pueden tratar con un anhídrido como,

por ejemplo, anhídrido acético en presencia de un
solvente orgánico como, por ejemplo, piridina para
proporcionar compuestos de fórmula (IX) como se sabe en
la técnica (por ejemplo véase *Heterocycles* **1998**, 49,
5 181). Las reacciones se realizan generalmente a
temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 100°C y se
completan generalmente en una a 18 horas. Los
compuestos se pueden recuperar y purificar mediante
métodos convencionales. En el paso **b** del Esquema D, los
10 compuestos de fórmula (IX) se pueden tionar mediante el
tratamiento con reactivos como, por ejemplo, el
reactivo de Lawesson en solventes orgánicos como, por
ejemplo, 1,4-dioxano para proporcionar compuestos de
fórmula (X). Las reacciones se realizan generalmente a
15 temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 100°C y se
completan generalmente en una a 18 horas. Los
compuestos se pueden recuperar y purificar mediante
métodos convencionales.

Los compuestos de fórmula (**I**), en donde R1, R2,
20 R4, R5, R6, y n son como se han definido anteriormente
y en donde X=O, J=N, y R3 es H, se pueden preparar
mediante los métodos ilustrados en el Esquema E.

Esquema E

En el paso **a** del Esquema E, los compuestos de fórmula (II) se pueden hidrolizar en presencia de un

5 ácido fuerte como, por ejemplo, ácido sulfúrico concentrado en un solvente orgánico como, por ejemplo, acetonitrilo para proporcionar compuestos de fórmula (XI). Las reacciones se realizan generalmente a

temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 100°C y se

10 completan generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales. En el paso **b** del Esquema E, los compuestos de fórmula (XI) se pueden tratar con un

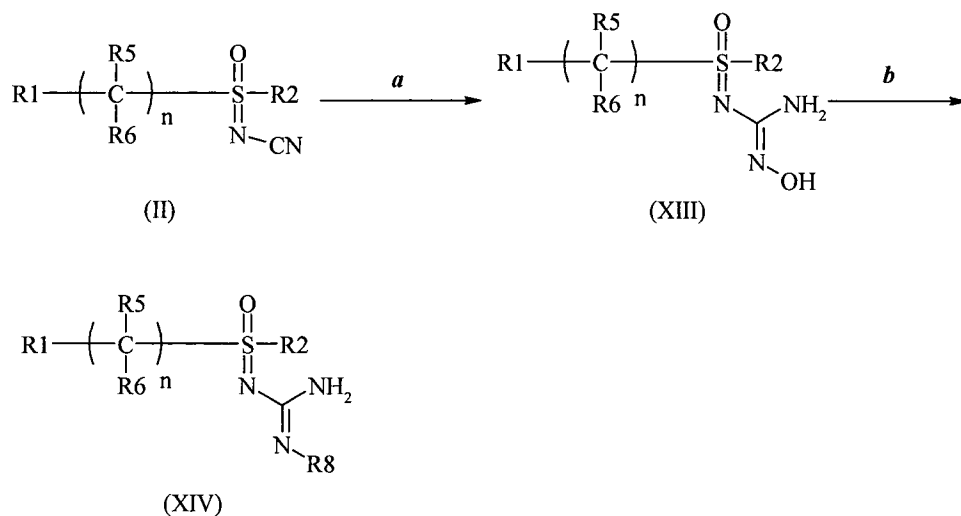
cloruro de ácido como, por ejemplo, cloruro de acetilo

15 en un solvente orgánico no polar como, por ejemplo,

benceno anhidro para proporcionar compuestos de fórmula (XII). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 150°C y se completan generalmente en una a 18 horas. Los
 5 compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales.

Los compuestos de fórmula (I), en donde R1, R2, R5, R6, R8, y n son como se han definido anteriormente and en donde X=NR8 y J=N, se pueden preparar mediante
 10 los métodos ilustrados en el Esquema F.

Esquema F



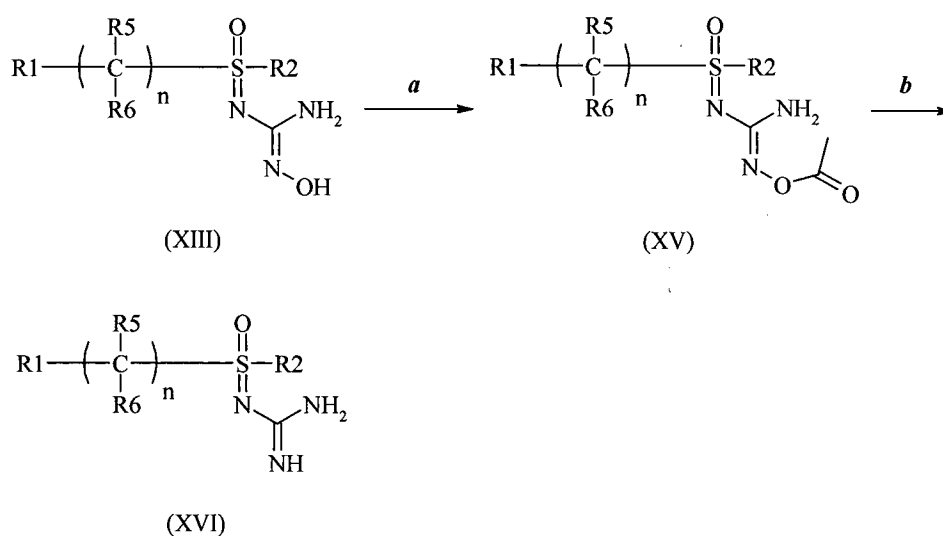
En el paso **a** del Esquema F, los compuestos de fórmula (II) se pueden dejar reaccionar con un

nucleófilo como, por ejemplo, clorhidrato de hidroxilamina en presencia de una base como, por ejemplo, carbonato de sodio en un sistema de solventes próticos polares mezclados como, por ejemplo, etanol y
5 agua para proporcionar compuestos de fórmula (XIII) como se sabe en la técnica (por ejemplo véase *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1* **2001**, 1321). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 150°C y se completan generalmente en una a 18
10 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales. De manera similar, los compuestos de fórmula (IX) en el Esquema D se pueden convertir a las oximas correspondientes bajo estas condiciones. En el paso **b** del Esquema F, los compuestos
15 de fórmula (XIII) se pueden dejar reaccionar con bases como, por ejemplo, hidruro de sodio o carbonato de potasio en solventes apróticos polares como, por ejemplo, THF o acetonitrilo en presencia de un haluro de alquilo como, por ejemplo, yoduro de metilo para
20 proporcionar compuestos de fórmula (XIV). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 150°C y se completan

generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales.

Los compuestos de fórmula (I), en donde R1, R2, R5, R6, y n son como se han definido anteriormente y en donde X=NH y J=N, se pueden preparar mediante los métodos ilustrados en el Esquema G.

Esquema G



En el paso **a** del Esquema G, los compuestos de fórmula (XIII) se pueden dejar reaccionar con un anhídrido como, por ejemplo, anhídrido acético en presencia de un ácido como, por ejemplo, ácido acético glacial para proporcionar compuestos de fórmula (XV).

Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 150°C y se completan generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos
5 convencionales. En el paso **b** del Esquema G, los compuestos de fórmula (XV) se pueden hidrogenar en presencia de un catalizador como, por ejemplo, paladio sobre carbono en un solvente prótico polar como, por ejemplo, ácido acético glacial y un anhídrido como, por
10 ejemplo, anhídrido acético para proporcionar compuestos de fórmula (XVI) como se sabe en la técnica (por ejemplo véase *Synth. Commun.* **2007**, 37, 4157). Las reacciones se realizan generalmente a temperaturas que oscilan desde 0°C hasta 150°C y se completan
15 generalmente en una a 18 horas. Los compuestos se pueden recuperar y purificar mediante métodos convencionales.

Ejemplos

Los ejemplos se proveen a los efectos ilustrativos
20 y no se deben interpretar como limitativos de la

invención descrita en este documento a sólo las realizaciones descritas en estos ejemplos.

Lista de abreviaturas

tetrahidrofurano

THF

5 *N,N*-dimetilformamida

DMF

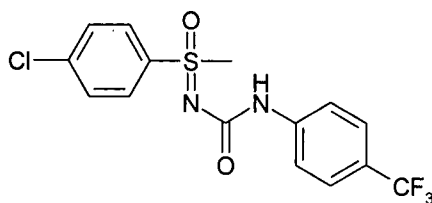
espectrometría de masas con ionización por electronebulización ESIMS

humedad relativa

RH

Ejemplo 1: Preparación de *N*-[(4-

10 clorofenil) (metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-*N'*-[4-(trifluormetil)fenil]urea (1).

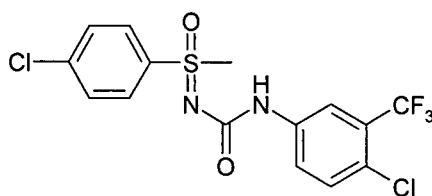


Se disolvió 1-cloro-4-(metilsulfonimidoil)benceno (0,37 g, 1,9 mmol) en CH₂Cl₂ (16 mL) a temperatura ambiente. A esta solución, se agregó 60% de hidruro de

15

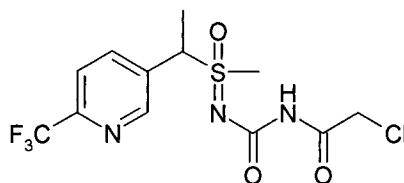
sodio en aceite mineral (68 mg, 1.7 mmol) lo cual causó un burbujeo. Cuando el burbujeo amainó, se agregó 4-trifluormetil fenil isocianato (0,42 g, 1,9 mmol) y se dejó agitar la mezcla durante 2 h a temperatura ambiente. Luego, se templó la reacción con salmuera (10 mL) y la mezcla se extrajo con acetato de etilo (3 x 10 mL). Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (MgSO₄), se filtraron, y se concentraron *in vacuo* para proveer N-[(4-clorofenil) (metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-N'-[4-(trifluormetil)fenil]urea (**1**) en forma de sólido blanco (0,466 g, 76%): pf 131-134°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 7,95 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,59 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,52 (s, 4H), 3,39 (s, 3H); ESIMS *m/z* 376 ([M]⁺).

Ejemplo 2: Preparación de N-[(4-clorofenil) (metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-N'-[4-cloro-3-(trifluormetilo)fenil]urea (**2**).

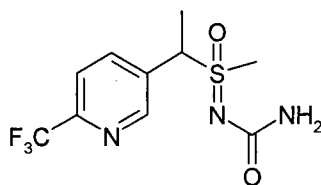


Se sintetizó *N*-[(4-clorofenil)(metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-*N'*-[4-cloro-3-(trifluormetil)fenil]urea (2) a partir de 1-cloro-4-(metilsulfonimidoil)benceno de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 1. El compuesto se aisló en forma de aceite incoloro (0,319 g, 54%): ^1H RMN (300 MHz, CDCl_3) δ 7,95 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,77 (br s, 1H), 7,59 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,54 (br s, 1H), 7,36 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 3,36 (s, 3H); ESIMS m/z 410 ($[\text{M}]^+$).

Ejemplo 3: Preparación de *N*-(cloroacetil)-*N'*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)urea (3).



Paso A. Preparación de *N*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetilo)piridin-3-il] etil}- λ^4 -sulfaniliden)urea.

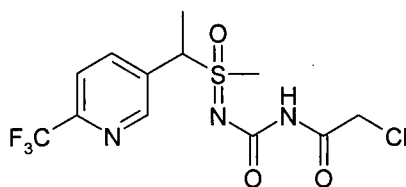


A una solución vigorosamente agitada de metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfanilidencianamida (100 g, 0,36 mol) en acetonitrilo
5 (500 mL) se agregó por goteo ácido sulfúrico concentrado (25 mL) a una velocidad como para mantener la temperatura por debajo de 40°C. (Un poco de enfriamiento externo se necesitó inicialmente). Una vez completada la adición, la mezcla de reacción (ahora
10 nubosa, con algo de aceite separado) se agitó durante otra hora a temperatura ambiente hasta que se consumió el material de partida. Luego, se enfrió la mezcla hasta 5°C, y se agregó 50% de NaOH por goteo (exotérmico) hasta que la solución se tornó neutra
15 mediante papel de pH. El sólido resultante se filtró, y el filtrado se transfirió a un embudo de separación. Las capas se separaron y la capa orgánica se lavó con salmuera, se secó (MgSO₄), se filtró, y se concentró *in vacuo* para proporcionar N-(metil(óxido){1-[6-

(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)urea
 en forma de sólido blanco (99,4 g, 93%): ESIMS m/z 296
 ($[M+H]^+$).

Paso B. Preparación de N-(cloroacetil)-N'-(

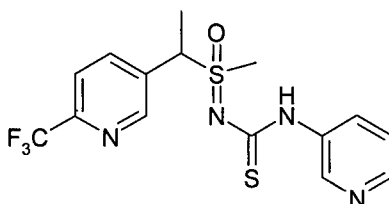
- 5 (metil(óxido){1-[6-(trifluormetil) piridin-3-il]etil}-
 λ^4 -sulfaniliden)urea (3).



- Una suspensión de N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetilo)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)urea
 10 (2,0 g, 6,78 mmol) y clorocloruro de acetilo (0,92 g, 8,14 mmol) en benceno anhidro (50 mL) se calentó hasta reflujo bajo N_2 durante 2 h. La mezcla de reacción se enfrió externamente con un baño de agua helada y se agregó hexano (100 mL) a fin de precipitar el producto.
 15 La mezcla de reacción se agitó durante 15 minutos adicionales, y el sólido se recolectó mediante filtración por succión y se enjuagó con éter para proveer N-(cloroacetil)-N'-(metil(óxido){1-[6-

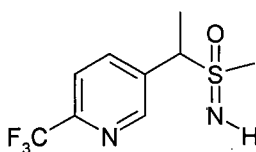
(trifluormetilo)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)urea
 (3) en forma de sólido blanco (1,37 g, 54%): pf 178-
 179°C; ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ (1:1 mezcla de dos
 diaestereómeros) 10,4 (s, NH), 8,9 (m, 1H), 8,3 (m,
 5 1H), 8,0 (m, 1H), 5,1 (q, 1H), 4,5 (s, 2H), 3,4 (s,
 3H), 1,8 (d, 3H); ESIMS m/z 372 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 4: Preparación de N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)-N'-piridin-3-iltiourea (4).



10

Paso A. Preparación de 5-[1-(metilsulfonimidoil) etil]-2-(trifluormetilo)piridina

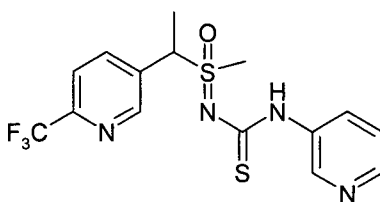


A una solución agitada de metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden

15

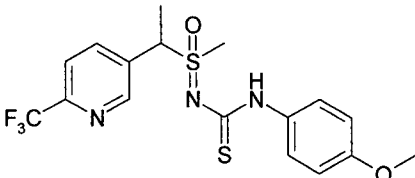
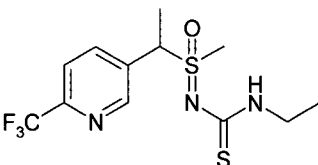
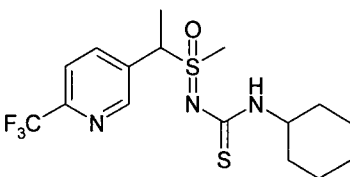
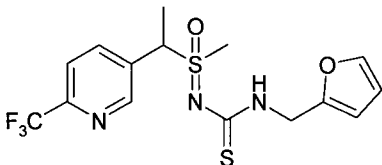
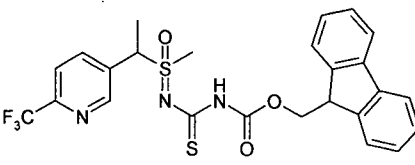
cianamida (5 g, 18 mmol) en CH₂Cl₂ (300 mL) a 0°C, se
agregó anhídrido trifluoracético (7,5 mL, 54 mmol). La
mezcla se dejó reaccionar a 25°C hasta que el material
de partida se consumió completamente. La mezcla de
5 reacción se concentró *in vacuo*, se disolvió en metanol
(125 mL) y se trató con carbonato de potasio (12,5 g,
90 mmol). La mezcla se dejó agitar a 25°C hasta que se
consumió el material de partida. La mezcla de reacción
bruta se filtró, concentró y purificó mediante
10 cromatografía (acetona-hexanos) para proveer 5-[1-
(metilsulfonimidoil)etil]-2-(trifluormetilo)piridina en
forma de sólido blanco (3,5 g, 77%): ESIMS *m/z* 253
([M+H]⁺).

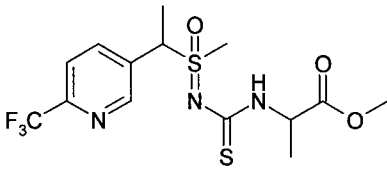
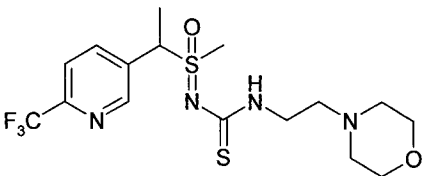
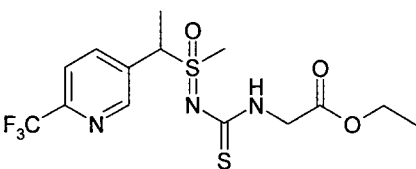
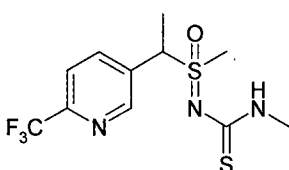
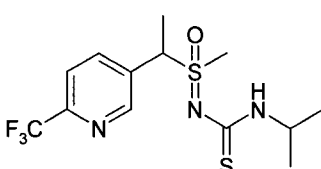
Paso B. Preparación de N-(metil(óxido){1-[6-
15 (trifluormetil)piridin-3-il] etil}-λ⁴-sulfaniliden)-N'-
piridin-3-iltiourea (4).

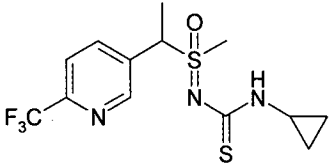
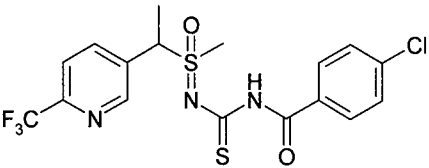
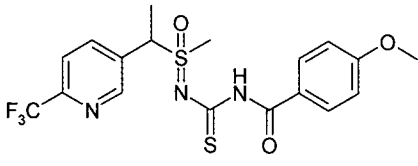
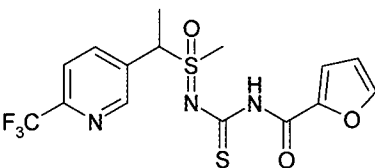
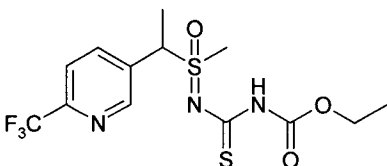


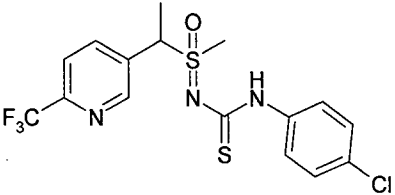
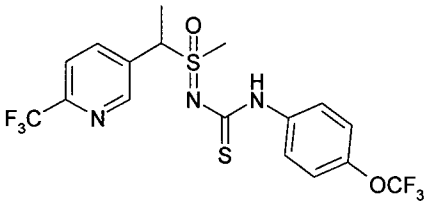
En un frasco de base redonda de 50 mL, se cargó una vara de agitación magnética, se disolvió 5-[1-(metilsulfonimidoil)etil]-2-(trifluormetil)piridina (0,200 g, 0,793 mmol) en THF (4,17 mL) y DMF (0,83 mL) a 25°C. A continuación, se agregó 3-isotiocianatopiridina (0,132 mL, 1,11 mmol) al frasco de reacción. Luego de la adición, la reacción se entibió hasta 80°C durante 12 h. Una vez completada la reacción, la mezcla se diluyó con acetato de etilo y salmuera. Se separaron las capas y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se combinaron y lavaron con salmuera, se secaron (Na₂SO₄), se filtraron y concentraron *in vacuo*. El material bruto se purificó mediante HPLC de fase inversa levigando con mezclas de acetonitrilo-agua para proveer *N*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden)-*N'*-piridin-3-iltiourea (**4**) en forma de sólido blanco (0,191 g, 62%): pf 92-94°C; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,82 y 8,76 (s, 1H), 8,5 (m, 2H), 8,07 (m, 2H), 7,74 (m, 1H), 7,30 (m, 1H), 5,89 & 5,61 (m, 1H), 3,55 & 3,35 (s, 3H), 1,94 y 1,85 (m, 3H); ESIMS *m/z* 389 ([M+H]⁺).

Tabla 1: Compuestos insecticidas

Nro. de compuesto	Estructura	Vía	Caracterización
5		A	sólido blanco; pf 167-169°C; ESIMS m/z 418 ($[M+H]^+$)
6		A	espuma color amarillo claro; ESIMS m/z 340 ($[M+H]^+$)
7		A	sólido blanco; pf 170-172°C; ESIMS m/z 394 ($[M+H]^+$)
8		A	aceite marrón claro; ESIMS m/z 392 ($[M+H]^+$)
9		A	sólido amarillo; pf 105-107°C; ESIMS m/z 534

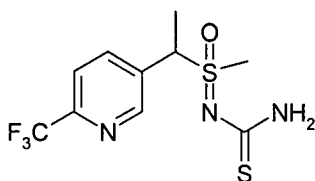
			$([M+H]^+)$
10		A	semisólido marrón claro; ESIMS m/z 398 $([M+H]^+)$
11		A	aceite amarillo dorado; ESIMS m/z 425 $([M+H]^+)$
12		A	semisólido naranja; ESIMS m/z 398 $([M+H]^+)$
13		A	semisólido blanco; ESIMS m/z 326 $([M+H]^+)$
14		A	sólido blanco; pf 153-155°C; ESIMS m/z 354 $([M+H]^+)$

15		A	sólido blancuzco; pf 154-156°C; ESIMS m/z 352 ([M+H] ⁺)
16		A	semisólido amarillo claro; ESIMS m/z 450 ([M+H] ⁺)
17		A	semisólido amarillo claro; ESIMS m/z 446 ([M+H] ⁺)
18		A	semisólido amarillo claro; ESIMS m/z 406 ([M+H] ⁺)
19		A	sólido blanco; ESIMS m/z 384 [M+H] ⁺)

20		A	sólido blanco; pf 181-183°C; ESIMS m/z 422 ([M+H] ⁺)
21		A	sólido blancuzco; pf 149-151°C; ESIMS m/z 472 ([M+H] ⁺)

A = Vía utilizada para el ejemplo 4

Ejemplo 5: Preparación de N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden)tiourea (22).



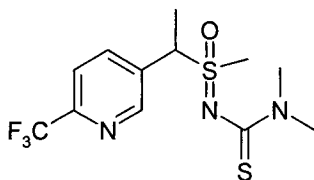
5

El compuesto **9** (0,100 g, 0,187 mmol) se disolvió con agitación en 20% de piperidina/DMF (2 mL) a 25°C. Una vez completada la reacción, la mezcla se concentró

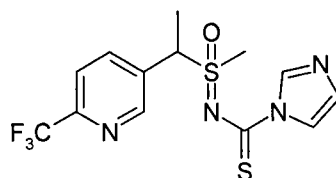
in vacuo. El material bruto se purificó mediante HPLC de fase inversa levigando con mezclas de acetonitrilo-agua para proveer *N*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)

- 5 tiourea (**22**) en forma de sólido blancuzco (0,043 g, 74%): pf 145-147°C; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,86 (s, 1H), 8,10 (m, 1H), 7,76 (m, 1H), 6,09 y 5,94 (m, 1H), 3,52 y 3,24 (s, 3H), 1,93 y 1,83 (d, $J = 7,3\text{Hz}$, 3H); ESIMS m/z 312
- 10 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 6: Preparación de *N,N*-dimetil-*N'*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetilo)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)tiourea (**23**)

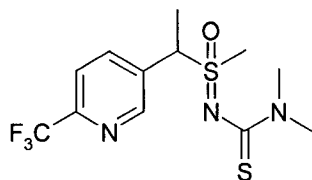


- 15 Paso A. Preparación de *N*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)-1*H*-imidazol-1-carbotioamida



Se disolvió 5-[1-(metilsulfonimidoil)etil]-2-(trifluormetil)piridina (2,1 g, 8,3 mmol) en acetonitrilo (17 mL) a temperatura ambiente. A esta
 5 mezcla, se agregó diimidazol de tiocarbonilo (3 g, 17 mmol) en una sola porción. La mezcla se calentó hasta 80°C durante 12 h. Luego, la mezcla se filtró a los efectos de eliminar todos los sólidos y el filtrado se concentró *in vacuo*. El residuo se redisolvió en CH₂Cl₂
 10 y se lavó con salmuera. Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (Na₂SO₄), filtraron, y concentraron *in vacuo* para proveer N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden)-1H-imidazol-1-carbotioamida en forma de aceite marrón
 15 (2,78 g, 93%) que se utilizó sin purificación adicional: ESIMS *m/z* 363 ([M+H]⁺).

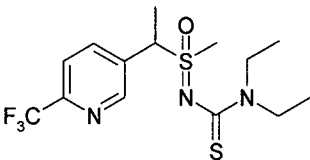
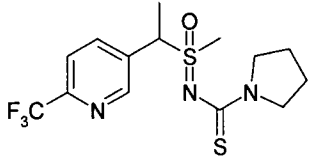
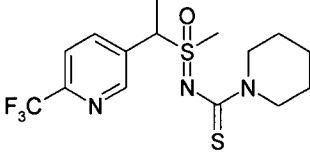
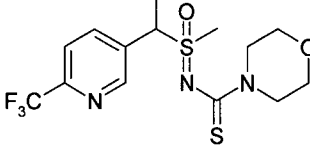
Paso B. Preparación de N,N-dimetil-N'-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden)tiourea (23).



Se disolvió *N*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)-1*H*-imidazol-1-carbotioamida (0,088 g, 0,243 mmol) en acetonitrilo (0,486 mL) con agitación a temperatura ambiente. La mezcla se enfrió luego en un baño de hielo. A esta solución enfriada se agregó 40% de dimetilamina en agua (0,031 mL, 0,243 mmol). Una vez completada la reacción, se filtraron todos los sólidos de la mezcla y el filtrado se concentró *in vacuo*. El material bruto restante se redisolvió en acetato de etilo y se lavó con HCl 1 N y salmuera. La capa orgánica se secó luego (Na_2SO_4), se filtró y concentró *in vacuo* para proveer *N,N*-dimetil-*N'*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)tiourea (**23**) en forma de aceite amarillo (0,044 g, 54%): ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,83 (s, 1H), 8,08 (m, 1H), 7,74 (m, 1H), 5,97 y 5,73 (m, 1H), 3,52 y 3,41 (s, 3H), 3,34 y 3,25 (s, 3H), 3,26 y 3,03

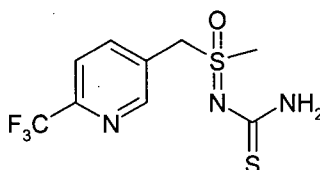
(s, 3H), 1,92 y 1,81 (d, $J = 7,3\text{Hz}$, 3H); ESIMS m/z 340 ($[M+H]^+$).

Tabla 2: Compuestos insecticidas

Comp. Nro.	Estructura	Vía	Caracterización
24		B	aceite marrón; ESIMS m/z 368 ($[M+H]^+$)
25		B	aceite amarillo; ESIMS m/z 366 ($[M+H]^+$)
26		B	aceite amarillo; ESIMS m/z 379 ($[M+H]^+$)
27		B	aceite amarillo; ESIMS m/z 381 ($[M+H]^+$)

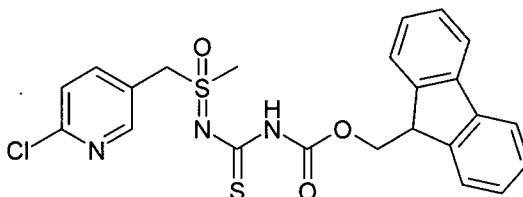
B = vía utilizada en el Ejemplo 6

Ejemplo 8: Preparación de N-(metil(óxido){[6-(trifluormetil)piridin-3-il]metil}- λ^4 -sulfaniliden)tiourea (29).



5 Se sintetizó N-(metil(óxido){[6-(trifluormetil)piridin-3-il]metil}- λ^4 -sulfaniliden)tiourea (29) a partir del compuesto 28 de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 5. El compuesto se aisló en forma de sólido blanco (8,18 g,
10 92%): pf 107-109°C; ^1H RMN (300 MHz, CDCl_3) δ 8,82 (s, 1H), 8,11 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,76 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 6,36 (br s, 1H), 6,19 (br s, 1H), 5,52 (d, $J = 13,5$ Hz, 1H), 5,06 (d, $J = 13,5$ Hz, 1H), 3,39 (s, 3H); ESIMS m/z 340 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 9: Preparación de 9H-fluoren-9-ilmetil{[(6-cloropiridin-3-il)metil](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]amino}carbonotiooilcarbamato (30).

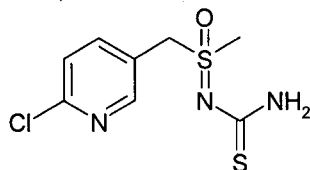


5 Se sintetizó 9H-fluoren-9-ilmetil{[(6-cloropiridin-3-il)metil](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]amino}carbonotiooilcarbamato (30) a partir de la correspondiente sulfoximida de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 4. El compuesto

10 se aisló as a espuma color amarillo claro (14,8 g, 92%): pf 98-101°C; ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 11,15 (s, 1H), 8,56 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 8,05 (dd, $J = 2,3, 8,2$ Hz, 1H), 7,90 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,84 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,59 (d, $J = 8,2$ Hz, 1H), 7,44 (t, $J = 7,1$ Hz, 2H), 7,34 (dt, $J = 1,0, 7,6$ Hz, 2H), 5,09 (s, 2H),

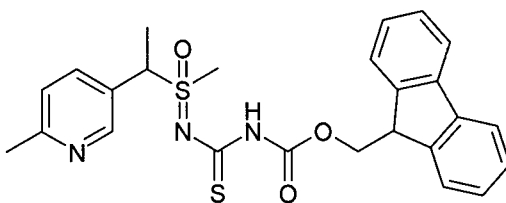
15 4,32-4,26 (m, 3H), 3,61 (s, 3H); ESIMS m/z 486 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 10: Preparación de N-[[[6-cloropiridin-3-il)metil](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]tiourea (31).



Se sintetizó N-[[[6-cloropiridin-3-il)metil](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]tiourea (31) a partir del compuesto 30 de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 5. El compuesto se aisló en forma de sólido naranja claro (4,96 g, 62%): pf 155-158°C; ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,51 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 8,12 (br s, 1H), 7,79 (m, 2H), 7,61 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,36 (s, 3H); ESIMS m/z 264 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 11: Preparación de 9H-fluoren-9-ilmetil
({metil[1-(6-metilpiridin-3-il)etil]óxido- λ^4 -
sulfaniliden}amino)carbonotioilcarbamato (32).



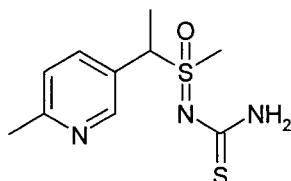
Se sintetizó 9H-fluoren-9-ilmetil({metil[1-(6-metilpiridin-3-il)etil]óxido- λ^4 -sulfaniliden}amino) carbonotiooilcarbamato (**32**) a partir de la

5 correspondiente sulfoximida de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 4. El compuesto se aisló en forma de espuma color tostado (2,61 g, 54%): pf 101-106°C; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 8,59 (dd, $J = 2,3, 5,5$ Hz, 1H), 8,30 (d, $J = 14,1$ Hz, 1H), 8,06 (dd, $J = 2,3, 8,2$ Hz, 0,5H), 7,85 (dd, $J = 2,5, 8,1$ Hz, 0,5H), 7,78 (d, $J = 7,3$ Hz, 2H), 7,59 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,42 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,33 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,23 (d, $J = 8,3$ Hz, 0,5H), 7,20 (d, $J = 8,1$ Hz, 0,5H), 5,16 (q, $J = 7,1$ Hz, 0,5H), 4,71 (q, $J = 7,1$ Hz, 0,5H), 4,51-4,43 (m, 2H), 4,26-4,23 (m, 1H), 3,34 (s, 3H), 2,59 (s, 1,5H), 2,56 (s, 1,5H), 1,93 (d, $J = 7,1$ Hz, 1,5H), 1,87 (d, $J = 7,1$ Hz, 1,5H); ESIMS m/z 480 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

10

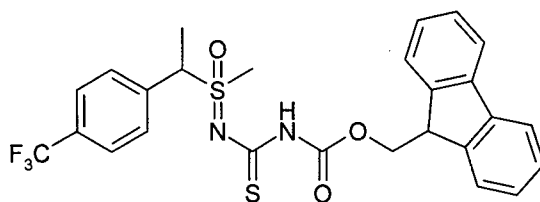
15

Ejemplo 12: Preparación de *N*-{metil[1-(6-metilpiridin-3-il)etil]óxido- λ^4 -sulfaniliden}-tiourea (33).



Se sintetizó *N*-{metil[1-(6-metilpiridin-3-il)etil]óxido- λ^4 -sulfaniliden}-tiourea (33) a partir del compuesto 32 de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 5. El compuesto se aisló en forma de sólido color tostado (0,78 g, 57%): pf 137-140°C; ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,57 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,00 (d, J = 11,4 Hz, 1H), 7,91-7,83 (m, 2H), 7,30 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 5,28 (q, J = 7,1 Hz, 1H), 3,36 (s, 1,5H), 3,34 (s, 1,5H), 2,48 (s, 1,5 H), 2,48 (s, 1,5H), 1,73 (d, J = 6,3 Hz, 1,5H), 1,72 (d, J = 6,6 Hz, 1,5H); ESIMS m/z 258 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

15 Ejemplo 13: Preparación de 9*H*-fluoren-9-ilmetil[(metil(óxido){1-[4-(trifluormetil)fenil]-etil}- λ^4 -sulfaniliden)amino]carbonotioilcarbamato (34).



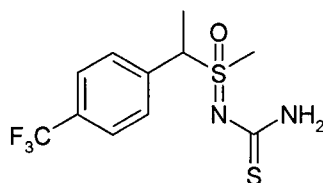
Se sintetizó 9H-fluoren-9-ilmetil [(metil(óxido) {1-[4-(trifluormetil)fenil]-etil}-λ⁴-sulfaniliden) amino]carbonotioilcarbamato (**34**) a partir de la

5 correspondiente sulfoximida de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 4. El compuesto se aisló en forma de espuma amarilla (4,19 g, 99%): pf 86-93°C; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 8,29 (br s, 0,5H), 8,24 (br s, 0,5H), 7,80-7,75 (m, 3,5H), 7,65 (d, J =

10 8,3 Hz, 1H), 7,60-7,58 (m, 2,5H), 7,44-7,38 (m, 2,5H), 7,35-7,29 (m, 2,5H), 5,32 (q, J = 7,3 Hz, 0,5H), 4,86 (q, J = 6,8 Hz, 0,5H), 4,52-4,44 (m, 2H), 4,26-4,23 (m, 1H), 3,32 (s, 1,5H), 3,32 (s, 1,5H), 1,94 (d, J = 7,1 Hz, 1,5H), 1,88 (d, J = 7,3 Hz, 1,5H); ESIMS m/z 533

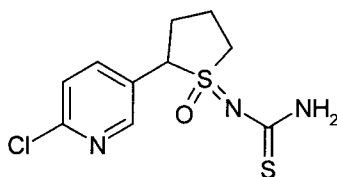
15 ([M+H]⁺).

Ejemplo 14: Preparación de N-(metil(óxido){1-[4-(trifluormetil)fenil]etil}-λ⁴-sulfaniliden)tiourea (**35**).

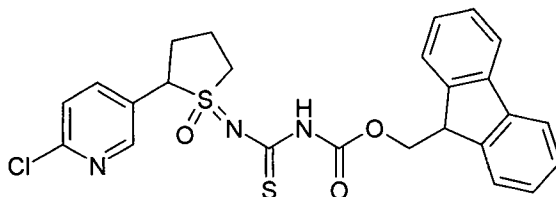


Se sintetizó *N*-(metilo(óxido){1-[4-(trifluormetil)fenil]etil}-λ⁴-sulfaniliden)tiourea (**35**) a partir del compuesto **34** de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 5. El compuesto se aisló en forma de sólido blanco (1,62 g, 67%): pf 166-168°C; ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,04 (d, *J* = 13,6 Hz, 1H), 7,90 (dd, *J* = 2,3, 19,2 Hz, 1H), 7,80-7,75 (m, 4H), 5,49-5,44 (m, 1H), 3,37 (s, 1,5H), 3,34 (s, 1,5H), 1,76 (d, *J* = 7,3 Hz, 1,5H), 1,74 (d, *J* = 8,1 Hz, 1,5H); ESIMS *m/z* 311 ([*M*+*H*]⁺).

Ejemplo 15: Preparación de *N*-[2-(6-cloropiridin-3-il)-1-óxidotetrahidro-1*H*-1λ⁴-tien-1-iliden]tiourea (**36**).

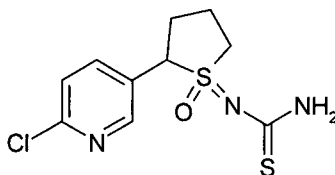


Paso A. Preparación de 9H-fluoren-9-ilmetilo[[2-(6-cloropiridin-3-il)-1-óxidotetrahidro-1H-1 λ^4 -tien-1-iliden]amino]carbonotioilcarbamato.



5 Se sintetizó 9H-fluoren-9-ilmetil[[2-(6-cloropiridin-3-il)-1-óxidotetrahidro-1H-1 λ^4 -tien-1-iliden]amino]carbonotioilcarbamato a partir de la correspondiente sulfoximida de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 4. El compuesto
10 se aisló en forma de sólido blancuzco (4,4 g, 99%): pf 86-95°C; ESIMS m/z 512 ($[M+H]^+$).

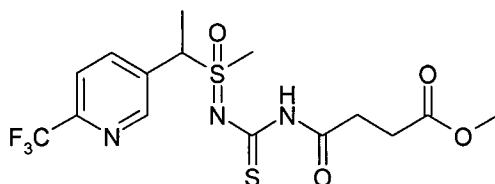
Paso B. Preparación de N-[2-(6-cloropiridin-3-il)-1-óxidotetrahidro-1H-1 λ^4 -tien-1-iliden]tiourea (36)



Se sintetizó *N*-[2-(6-cloropiridin-3-il)-1-
 óxidotetrahidro-1*H*-1 λ^4 -tien-1-iliden]tiourea (36) a
 partir de 9*H*-fluoren-9-ilmetil[[2-(6-cloropiridin-3-
 il)-1-óxidotetrahidro-1*H*-1 λ^4 -tien-1-iliden]amino]

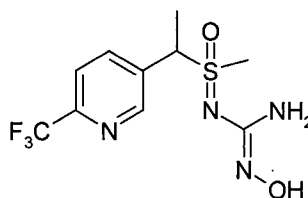
5 carbonotioilcarbamato de acuerdo con el procedimiento
 descrito en el Ejemplo 5. El compuesto se aisló en
 forma de sólido blancuzco (0,51 g, 20%): pf 168-172°C;
¹H RMN (300 MHz, acetona-*d*₆) δ (2:1 mezcla de dos
 diaestereómeros) 8,50 (d, *J* = 2,2 Hz, 1H), 8,43 (d, *J* =
 10 2,5 Hz, 1H), 7,96 (dd, *J* = 8,5, 2,5 Hz, 1H), 7,86 (dd,
J = 6,6, 1,1 Hz, 1H), 7,68 (br d, *J* = 20,3 Hz, 2H),
 7,51 (d, *J* = 8,5 Hz, 1H), 7,47 (d, *J* = 6,6 Hz, 1H),
 5,14 (dd, *J* = 11,8, 7,4 Hz, 2H), 4,60 (m, 2H), 4,26 (m,
 2H), 2,20-2,65 (m, 8H); ESIMS *m/z* 290 ([*M*+H]⁺).

15 Ejemplo 16: Preparación de 4-([[(metil(óxido){1-[6-
 (trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)
 amino]carbonotioil}amino)-4-oxobutanoato de metilo
 (37).



Se disolvió clorosuccinato de metilo (0,099 mL, 0,803 mmol) en acetona (2,7 mL) a 25°C con agitación. A esta solución, se agregó el compuesto **22** (0,250 g, 0,803 mmol) en acetona (4 mL). A continuación, se agregó trietiloamina (0,112 mL, 0,803 mmol) a la mezcla de reacción que se entibió hasta 45°C durante 6 h. La solución tibia se filtró luego y el residuo se lavó con acetona tibia. El filtrado se concentró *in vacuo* para proveer 4-(((metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden)amino]carbonotioil)amino)-4-oxobutanoato de metilo (**37**) en forma de sólido amarillo (0,342 g, >99%): pf 131-133°C; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,81 (m, 1H), 8,39 & 8,23 (m, 1H), 7,78 (m, 1H), 5,32 & 5,10 (q, *J* = 7,1 Hz, 1H), 3,71 (m, 2H), 3,46 (m, 3H), 3,11 (m, 2H), 2,67 (m, 3H), 1,97 & 1,92 (d, *J* = 7,1 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 426 ([M+H]⁺).

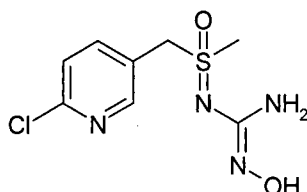
Ejemplo 17: Preparación de N''-hidroxi-N-
(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-
 λ^4 -sulfaniliden)guanidina (38).



5 Se disolvió metilo(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden
(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden
cianamida (0,200 g, 0,721 mmol) en etanol (2,7 mL) a
temperatura ambiente. En un frasco separado, se
disolvieron clorhidrato de hidroxilamina (0,099 g, 1,44
10 mmol) y Na₂CO₃ (0,229 g, 2,16 mmol) en agua (0,9 mL) y,
luego, se agregaron a la mezcla de reacción, que se
calentó hasta reflujo durante 8 h. Al completarse la
reacción, el solvente se eliminó *in vacuo*. Se agregó
agua al residuo y se recogieron los sólidos mediante
15 filtración bajo vacío para proveer N''-hidroxi-N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (**38**) en forma de polvo blanco
(0,070 g, 31%): pf 157-159°C; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ

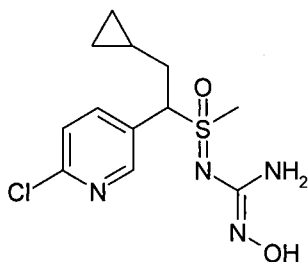
(mezcla de diaestereómeros) 8,79 (s, 1H), 8,06 (m, 1H), 7,74 (m, 1H), 5,11 & 4,98 (m, 1H), 4,52 (br s, 1H), 4,44 (br s, 1H), 3,09 & 2,96 (s, 3H), 1,89 & 1,86 (d, $J = 7,3$ Hz, 3H); ESIMS m/z 311 ($[M-H]^-$).

5 Ejemplo 18: Preparación de N -[[$(6$ -cloropiridin-3-il)metilo](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]- N'' -hidroxiguanidina (39).



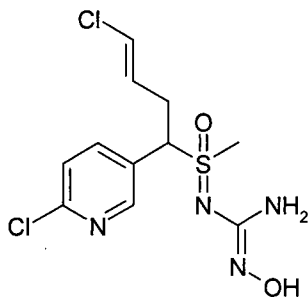
Se sintetizó N -[[$(6$ -cloropiridin-3-il)metil](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]- N'' -hidroxiguanidina (39) a partir de la correspondiente N -ciano sulfoximina de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 17. El compuesto se aisló en forma de sólido blanco (0,184 g, 54%): pf 156-158°C; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,40 (s, 1H), 7,81 (m, 1H), 7,42 (m, 1H), 4,75 (m, 2H), 3,10 & 3,01 (s, 3H); ESIMS m/z 263 ($[M+H]^+$)

Ejemplo 19: Preparación de N-[[1-(6-cloropiridin-3-il)-2-ciclopropiletil](metilo)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-N''-hidroxiguanidina (40).



5 Se sintetizó N-[[1-(6-cloropiridin-3-il)-2-ciclopropiletil](metilo)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-N''-hidroxiguanidina (40) a partir de la correspondiente N-ciano sulfoximina de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 17. El compuesto se aisló en
10 forma de semisólido amarillo claro (0,142 g, 34%): ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,47 (s, 1H), 7,91 (m, 1H), 7,41 (m, 1H), 3,04 y 2,94 (s, 3H), 2,43 y 2,31 (m, 1H), 2,00 (m, 2H), 0,45 (m, 3H), 0,14 (m, 2H); ESIMS m/z 317 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

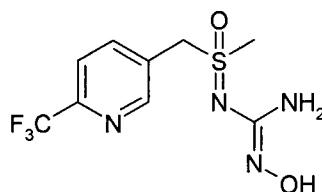
Ejemplo 20: Preparación de N-[[(3E)-4-cloro-1-(6-cloropiridin-3-il)but-3-enil] (metilo)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-N''-hidroxiguanidina (**41**).



5 Se sintetizó N-[[(3E)-4-cloro-1-(6-cloropiridin-3-il)but-3-enil] (metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-N''-hidroxiguanidina (**41**) a partir de la correspondiente N-ciano sulfoximina de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 17. El compuesto se aisló en

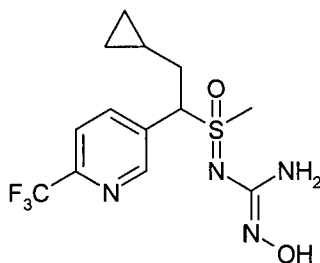
10 forma de semisólido amarillo claro (0,182 g, 50%): ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,42 (m, 1H), 7,83 (m, 1H), 7,43 (m, 1H), 6,07 (m, 1H), 5,64 (m, 1H), 4,58 & 4,49 (m, 2H), 3,22 (m, 1H), 3,05 y 2,94 (s, 3H); ESIMS m/z 337 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 21: Preparación de N''-hidroxi-N-(metil(óxido){[6-(trifluormetil)piridin-3-il]metil}-λ⁴-sulfaniliden)guanidina (42).



5 Se sintetizó N''-hidroxi-N-(metil(óxido){[6-(trifluormetil)piridin-3-il]metil}-λ⁴-sulfaniliden)guanidina (42) a partir de la correspondiente N-ciano sulfoximina de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 17. El compuesto se aisló en forma de
10 sólido blanco (0,188 g, 56%): pf 118-120°C; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,74 (s, 1H), 8,04 (m, 1H), 7,77 (m, 1H), 4,34 (s, 2H), 3,14 y 2,91 (s, 3H); ESIMS m/z 297 ([M+H]⁺).

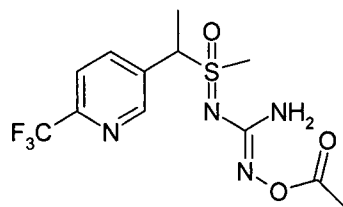
Ejemplo 22: Preparación de N-[[2-ciclopropil-1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil](metil)óxido-λ⁴-sulfaniliden]-N''-hidroxiguanidina (43)



Se sintetizó *N*-[2-ciclopropil-1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]-*N'*'-hidroxiguanidina (**43**) a partir de la correspondiente *N*-ciano sulfoximina de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 17. El compuesto se aisló en forma de semisólido marrón (0,323 g, 51%):

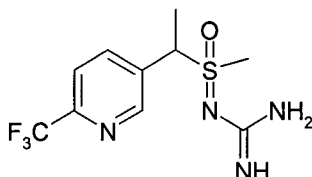
^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,82 (m, 1H), 8,13 (m, 1H), 7,76 (m, 1H), 3,06 y 2,96 (s, 3H), 2,48 y 2,36 (m, 1H), 1,97 (m, 2H), 0,45 (m, 3H), 0,15 (m, 2H); ESIMS m/z 351 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 23: Preparación de *N'*'-(acetiloxi)-*N*-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (**44**).



El compuesto **38** (0,300 g, 0,967 mmol) se disolvió en ácido acético glacial (48 mL) a 25°C. A esta solución, se agregó anhídrido acético (0,100 mL, 1,06 mmol). La mezcla se dejó agitar durante 1 h a temperatura ambiente bajo N₂. Posteriormente, la mezcla se vertió lentamente en NaHCO₃ acuoso saturado. Una vez logrado un pH 6-7, la solución se extrajo con CH₂Cl₂. Los extractos orgánicos se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron (Na₂SO₄) y concentraron *in vacuo* para proveer N'-(acetiloxi)-N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-λ⁴-sulfaniliden)guanidina (**44**) en forma de semisólido blanco (0,038 g, 13%): ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 8,81 (s, 1H), 8,13 (m, 1H), 7,77 (m, 1H), 4,88 (q, J = 7,1 Hz, 1H), 3,14 (s, 3H), 2,49 (s, 3H), 1,97 (d, J = 7,1 Hz, 3H); ESIMS m/z 353 ([M+H]⁺).

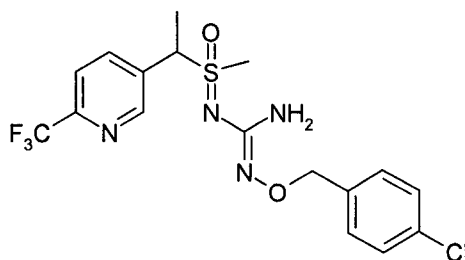
Ejemplo 24: Preparación de N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (45).



5 El compuesto **38** (0,300 g, 0,967 mmol) se disolvió en ácido acético glacial (48 mL) a temperatura ambiente. A esta solución, se agregó anhídrido acético (0,100 mL, 1,06 mmol). La mezcla se dejó agitar durante 1 h a temperatura ambiente bajo N₂. A continuación, se
10 agregó 5% Pd/C (2 g, 0,967 mmol) y la mezcla se hidrogenó (30 psi). El Pd/C se filtró a través de una almohadilla Celite® y el filtrado se vertió lentamente en NaHCO₃ acuoso saturado. Una vez alcanzado un pH>7, la solución se extrajo con CH₂Cl₂. Los extractos
15 orgánicos se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron (Na₂SO₄), y concentraron *in vacuo* para proveer N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (**45**) en forma de aceite amarillo crudo (0,111 g, 39%): ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ

(mezcla de diaestereómeros) 8,82 (s, 1H), 8,10 (m, 1H), 7,74 (m, 1H), 5,39 y 5,27 (q, $J = 7,3$ Hz, 1H), 3,19 y 3,00 (s, 3H), 1,90 y 1,85 (d, $J = 7,1$ Hz, 3H); ESIMS m/z 295 ($[M+H]^+$).

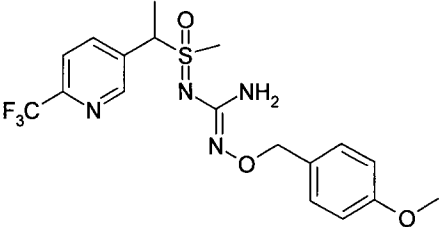
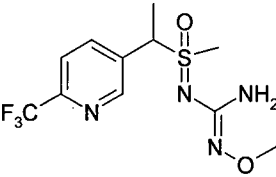
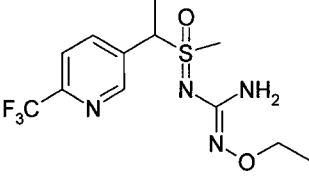
- 5 Ejemplo 25: Preparación de N'' -[(4-clorobencil)oxi]- N -(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (**46**).

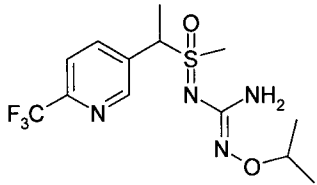
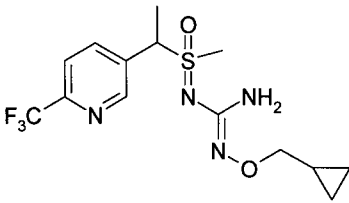
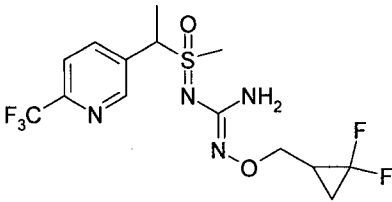
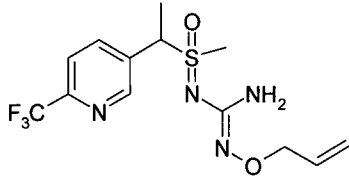


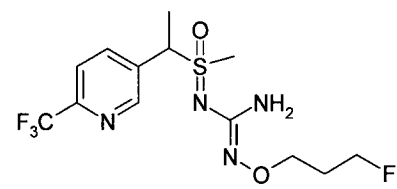
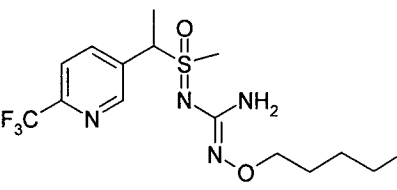
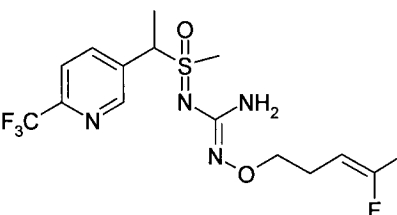
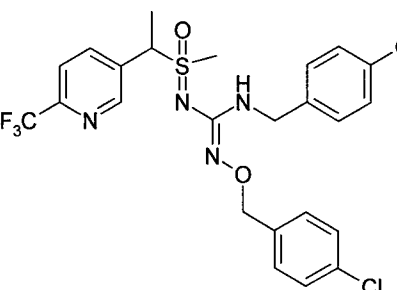
- NaH (60% dispersión en aceite mineral, 0,026 g, 0,644 mmol) se suspendió en THF (1,6 mL) y se enfrió hasta 0°C. Se agregó el compuesto **38** (0,200 g, 0,644 mmol) y, luego de 15 min, se agregó por goteo cloruro de 4-clorobencilo (0,104 g, 0,644 mmol) disuelto en THF (1 mL) a la mezcla de reacción. El baño de hielo se retiró y la mezcla se dejó entibiar hasta la temperatura ambiente. La mezcla se templó con una solución acuosa saturada de NH_4Cl y se diluyó con

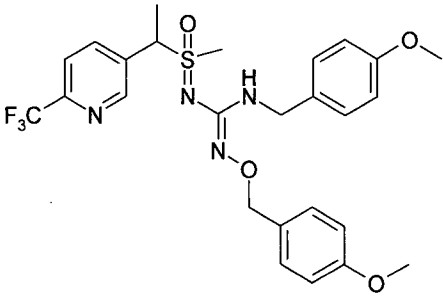
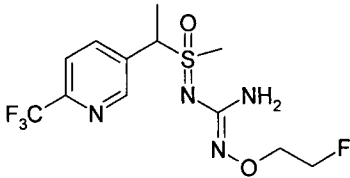
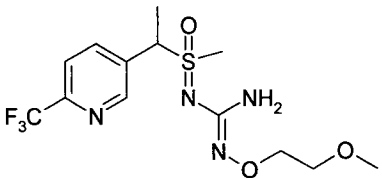
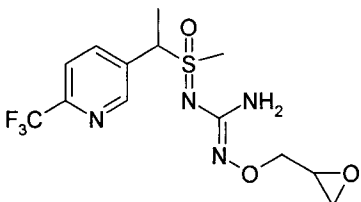
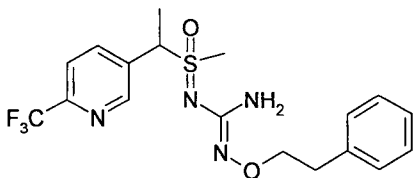
acetato de etilo. Las capas se separaron, y la capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de NH_4Cl y salmuera. La capa orgánica se concentró luego *in vacuo*. El material bruto se purificó mediante HPLC
5 de fase inversa levigando con mezclas de acetonitrilo/agua para proveer N'' -[(4-clorobencil)oxi]- N -(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (**46**) en
forma de un semisólido color tostado (0,012 g, 4%): ^1H
10 RMN (400 MHz, CD_3OD) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,58 (m, 1H), 7,97 (m, 1H), 7,70 (m, 1H), 7,30 (m, 2H), 7,20 (m, 2H), 4,89 (m, 1H), 4,74 (s, 2H), 2,89 y 2,82 (s, 3H), 1,68 y 1,64 (d, $J = 7,3$ Hz, 3H): ESIMS m/z 435 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Tabla 3: Compuestos insecticidas

Comp. Nro.	Estructura	Vía	Caracterización
47		C	aceite marrón; ESIMS m/z 431 ([M+H] ⁺)
48		C	semisólido amarillo; ESIMS m/z 325 ([M+H] ⁺)
49		C	semisólido amarillo pálido; ESIMS m/z 339 ([M+H] ⁺)

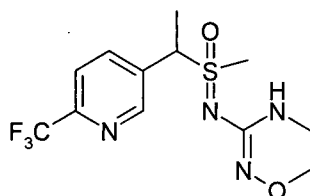
50		C	semisólido amarillo; ESIMS m/z 353 ([M+H] ⁺)
51		C	semisólido amarillo pálido; ESIMS m/z 365 ([M+H] ⁺)
52		C	semisólido amarillo pálido; ESIMS m/z 401 ([M+H] ⁺)
53		C	aceite amarillo claro; ESIMS m/z 351 ([M+H] ⁺)

54		C	aceite naranja; ESIMS m/z 371 ([M+H] ⁺)
55		C	aceite marrón claro; ESIMS m/z 385 ([M+H] ⁺)
56		C	aceite marrón claro; ESIMS m/z 401 ([M+H] ⁺)
57		C	semisólido blanco; ESIMS m/z 559 ([M+H] ⁺)

58		C	semisólido amarillo claro; ESIMS m/z 551 ([M+H] ⁺)
59		C	aceite marrón; ESIMS m/z 357 ([M+H] ⁺)
60		C	aceite naranja; ESIMS m/z 369 ([M+H] ⁺)
61		C	aceite marrón; ESIMS m/z 367 ([M+H] ⁺)
62		C	aceite amarillo; ESIMS m/z 413 ([M+H] ⁺)

C = Vía utilizada en el Ejemplo 25

Ejemplo 26: Preparación de *N*''-metoxi-*N*-metil-*N*'-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (**63**).



5

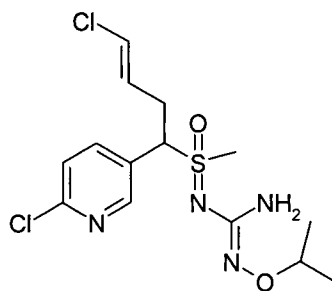
Se suspendió carbonato de potasio (0,044 g, 0,322 mmol) en acetonitrilo (0,644 mL) a temperatura ambiente. A esta mezcla, se agregó el compuesto **38** (0,100 g, 0,322 mmol). La solución se dejó agitar a

10 temperatura ambiente durante 30 min antes de la adición de yoduro de metilo (0,020 mL, 0,322 mmol). Una vez completada la adición, la reacción se dejó agitar durante la noche. La mezcla se filtró y se concentró *in vacuo* para proveer *N*''-metoxi-*N*-metil-*N*'-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)guanidina (**63**) en forma de semisólido

15 amarillo (0,215 g, >99%): ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 9,05 (s, 1H), 8,41 (m, 1H),

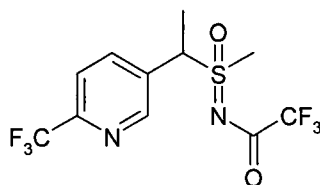
7,81 (m, 1H), 6,31 y 6,20 (q, $J = 7,1$ Hz, 1H), 3,87 y 3,83 (s, 3H), 3,70 (s, 3H), 3,47 & 3,36 (s, 3H), 1,97 y 1,95 (m, 3H); ESIMS m/z 339 ($[M+H]^+$).

Ejemplo 27: Preparación de $N-[(3E)-4\text{-cloro-1-(6-cloropiridin-3-il)but-3-enil] (metil)óxido-}\lambda^4\text{-sulfaniliden]-}N''\text{-isopropoxiguanidina (64)}$



Se sintetizó $N-[(3E)-4\text{-cloro-1-(6-cloropiridin-3-il)but-3-enil] (metil)óxido-}\lambda^4\text{-sulfaniliden]-}N''\text{-isopropoxiguanidina (64)}$ a partir del compuesto **41** de acuerdo con el procedimiento descrito en el Ejemplo 25. El compuesto se aisló en forma de semisólido dorado (0,080 g, 44%): ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ (mezcla de diaestereómeros) 8,37 (s, 1H), 7,82 (m, 1H), 7,44 (m, 1H), 6,05 (m, 1H), 5,65 (m, 1H), 4,53 & 4,44 (m, 2H), 4,10 (m, 1H), 3,20 (m, 1H), 3,09 y 2,93 (s, 3H), 1,22 (m, 3H), 0,86 (m, 3H); ESIMS m/z 379 ($[M+H]^+$).

Ejemplo 28: Preparación de 2,2,2-trifluor-N-
(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-
 λ^4 -sulfaniliden)acetamida (65).

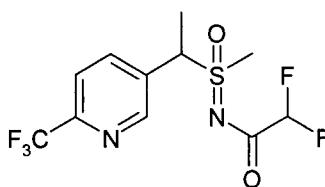


5 5-[1-(metilsulfonimidoil)etil]-2-
(trifluormetil)piridina (0,075 g, 0,297 mmol) se
disolvió en piridina (0,24 mL) a 25°C. A continuación,
se agregó anhídrido trifluoracético (0,471 mL, 2,58
mmol) a la mezcla de reacción, que se dejó agitar
10 durante 2 h. La mezcla se diluyó con acetato de etilo,
se lavó con 5% de ácido cítrico y NaHCO₃ acuoso
saturado. La capa orgánica se secó (MgSO₄) y se
concentró *in vacuo* para proveer 2,2,2-trifluor-N-
(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-
15 λ^4 -sulfaniliden)acetamida (65) en forma de aceite
amarillo (43 mg, 42%): ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ (mezcla
de diaestereómeros) 8,80 (m, 1H), 8,10 (m, 1H), 7,82

(m, 1H), 4,90 (m, 1H), 3,32 y 3,21 (s, 3H), 2,01 y 1,95 (d, $J = 7,3$ Hz, 3H); ESIMS m/z 347 ($[M+H]^+$).

Ejemplo 29: Preparación de 2,2-difluor-N-(metilo(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-

5 λ^4 -sulfaniliden)acetamida (66).



N -(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}-
 λ^4 -sulfaniliden)-1*H*-imidazol-1-carbotioamida (300 mg,
 0,83 mmol) se disolvió en acetonitrilo (10 mL) y se
 10 enfrió hasta 0°C. Mientras se agitaba, se agregó
 hidrazina (solución al 64-65% en agua, 30,8 μ L, 31,9
 mg, 0,64 mmol) por medio de una jeringa. Luego de 10
 min, la mezcla se vertió en una solución acuosa
 saturada de NH_4Cl (100 mL), que se extrajo una vez con
 15 CHCl_3 (100 mL). La fase orgánica se lavó con varias
 fracciones de NH_4Cl acuoso saturado hasta que la fase
 acuosa se tornó levemente ácida, y luego se secó
 (Na_2SO_4). Luego de la filtración, se agregó anhídrido

difluoracético (154 μ L, 216 mg, 1,24 mmol) por goteo a la fase orgánica, que luego se agitó a 25°C durante 20 min. El solvente se eliminó bajo presión reducida. El concentrado bruto contenía la

5 difluoracetilsemicarbazida inestable y difluoracetamida como los productos principales de acuerdo con un análisis de CL-EM de la mezcla de reacción bruta. La mezcla se agregó lentamente a NaHCO₃ acuoso saturado y se extrajo con CHCl₃ (3 x 50 mL). Los extractos

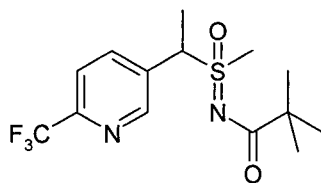
10 orgánicos combinados se lavaron con hidróxido de amonio acuoso saturado (4 x 50 mL), NH₄Cl acuoso saturado (fracciones de 50 mL, hasta hallarse neutro), se secaron (NaSO₄) y se concentraron bajo presión reducida. El compuesto se purificó mediante

15 cromatografía de fase inversa (gradiente agua-acetonitrilo) para proveer 2,2-difluor-N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)acetamida pura (**66**) en forma de aceite amarillento (38 mg, 13%): ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ

20 8,79 (d, J = 2,1 Hz, 0,33H), 8,74 (d, J = 2,1 Hz, 0,67H), 8,09 (dd, J = 8,2 Hz, J = 2,1 Hz, 0,33H), 8,04 (dd, J = 8,2 Hz, J = 2,1 Hz, 0,67H), 7,79 (d, J = 8,2

Hz, 0,33H), 7,76 (d, $J = 8,2$ Hz, 0,67H), 5,83 (t, $J = 54,5$ Hz, 0,33H), 5,73 (t, $J = 54,5$ Hz, 0,67H), 4,95 (q, $J = 7,2$ Hz, 0,33H), 4,91 (q, $J = 7,2$ Hz, 0,67H), 3,28 (s, 2H), 3,14 (s, 1H), 1,97 (d, $J = 7,2$ Hz, 2H), 1,89 (d, $J = 7,2$ Hz, 1H); ESIMS m/z 331 ($[M+H]^+$).

Ejemplo 30: Preparación de 2,2-dimetil-N-(metil(óxido){1-[6-(trifluormetil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniliden)propanamida (**67**)



Se agitaron 5-[1-(metilsulfonimidoil)etil]-2-(trifluormetil)piridina (300 mg, 1,19 mmol) en piridina (1 mL) y anhídrido piválico (244 mg, 1,31 mmol, 1,1 eq) a 90°C durante 1 h. Se agregó una base de Hünig (2 gotas), y la mezcla se calentó hasta reflujo durante 2 h. El solvente se eliminó bajo presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna (gradiente de metanol-cloruro de metileno). El producto se obtuvo en forma de un polvo blanco a blancuzco (125

mg, 31%): ^1H RMN (400MHz, CDCl_3): δ 8,78 (d, $J = 1,9$ Hz, 0,6H), 8,74 (d, $J = 1,9$ Hz, 0,4H), 8,07 (dd, $J = 8,1$ Hz, $J = 2,1$ Hz, 0,6H), 8,01 (dd, $J = 8,1$ Hz, $J = 2,1$ Hz, 0,4H), 7,76 (d, $J = 8,2$ Hz, 1H), 7,71 (d, $J = 8,2$ Hz, 0,4H), 5,03 (q, $J = 7,2$ Hz, 0,6H), 4,97 (q, $J = 7,2$ Hz, 0,4H), 3,20 (s, 1,2H), 3,01 (s, 1,8H), 1,90 (d, $J = 7,2$ Hz, 1,2H), 1,80 (d, $J = 7,2$ Hz, 1,8H), 1,22 (s, 5,4H), 1,07 (s, 3,6H); ESIMS m/z 337 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 31: Prueba insecticida

10 Los compuestos **1-67** se sometieron a prueba contra los áfidos del durazno verde mediante los procedimientos descriptos a continuación.

Prueba insecticida para el áfido de durazno verde (*Myzus persicae*) en un ensayo de rocío foliar

15 Como sustrato de prueba se utilizaron brotes de repollo cultivados en macetas de 3 pulgadas, con 2-3 hojas verdaderas pequeñas (3-5 cm). Los brotes se infestaron con 20-50 áfidos de durazno verde (adultos sin alas y ninfas) 1-2 días antes de la aplicación
20 química. Se utilizaron cuatro brotes para cada

tratamiento. Se disolvieron compuestos (2 mg) en 2 mL de solvente de acetona-metanol (1:1), formando soluciones madre de 1000 ppm. Las soluciones madre se diluyeron 5X con 0,025% de Tween 20 en H₂O para obtener una solución a 200 ppm. Se utilizó un atomizador aspirador manual Devilbiss para rociar una solución en ambos lados de las hojas de repollo hasta escurrirse. Las plantas de referencia (control de solventes) se rociaron con el diluyente solamente. Las plantas tratadas se mantuvieron en un ambiente de retención durante 3 días a aproximadamente 23°C y 40% RH antes de la clasificación. Se realizó una evaluación contando la cantidad de áfidos vivos por planta bajo un microscopio. Se midió la actividad insecticida mediante la fórmula de corrección de Abbott:

$$\% \text{ de control corregido} = 100 * (X - Y) / X$$

donde X = Cantidad de áfidos vivos en las plantas de control de solventes

Y = Cantidad de áfidos vivos en las plantas tratadas.

Tabla 4: Actividad insecticida

	Clasificación contra el áfido del durazno verde en repollos (atomización foliar)
Comp. Nro.	200 ppm
1	C
2	C
3	A
4	B
5	B
6	A
7	A
8	A
9	A
10	A
11	A
12	A
13	A
14	A
15	A
16	A

17	A
18	A
19	A
20	B
21	B
22	A
23	A
24	A
25	A
26	A
27	A
28	B
29	A
30	B
31	A
32	B
33	A
34	B
35	B
36	A
37	A

38	A
39	A
40	B
41	B
42	A
43	A
44	A
45	B
46	A
47	A
48	A
49	A
50	A
51	A
52	A
53	A
54	A
55	A
56	A
57	B
58	A

59	A
60	A
61	A
62	A
63	A
64	B
65	C
66	A
67	B

En cada caso de la tabla 4, la escala de clasificación es como la siguiente:

% de Control (o mortalidad)	Clasificación
80-100	A
Menos de 80	B
No probada	C

Derivados de ácidos y sales y solvatos

Los compuestos descriptos en la presente invención pueden hallarse en forma de sales de adición de ácidos aceptables respecto de plaguicidas.

5 A modo de ejemplo no limitativo, una función amina puede formar sales con ácidos clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, fosfórico, acético, benzoico, cítrico, malónico, salicílico, málico, fumárico, oxálico, succínico, tartárico, láctico, glucónico, ascórbico,
10 maleico, aspártico, bencensulfónico, metansulfónico, etansulfónico, hidroximetansulfónico, y hidroxietansulfónico.

Adicionalmente, a modo de ejemplo no limitativo, una función de ácido puede formar sales que incluyen
15 aquellas derivadas de metales álcali y alcalinotérreos y aquellas derivadas de amoníaco y aminas. Los ejemplos de cationes preferidos incluyen cationes de sodio, potasio, magnesio, y aminio.

Las sales se preparan contactando la forma de base
20 libre con una cantidad suficiente del ácido deseado para producir una sal. Las formas de bases libres

pueden regenerarse al tratar la sal con una solución de base acuosa diluida adecuada como, por ejemplo, NaOH acuoso diluido, carbonato de potasio, amoníaco, y bicarbonato de sodio. Como ejemplo, en muchos casos, un plaguicida se modifica a una forma más soluble en agua, por ejemplo la sal de dimetilamina del ácido 2,4-diclorofenoxiacético es una forma más soluble en agua del ácido 2,4-diclorofenoxiacético, un herbicida muy conocido.

Los compuestos descritos en la presente invención pueden formar también complejos estables con moléculas de solventes que permanecen intactas luego de retiradas las moléculas de solvente no acomplexado de los compuestos. Estos complejos se mencionan con frecuencia como "solvatos".

Estereoisómeros

Ciertos compuestos descritos en la presente invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen isómeros geométricos, diaestereómeros, y enantiómeros. Por lo tanto, los compuestos descritos en la presente

invención incluyen mezclas racémicas, estereoisómeros individuales, y mezclas ópticamente activas. Los expertos en la técnica apreciarán que un estereoisómero puede ser más activo que los otros. Los estereoisómeros
5 y las mezclas ópticamente activas se pueden obtener mediante procedimientos sintéticos selectivos, procedimientos sintéticos convencionales con el uso de materiales de partida resolved, o con procedimientos de resolución convencional.

10 **Plagas**

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas
15 de Phylum Nematoda.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de Phylum Arthropoda.

En otra realización, la invención descrita en
20 este documento se puede utilizar para controlar plagas de Subphylum Chelicerata.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de la clase de los arácnidos.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de Subphylum Myriapoda.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de la clase de los sínfilos.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de Subphylum Hexapoda.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de la clase de insectos.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Coleópteros (escarabajos)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen, pero sin limitación, Acanthoscelides spp. (gorgojos), Acanthoscelides obtectus (gorgojo de porotos comunes), Agrilus planipennis (barrenillo esmeralda del fresno), Agriotes

spp. (larvas del escarabajo de resorte), *Anoplophora*
glabripennis (escarabajo asiático de cuerno largo),
Anthonomus spp. (gorgojos), *Anthonomus grandis* (gorgojo
del algodón), *Aphidius* spp., *Apion* spp. (gorgojos),
5 *Apogonia* spp. (gusano), *Ataenius spretulus* (ataenius
negro del césped), *Atomaria linearis* (escarabajo pigmeo
de la remolacha forrajera), *Aulacophore* spp.,
Bothynoderes punctiventris (gorgojo de la raíz de
remolacha), *Bruchus* spp. (gorgojos), *Bruchus pisorum*
10 (gorgojo de arvejas), *Cacoesia* spp., *Callosobruchus*
maculatus (gorgojo de la arveja de vaca del sudeste),
Carpophilus hemipteras (escarabajo de la fruta seca),
Cassida vittata, *Cerosterna* spp, *Cerotoma* spp.
(crisomélidos), *Cerotoma trifurcata* (escarabajo de la
15 hoja del poroto), *Ceutorhynchus* spp. (gorgojos),
Ceutorhynchus assimilis (gorgojo de las vainas de
semillas del repollo), *Ceutorhynchus napi* (curculio del
repollo), *Chaetocnema* spp. (crisomélidos), *Colaspis*
spp. (escarabajos del suelo), *Conoderus scalaris*,
20 *Conoderus stigmosus*, *Conotrachelus nenuphar* (curculio
de la ciruela), *Cotinus nitidis* (escarabajo verde de
junio), *Crioceris asparagi* (escarabajo del espárrago),

- Cryptolestes ferrugineus (escarabajo del grano mohoso),
Cryptolestes pusillus (escarabajo del grano chato),
Cryptolestes turcicus (escarabajo del grano turco),
Ctenicera spp. (larvas del escarabajo de resorte),
5 Curculio spp. (gorgojos), Ciclocephala spp. (gusanos),
Cylindrocopturus adspersus (gorgojo del tallo del
girasol), Deporaus marginatus (gorgojo del corte de
hojas del mango), Dermestes lardarius (escarabajo de la
despensa), Dermestes maculatus (escarabajo oculto
10 ("hide beetle"), Diabrotica spp. (crisomélidos),
Epilachna varivestis (escarabajo del poroto mexicano),
Faustinus cubae, Hylobius pales (gorgojos de palets),
Hypera spp. (gorgojos), Hypera postica (gorgojos de la
alfalfa), Hyperdoes spp. (gorgojo Hyperodes),
15 Hypothenemus hampei (escarabajo de la baya del café),
Ips spp. (grabadores), Lasioderma serricorne
(escarabajo del cigarrillo), Leptinotarsa decemlineata
(escarabajo de la papa de Colorado), Liogenys fuscus,
Liogenys suturalis, Lissorhoptrus oryzophilus
20 (escarabajo del agua de arroz), Lyctus spp.
(escarabajos de la madera/escarabajo pulverizador de la
madera), Maecolaspis joliveti, Megascelis spp.,

- Melanotus communis, Meligethes spp., Meligethes aeneus (escarabajo de pimpollos), Melolontha melolontha (abejorro europeo común), Oberea brevis, Oberea linearis, Oryctes rhinoceros (escarabajo rinoceronte),
- 5 Oryzaephilus mercator (escarabajo mercante de los granos), Oryzaephilus surinamensis (escarabajo dentado de los granos), Otiorhynchus spp. (gorgojos), Oulema melanopus (escarabajo de hojas de cereales), Oulema oryzae, Pantomorus spp. (gorgojos), Phyllophaga spp.
- 10 (escarabajo de mayo/junio), Phyllophaga cuyabana, Phyllotreta spp. (crisomélidos), Phynchites spp., Popillia japonica (escarabajo japonés), Prostephanus truncates (perforador del grano mayor), Rhizopertha dominica (perforador del grano menor), Rhizotrogus spp.
- 15 (escarabajo roedor europeo), Rhynchophorus spp. (gorgojos), Scolytus spp. (escarabajos de la madera), Shenophorus spp. (escarabajo picudo), Sitona lineatus (gorgojo de las hojas de arvejas), Sitophilus spp. (gorgojos de los granos), Sitophilus granaries (gorgojo
- 20 de los cereales), Sitophilus oryzae (gorgojo del arroz), Stegobium paniceum (escarabajo de droguería), Tribolium spp. (escarabajos de la harina), Tribolium

castaneum (escarabajo rojo de la harina), Tribolium confusum (escarabajo confuso de la harina), Trogoderma variabile (escarabajo de almacén), y Zabrus tenebioides.

5 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Dermápteros (tijerillas)**.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar

10 **Dictiópteros (cucarachas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, Blattella germanica (cucaracha alemana), Blatta orientalis (cucaracha oriental), Parcoblatta pennilovanica, Periplaneta americana (cucaracha americana),

15 Periplaneta australoasiae (cucaracha australiana), Periplaneta brunnea (cucaracha marrón), Periplaneta fuliginosa (cucaracha marrón ahumada), Pyncoselus suninamensis (cucaracha de Surinam), y Supella longipalpa (cucaracha de bandas marrones).

20 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Dípteros (moscas verdaderas)**. Una lista no exhaustiva

de estas plagas incluye, pero sin limitación, *Aedes* spp. (mosquitos), *Agromyza frontella* (minero manchador de la hoja de la alfalfa), *Agromyza* spp. (moscas mineras de hojas), *Anastrepha* spp. (moscas de la
5 fruta), *Anastrepha suspensa* (mosca caribenea de la fruta), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Bactrocera* spp. (moscas de la fruta), *Bactrocera cucurbitae* (mosca del melón), *Bactrocera dorsalis* (mosca oriental de la fruta), *Ceratitis* spp. (moscas de la fruta), *Ceratitis*
10 *capitata* (moscas mediterráneas de la fruta), *Chrysops* spp. (tábanos), *Cochliomyia* spp. (gusano tornillo), *Contarinia* spp. (mosca de la agalla), *Culex* spp. (mosquitos), *Dasineura* spp. (mosca de la agalla), *Dasineura brassicae* (mosca de la agalla del repollo),
15 *Delia* spp., *Delia platura* (cresa de la semilla del maíz), *Drosophila* spp. (moscas del vinagre), *Fannia* spp. (moscas de la suciedad), *Fannia canicularis* (mosca pequeña del hogar), *Fannia scalaris* (mosca de letrina), *Gasterophilus intestinalis* (moscardón del caballo),
20 *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans* (mosca del cuerno), *Hylemyia* spp. (cresa de la raíz), *Hypoderma lineatum* (gusano común del ganado), *Liriomyza* spp.

(moscas mineras de hojas), *Liriomyza brassica* (minador
 serpentina de la hoja), *Melophagus ovinus* (garrapata de
 la oveja), *Musca* spp. (moscas múscidas), *Musca*
autumnalis (moscas de la cara), *Musca domestica* (moscas
 5 del hogar), *Oestrus ovis* (moscardón de la oveja),
Oscinella frit (mosca frit), *Pegomyia betae* (minador de
 la hoja de remolacha), *Phorbia* spp., *Psila rosae* (mosca
 del moho de la zanahoria), *Rhagoletis cerasi* (mosca de
 la cereza), *Rhagoletis pomonella* (cresa de la manzana),
 10 *Sitodiplosis mosellana* (moscas naranjas de la flor del
 trigo), *Stomoxis calcitrans* (mosca del establo),
Tabanus spp. (moscas del caballo), y *Tipula* spp.
 (zancudos).

En otra realización, la invención descrita en
 15 este documento se puede utilizar para controlar
Hemípteros (chinches del campo). Una lista no
 exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin
 limitación, *Acrosternum hilare* (chinche verde
 hedionda), *Blissus leucopterus* (chinche), *Calocoris*
 20 *norvegicus* (miride de la papa), *Cimex hemipterus*
 (chinches tropicales de cama), *Cimex lectularius*
 (chinche de cama), *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops*

furcatus, Dysdercus suturellus (chinche tintórea del algodón), Edessa meditabunda, Eurygaster maura (chinche del cereal), Euschistus heros, Euschistus servus (chinche hedionda marrón), Helopeltis antonii,
5 Helopeltis theivora (chinche de roya del té), Lagynotomus spp. (chinchas hediondas), Leptocorisa oratorius, Leptocorisa varicornis, Lygus spp. (chinche de plantas), Lygus hesperus (chinche de plantas manchada de Occidente), Maconellicoccus hirsutus,
10 Neurocolpus longirostris, Nezara viridula (chinche hedionda verde del sudeste), Phytocoris spp. (chinche de plantas), Phytocoris californicus, Phytocoris relativus, Piezodorus guildingi, Poecillocapsus lineatus (chinche de plantas de cuatro líneas), Psallus
15 vaccinicola, Pseudacysta perseae, Scaptocoris castanea, y Triatoma spp. (chinchas nariz de cono chupasangre).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Homópteros (áfidos, cocos, moscas blancas, langostas de**
20 **hojas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen, pero sin limitación, Acrythosiphon pisum (áfido de la arveja), Adelges spp. (adélgidos),

Aleurodes proletella (mosca blanca del repollo),
Aleurodicus disperses, Aleurothrixus floccosus (mosca
blanca lanosa), Aluacaspis spp., Amrasca bigutella
bigutella, Aphrophora spp. (langosta de las hojas),
5 Aonidiella aurantii (cochinilla roja australiana),
Aphis spp. (áfidos), Aphis gossypii (áfido del
algodón), Aphis pomi (áfido de la manzana), Aulacorthum
solani (pulgón de las solanáceas), Bemisia spp. (moscas
blancas), Bemisia argentifolii, Bemisia tabaci (mosca
10 blanca de la batata), Brachycolus noxius (áfido ruso),
Brachycorynella asparagi (áfido del espárrago),
Brevennia rehi, Brevicoryne brassicae (áfido del
repollo), Ceroplastes spp. (cochinillas), Ceroplastes
rubens (cochinilla roja de la cera), Chionaspis
15 spp. (cochinillas), Chrysomphalus spp. (cochinillas),
Coccus spp. (cochinillas), Dysaphis plantaginea (áfido
rosado de la manzana), Empoasca spp. (langosta de
hoja), Eriosoma lanigerum (áfido lanoso de la manzana),
Icerya purchasi (queresa algodonosa), Idioscopus
20 nitidulus (langosta de la hoja del mango), Laodelphax
striatellus (langosta de planta marrón más pequeña),
Lepidosaphes spp., Macrosiphum spp., Macrosiphum

- euphorbiae (áfido de la papa), Macrosiphum granarium (áfido inglés de grano), Macrosiphum rosae (áfido de la rosa), Macrosteles quadrilineatus (langsota de la hoja del áster), Mahanarva frimbiolata, Metopolophium
- 5 dirhodum (áfido de grano rosa), Mictis longicornis, Myzus persicae (áfido del durazno verde), Nephotettix spp. (saltamontes), Nephotettix cinctipes (saltamontes verde), Nilaparvata lugens (saltamontes marrón),
- Parlatoria pergandii (cochinilla de la paja),
- 10 Parlatoria ziziphi (cochinilla del ébano), Peregrinus maidis (delfácido del maíz), Philaenus spp. (gusano escupidor), Phylloxera vitifoliae (filloxera de la vid), Physokermes piceae (cochinilla del brote del abeto), Planococcus spp. (piojos harinosos),
- 15 Pseudococcus spp. (piojos harinosos), Pseudococcus brevipes (piojo harinoso del ananá), Quadraspidiotus perniciosus (cochinilla de San José), Rhapalosiphum spp. (áfidos), Rhapalosiphum maida (áfido de la hoja de maíz), Rhapalosiphum padi (áfido de la avena),
- 20 Saissetia spp. (cochinillas), Saissetia oleae (cochinilla negra), Schizaphis graminum (chinche verde), Sitobion avenae (áfido inglés de granos),

Sogatella furcifera (langosta de plantas de dorso blanco), Therioaphis spp. (áfidos), Toumeyella spp. (cochinillas), Toxoptera spp. (áfidos), Trialeurodes spp. (moscas blancas), Trialeurodes vaporariorum (mosca
5 blanca de invernadero), Trialeurodes abutiloneus (mosca blanca con alas de bandas), Unaspis spp. (cochinillas), Unaspis yanonensis (cochinilla con cabeza de flecha), y Zulia entreriana.

En otra realización, la invención descrita en
10 este documento se puede utilizar para controlar **Himenópteros (hormigas, avispas y abejas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, Acromyrmex spp., Athalia rosae, Atta spp. (hormigas cortadoras de hojas), Camponotus spp.
15 (hormigas carpinteras), Diprion spp. (moscas de sierra), Formica spp. (hormigas), Iridomyrmex humilis (hormiga argentina), Monomorium ssp., Monomorium minumum (pequeña hormiga negra), Monomorium pharaonis (hormiga faraona), Neodiprion spp. (moscas de sierra),
20 Pogonomyrmex spp. (hormigas cosechadoras), Polistes spp. (avispa de papel), Solenopsis spp. (hormiga de fuego), Tapinoma sessile (hormiga olorosa del hogar),

Tetranomorium spp. (hormigas de pavimento), Vespula spp. (avispa de pintas amarillas), y Xylocopa spp. (abejas carpinteras).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Isópteros (termitas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, Coptotermes spp., Coptotermes curvignathus, Coptotermes frenchii, Coptotermes formosanus (termita subterránea de Formosa), Cornitermes spp. (termitas nasute), Cryptotermes spp. (termitas de la madera seca), Heterotermes spp. (termitas subterráneas del desierto), Heterotermes aureus, Kalotermes spp. (termitas de la madera seca), Incistitermes spp. (termitas de la madera seca), Macrotermes spp. (termitas de crecimiento de hongos), Marginitermes spp. (termitas de la madera seca), Microcerotermes spp. (termitas cosechadoras), Microtermes obesi, Procornitermes spp., Reticulitermes spp. (termitas subterráneas), Reticulitermes banyulensis, Reticulitermes grassei, Reticulitermes flavipes (termita subterránea del Este), Reticulitermes hageni, Reticulitermes hesperus (termita subterránea

del oeste), *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, *Reticulitermes virginicus*, *Schedorhinotermes* spp., and *Zootermopsis* spp. (termitas de raíces podridas).

- 5 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Lepidópteros (polillas y mariposas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, *Achoea janata*, *Adoxophyes* spp., *Adoxophyes*
- 10 *orana*, *Agrotis* spp. (gusanos cortadores), *Agrotis ipsilon* (gusano cortador negro), *Alabama argillacea* (gusano de la hoja de algodón), *Amorbia cuneana*, *Amyelosis transitella* (gusano de las naranjas navel), *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella* (taladro
- 15 pequeño del durazno), *Anomis sabulifera* (oruga del yute), *Anticarsia gemmatalis* (oruga del frijo terciopelo), *Archips argyrospila* (enrollador de hojas de árboles frutales), *Archips rosana* (enrollador de hojas de la rosa), *Argyrotaenia* spp. (polillas
- 20 tortricidas), *Argyrotaenia citrana* (tortrix de la naranja), *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara* (doblador de la hoja de arroz), *Bucculatrix*

thurberiella (perforador de la hoja de algodón),
Caloptilia spp. (mineros de hojas), Capua reticulana,
Carposina niponensis (polilla del fruto del durazno),
Chilo spp., Chlumetia transversa (perforador de los
5 brotes del mango), Choristoneura rosaceana (enrollador
de la hoja de bandas oblicuas), Chrysodeixis spp.,
Cnaphalocerus medinalis (enrollador del pasto), Colias
spp., Conpomorpha cramerella, Cossus cossus (polilla
carpintera), Crambus spp. (gusano del césped), Cydia
10 funebrana (polilla de la ciruela), Cydia molesta
(polilla del fruto oriental), Cydia nignicana (polilla
de la arveja), Cydia pomonella (polilla de la manzana),
Darna diducta, Diaphania spp. (taladros del tallo),
Diatraea spp. (taladros del pedúnculo), Diatraea
15 saccharalis (taladro de la caña de azúcar), Diatraea
graniosella (taladro del maíz del sudoeste), Earias
spp. (gusanos belloteros), Earias insulata (gusano
bellotero egipcio), Earias vitella (gusano bellotero
áspero del noreste), Ecdytopopha aurantianum,
20 Elasmopalpus lignosellus (taladro menor del pedúnculo
del maíz), Epiphysias postruttana (polilla marrón claro
de la manzana), Ephestia spp. (polillas de la harina),

Ephestia cautella (polilla de la almendra), Ephestia
elutella (polilla del tabaco), Ephestia kuehniella
(polilla mediterránea de la harina), Epimeces spp.,
Epinotia aporema, Erionota thrax (saltador del banano),
5 Eupoecilia ambiguella (polilla de la uva), Euxoa
auxiliaris (gusano cortador ejército), Feltia spp.
(gusanos cortadores), Gortyna spp. (taladros del
tallo), Grapholita molesta (polillas de frutos
orientales), Hedylepta indicata (enmarañador de hojas
10 de poroto), Helicoverpa spp. (polillas noctuid),
Helicoverpa armigera (gusano bellotero del algodón),
Helicoverpa zea (gusano bellotero/gusano de elote de
maíz), Heliothis spp. (polillas noctuid), Heliothis
virescens (gusano de brotes del tabaco), Hellula
15 undalis (gusano tejedor de repollo), Indarbela spp.
(taladros de raíz), Keiferia lycopersicella (oxiuros
del tomate), Leucinodes orbonalis (taladro de la planta
de berenjena), Leucoptera malifoliella, Lithocolletis
spp., Lobesia botrana (polilla del pomelo), Loxagrotis
20 spp. (polillas noctuid), Loxagrotis albicosta (gusano
cortador de porotos de occidente), Lymantria dispar
(polilla gitana), Lyonetia clerkella (minero de la hoja

del manzano), *Mahasena corbetti* (bicho canasto de palma de aceite), *Malacosoma* spp. (bicho canasto), *Mamestra brassicae* (gusano militar de repollo), *Maruca testulalis* (taladro de la vaina de porotos), *Metisa*
5 *plana* (bicho canasto), *Mythimna unipuncta* (oruga militar verdadera), *Neoleucinodes elegantalis* (taladro pequeño del tomate), *Nymphula depunctalis* (gusano de caja de arroz), *Operophtera brumata* (polilla de invierno), *Ostrinia nubilalis* (taladro europeo de
10 maíz), *Oxidia vesulia*, *Pandemis cerasana* (tortrix de grosella común), *Pandemis heparana* (tortrix de manzano marrón), *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella* (gusano belloero rosa), *Peridroma* spp. (gusanos cortadores), *Peridroma saucia* (gusano cortador
15 variegado), *Perileucoptera coffeella* (minero blanco de la hoja del café), *Phthorimaea operculella* (polilla del tubérculo de papa), *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp. (mineros de hojas), *Pieris rapae* (gusano del repollo importado), *Plathypena scabra*,
20 *Plodia interpunctella* (polilla de comida india), *Plutella xylostella* (polilla dorso de diamante), *Polychrosis viteana* (polilla de la uva), *Prays*

endocarpa, *Prays oleae* (polilla de oliva), *Pseudaletia* spp. (polillas noctuid), *Pseudaletia unipunctata* (gusano militar), *Pseudoplusia includens* (oruga del poroto de soja), *Rachiplusia* nu, *Scirpophaga*
5 *incertulas*, *Sesamia* spp. (taladros de tallos), *Sesamia inferens* (taladro rosa del tallo de arroz), *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella* (polilla del grano Angoumois), *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera* spp. (gusanos militares), *Spodoptera exigua*
10 (gusano militar de la remolacha), *Spodoptera fugiperda* (gusano militar de otoño), *Spodoptera oridania* (gusano militar del sudeste), *Synanthedon* spp. (taladros de la raíz), *Thecla basilides*, *Thermisia gemmatalis*, *Tineola bisselliella* (polilla tejedora de la ropa),
15 *Trichoplusia ni* (oruga del repollo), *Tuta absoluta*, *Yponomeuta* spp., *Zeuzera coffeae* (taladro rojo de las ramas), y *Zeuzera pirina* (polilla leopardo).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar
20 **Malófagos (piojos chupadores)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen, pero sin limitación, *Bovicola ovis* (piojo masticador de oveja), *Menacanthus*

stramineus (piojo corporal del pollo), y Menopon gallinea (piojo de gallina común).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar

5 **Ortópteros (saltamontes, langostas, y grillos)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, Anabrus simplex (grillo mormón), Gryllotalpidae (grillos topo), Locusta migratoria, Melanoplus spp. (saltamontes), Microcentrum retinerve

10 (chicharra de alas angulares), Pterophylla spp. (chicharras), chistocerca gregaria, Scudderia furcata (chicharra de arbustos de cola tenedor), y Valanga nigricorni.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar

15 **Ftirápteros (piojos succionadores)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, Haematopinus spp. (piojos de ganado bovino y porcino), Linognathus ovillus (piojo de oveja),

20 Pediculus humanus capitis (piojo corporal humano), Pediculus humanus humanus (piojo corporal humano), y Pthirus pubis (ladilla),

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Sifonápteros (pulgas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, Ctenocephalides
5 canis (pulgas de perros), Ctenocephalides felis (pulgas de gatos), y Pulex irritans (pulgas humanas).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Tisanópteros (trips)**. Una lista no exhaustiva de estas
10 plagas incluye, pero sin limitación, Frankliniella fusca (trips de tabaco), Frankliniella occidentalis (trips de flores occidentales), Frankliniella shultzei Frankliniella williamsi (trips de maíz), Heliothrips haemorrhaidalis (trips de invernadero),
15 Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Scirtothrips citri (trips de citrus), Scirtothrips dorsalis (trips amarillos del té), Taeniothrips rhopalantennalis, y Thrips spp.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Tisanuros (colas de cerda)**. Una lista no exhaustiva de
20

estas plagas incluye, pero sin limitación, *Lepisma* spp. (pececillo de plata) y *Thermobia* spp. (firebrats).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Acarina**
5 **(ácaros y garrapatas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, *Acarapsis woodi* (ácaros traqueales de las abejas de la miel), *Acarus* spp. (ácaros de los alimentos), *Acarus siro* (ácaros de los granos), *Aceria mangiferae* (ácaros de brotes de
10 mango), *Aculops* spp., *Aculops lycopersici* (ácaros del bronceado del tomate), *Aculops pelekasi*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali* (ácaros de la roya de la manzana), *Amblyomma americanum* (garrapata estrella solitaria), *Boophilus* spp. (garrapatas), *Brevipalpus*
15 *obovatus* (ácaro de la lepra explosiva), *Brevipalpus phoenicis* (ácaro plano rojo y negro), *Demodex* spp. (ácaros del mango), *Dermacentor* spp. (garrapatas duras), *Dermacentor variabilis* (garrapata americana del perro), *Dermatophagoides pteronyssinus* (ácaro del polvo
20 del hogar), *Eotetranychus* spp., *Eotetranychus carpini* (ácaro araña amarillo), *Epitimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp. (garrapatas), *Metatetranychus* spp.,

Notoedres cati, Oligonychus spp., Oligonychus coffee,
 Oligonychus ilicus (ácaro rojo del sudeste), Panonychus
 spp., Panonychus citri (ácaro rojo del citrus,
 Panonychus ulmi (ácaro rojo europeo), Phyllocoptruta
 5 oleivora (ácaro de la roya del citrus),
 Polyphagotarsonemus latus (ácaro blanco), Rhipicephalus
 sanguineus (ácaro marrón del perro), Rhizoglyphus spp.
 (ácaros de los bulbos), Sarcoptes scabiei (ácaros de la
 sarna), Tegolophus perseiflorae, Tetranychus spp.,
 10 Tetranychus urticae (ácaro araña de dos manchas), y
 Varroa destructor (ácaro de la abeja de la miel).

En otra realización, la invención descrita en
 este documento se puede utilizar para controlar
Nemátodos (nemátodos). Una lista no exhaustiva de estas
 15 plagas incluye, pero sin limitación, Aphelenchoides
 spp. (nemátodos de la madera de pinto, brotes y hojas),
 Belonolaimus spp. (nemátodos picadores), Crictonemella
 spp. (nemátodos anulares), Dirofilaria immitis (gusano
 del corazón del perro), Ditylenchus spp. (nemátodos de
 20 tallos y bulbos), Heterodera spp. (nemátodos de
 quistes), Heterodera zeae (nemátodo de quiste del
 maíz), Hirschmanniella spp. (nemátodos de la raíz),

Hoplolaimus spp. (nemátodos lance), Meloidogyne spp. (nemátodos de nudos de la raíz), Meloidogyne incognita (nemátodos de nudos de la raíz), Onchocerca volvulus (gusano cola de gancho), Pratylenchus spp. (nemátodos
5 de lesiones), Radopholus spp. (nemátodos barrenadores), y Rotylenchus reniformis (nemátodos con forma de riñón).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar
10 **Sínfilos (sinfilanos)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero sin limitación, Scutigerella immaculata.

Para mayor información, consultar "Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control
15 of Household Pests" de Arnold Mallis, 9° Edición, derechos de autor 2004 por GIE Media Inc.

Mezclas

Algunos de los plaguicidas que se pueden utilizar de manera beneficiosa en combinación con la invención
20 descrita en este documento incluyen, pero sin limitación, los siguientes:

- 1,2 dicloropropano, 1,3 dicloropropeno, abamectin,
acefato, acequinocil, acetamiprid, acetión, acetoprol,
acrinatrin, acrilonitrilo, alanicarb, aldicarb,
aldoxicarb, aldrin, aletrin, alosamidin, alixicarb,
5 alfa-cipermetrin, alfa-ecdisona, alfa-endosulfan AKD-
1022, amiditi3n, amidoflumet, aminocarb, amit3n,
amitraz, anabasina, 3xido de ars3nio, atidati3n,
azadiractin, azametifos, azinfos etilo, azinfos metilo,
azobenceno, azociclotin, azotoato,
- 10 *Bacillus thuringiensis*, hexafluorsilicato de
bario, bartrin, benclotiaz, bendiocarb, benfuracarb,
benomil, benoxafos, bensultap, benzoximato, benzoato de
bencilo, beta-ci flutrin, beta-cipermetrin, bifenazato,
bifentrin, binapacril, bioaletrin, bioetanometrin,
15 biopermetrin, bistrifluron, borax, 3cido b3rico,
bromfenvinfos, bromo DDT, bromociclen, bromofos,
bromofos etilo, bromopropiloato, bufencarb, buprofezin,
butacarb, butatiofos, butocarboxim, butonato,
butoxicarboxim,
- 20 cadusafos, arsenato de calcio, polisulfuro de
calcio, canfeclor, carbanolato, carbarilo, carbofuran,

disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono,
carbofenotion, carbosulfan, cartap, quinometionat,
clorantraniliprol, clorbensida, clorbiciclen, clordano,
clordecona, clordimeform, cloretoxifos, clorfenapir,
5 clorfenetol, clorfenson, clorfensulfuro, clorfenvinfos,
clorfluazuron, clormefos, clorobencilato, 3-(4-cloro-
2,6-diemtilfenil)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaspiro[4,5]dec-3-
en-2-ona, 3-(4'-cloro-2,4-dimetil[1,1'-bifenil]-3-il)-
4-hidroxi-8-oxa-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona, 4-[[(6-
10 cloro-3-piridinil)metil]metilamino]-2(5H)-furanona, 4-
[[(6-cloro-3-piridinil)metil]ciclopropiloamino]-2(5H)-
furanona, 3-cloro-N2-[(1S)-1-metilo-2-(metilsulfonil)
etil]-N1-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-
(trifluormetil)etil]fenil]-1,2-bencendicarboxamida,
15 cloroform, cloromebuform, clorometiurón, cloropicrin,
cloropropiloato, clorfoxim, clorprazofos, clorpirifos,
clorpirifos-metilo, clortiofos, cromafenozida, cinerin
I, cinerin II, cismetrin, cloetocarb, clofentezina,
closantel, clotianidin, acetoarsenita de cobre,
20 arsenato de cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre,
coumafos, coumitoato, crotamiton, crotoxifos,
cruentaren A y B, crufomato, criolita, cianofenfos,

cianofos, ciantoato, ciantraniliprol, ciclettrin,
 cicloprotrin, cienopirafen, ciflumetofen, ciflutrin,
 cihalotrin, cihexatin, cipermetrin, cifenotrin,
 ciromazina, citioato, 2-ciano-N-etil-4-fluor-3-metoxi-
 5 benenesulfonamida, 2-ciano-N-etil-3-metoxi-
 bencensulfonamida, 2-ciano-3-difulormetoxi-N-etil-4-
 fluor-bencensulfonamida, 2-ciano-3-fluormetoxi-N-etil-
 bencensulfonamida, 2-ciano-6-fluor-3-metoxi-N,N-
 dimetil-bencensulfonamida, 2-ciano-N-etil-6-fluor-3-
 10 metoxi-N-metil-bencensulfonamida, 2-ciano-3-
 difluormetoxi-N,N-dimetil-bencensulfonamida.

d-limoneno, dazomet, DBCP, DCIP, DDT,
 decarbofuran, deltametrin, demefion, demefion O,
 demefion S, demeton, demeton metilo, demeton O, demeton
 15 O metilo, demeton S, demeton S metilo, demeton S
 metilosulfon, diafentiuron, dialifos, diamidafos,
 diazinon, dicapton, diclofention, diclofluanid,
 diclorvos, dicofol, dicresil, dicrotofos, diciclanil,
 dieldrin, dienoclor, diflovidazin, diflubenzuron, 3-
 20 (difluormetil)-N-[2-(3,3-dimetilbutil)fenil]-1-metil-
 1H-pirazol-4-carboxamida dilor, dimeflutrin, dimefox,
 dimetan, dimetoato, dimetrin, dimetilovinfos,

dimetilan, dinex, dinobuton, dinocap, dinocap 4,
dinocap 6, dinocton, dinopenton, dinoprop, dinosam,
dinosulfon, dinotefuran, dinoterbon, diofenolan,
dioxabenzofos, dioxacarb, dioxation, difenil sulfona,
5 disulfiram, disulfoton, diticrofos, DNOC, dofenapin,
doramectin,

ecdiesterona, emamectin, EMPC, empentrin,
endosulfan, endotion, endrin, EPN, epofenonano,
eprinomectin, esfenvalerato, etafos, etiofencarb,
10 etion, etiprol, etoato metilo, etoprofos, etilo DDD,
formiato de etilo, dibromuro de etileno, dicloruro de
etileno, óxido de etileno, etofenprox, etoxazol,
etrimfos, EXD,

F1050, famfur, fenamifos, fenazaflor, fenazaquin,
15 óxido de fenbutaestaño, fenclorfos, fenetacarb,
fenflutrin, fenitrotion, fenobucarb, fenotiocarb,
fenoxacrim, fenoxicarb, fenpiritrin, fenpropatrin,
fenpiroximato, fenson, fensulfotion, fention, fention
etilo, fentrifanil, fenvalerato, fipronil, FKI-1033,
20 flonicamid, fluacripirim, fluazurón, flubendiamida,
flubenzimina, flucofurón, fluciclofurón, flucitrinato,

fluenetil, flufenerim, flufenoxuron, flufenprox,
 flumetrin, fluorbensida, fluvalinato, fonofos,
 formetanato, formotion, formparanato, fosmetilan,
 fospirato, fostiazato, fostietán, fostietán,
 5 furatiocarb, furetrin, furfural,

Gamma-cihalotrin, gamma-HCH,

halfenprox, halofenozida, HCH, HEOD, heptaclor,
 heptenofos, heterofos, hexaflumurón, hexitiazox, HHDN,
 hidrametilonon, cianuro de hidrógeno, hidropreno,
 10 hiquincarb,

imiciafos, imidacloprid, imiprotrin, indoxacarb,
 iodometano, IPSP, isamidofos, isazofos, isobenzan,
 isocarbofos, isodrin, isofenfos, isoprocarb,
 isoprotiolano, isotioato, isoxation, ivermectin,

15 jasmolin I, jasmolin II, jodfenfos, hormon juvenil
 I, hormona juvenil II, hormona juvenil III, JS118,

kelevan, kinopreno,

lambda-cihalotrin, arsenato de plomo, lepimectin,
 leptofos, lindan, lirimfos, lufenuron, litidation,

malation, malonoben, mazidox, mecarbam, mecarfon,
menazon, mefosfolan, cloruro de mercurio, mesulfen,
mesulfenfos, metaflumizone, metam, metacrifos,
metamidofos, metidation, metiocarb, metocrotofos,
5 metomil, metopreno, metoxiclor, metoxifenozida, bromuro
de metilo, isotiocianato de metilo, metilocloroformo,
cloruro de metileno, metoflutrin, metolcarb,
metoxadiazona, mevinfos, mexacarbato, milbemectin,
milbemecin oxima, mipafox, mirex, MNAF, monocrotofos,
10 morfotion, moxidectin,

naftalofos, naled, naftaleno, N-etil-2,2-
dimetilpropionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluor-p-
tolilo)hidrazona, N-etil-2,2-dicloro-1-metilciclopropan
-carboxamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)
15 hidrazona, nicotina, nifluridida, nikomicinas,
nitenpiram, nitiazina, nitrilacarb, novaluron,
noviflumuron,

ometoato, oxamil, oxidemeton metilo, oxideprofos,
oxidisulfoton,
20 paradiclorobenceno, paration, paration metilo,
penfluron, pentaclorofenol, permetrin, fenkapton,

fenotrin, fentoato, forato, fosadona, fosfolán, fosmet,
fosniclor, fosfamidon, fosfino, fosfocarb, foxim, foxim
metilo, pirimetafos, pirimicarb, pirimifos etilo,
pirimifos metilo, arsenito de potasio, tiocianato de
5 potasio, pp' DDT, praletrin, precoceno I, precoceno II,
precoceno III, primidofos, proclonol, profenofos,
proflutrin, promacil, promecarb, propafos, propargita,
propetamfos, propoxur, protidación, protiofos,
protoato, protrifenbuto, piraclofos, pirafluprol,
10 pirazofos, piresmetrin, piretrin I, piretrin II,
piridaben, piridalilo, piridafention, pirifluquinazon,
pirimidifen, pirimitato, piriprol, piriproxifen,

Qcide, quassia, quinalfos, quinalfos, quinalfos
metilo, quinotion, quantifies,

15 rafoxanida, resmetrin, rotenona, riania,

sabadilla, scradan, selamectin, silafluofen,
arsenito de sodio, fluoruro de sodio, hexafluorsilicato
de sodio, tiocianato de sodio, sofamida, espinetoram,
espinosad, espiroclorfen, espiromesifen,
20 espirotetramat, sulcofurón, sulfiram, sulfluramid,

sulfotep, sulfoxaflor, azufre, fluoruro de sulfurilo,
sulprofos,

tau-fluvalinato, tazimcarb, TDE, tebufenozida,
tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzurón, teflutrin,
5 temefos, TEPP, teraletrin, terbufos, tetracloroetano,
tetraclorvinfos, tetradifón, tetrametrin, tetranactin,
tetrasul, teta cipermetrin, tiacloprid, tiametoxam,
ticrofos, tiocarboxima, tiociclam, tiodicarb, tiofanox,
tiometón, tionazin, tioquinox, tiosultap, turingiensin,
10 tolfenpirad, tralometrin, transflutrin, transpermetrin,
triarateno, triazamato, triazofos, triclorfon,
triclormetafos 3, tricloronat, trifenofos, triflumurón,
trimetacarb, tripreno,

vamidotión, vamidotión, vaniliprol, vaniliprol,

15 XDE-208, XMC, xililocarb,

Zeta-cipermetrin y zolaprofos.

Adicionalmente, se puede utilizar cualquier
combinación de los plaguicidas mencionados
precedentemente.

La invención descrita en el presente documento se puede utilizar también con herbicidas y fungicidas, por razones de economía y sinergismo.

La invención descrita en el presente documento se
5 puede utilizar con antimicrobianos, bactericidas, desfoliantes, aseguradores, sinergistas, alguicidas, atrayentes, desecantes, feromonas, repelentes, baños desinfectantes para animales, avicidas, desinfectantes, semioquímicos, y moluscocidas (estas categorías no son
10 necesariamente mutuamente exclusivas) por razones de economía y sinergia.

Para mayor información, consultar el "Compendium of Pesticide Common Names", ubicado en <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html> a partir
15 de la fecha de presentación del presente documento. Incluso, consultar el "The Pesticide Manual" 14ª Edición, editado por C D S Tomlin, derechos de autor 2006, por British Crop Production Council.

Mezclas sinérgicas

20 La invención descrita en el presente documento se puede utilizar con otros compuestos como, por ejemplo,

los mencionados bajo el título "Mezclas" a los efectos de formar mezclas sinérgicas donde el modo de acción de los compuestos en las mezclas son iguales, similares o diferentes.

5 Los ejemplos de los modos de acción incluyen, pero sin limitación: inhibidor de acetil colina esterasa; modulador del canal de sodio; inhibidor de la biosíntesis de la quitina; antagonista del canal de cloruro dependiente del GABA; agonista del canal del
10 cloruro dependiente de GABA y glutamato; agonista del receptor acetil colina; inhibidor MET I; inhibidor ATPasa estimulado por Mg; receptor de acetilcolina nicotínico; disruptor de la membrana del intestino medio; y el disruptor de la fosforilación oxidante.

15 Adicionalmente, los siguientes compuestos se conocen como sinergistas y se pueden utilizar con la invención descrita en este documento: butóxido de piperonilo, piprotal, propil isoma, sesamex, sesamolin, y sulfóxido.

20 **Formulaciones**

Un plaguicida raramente es adecuado para aplicarse en forma pura. Generalmente, es necesario agregar otras sustancias de manera que el plaguicida se pueda usar en la concentración requerida y en forma adecuada, permitiendo una fácil aplicación, fácil manipulación, transporte, almacenamiento y una máxima actividad plaguicida. Por lo tanto, los plaguicidas se formulan, por ejemplo, en sebos, emulsiones concentradas, polvos, concentrados emulsionables, fumigantes, geles, gránulos, microencapsulaciones, tratamientos de semillas, concentrados en suspensión, suspoemulsiones, comprimidos, líquidos solubles en agua, gránulos dispersables en agua o polvos fluibles secos, polvos humectables y soluciones de volúmenes ultra bajos.

Para mayor información sobre los tipos de formulaciones, véase la monografía técnica "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system" nro. 2, 5ª Edición de CropLife International (2002).

Los plaguicidas se aplican con mayor frecuencia en forma de suspensiones o emulsiones acuosas preparadas a partir de formulaciones concentradas de dichos

plaguicidas. Estas formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua, o emulsionables son generalmente sólidos, conocidos comúnmente como polvos humectables, o gránulos dispersables en agua, o líquidos conocidos
5 generalmente como concentrados emulsionables, o suspensiones acuosas. Los polvos humectables, que se pueden compactar para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima del plaguicida, un vehículo, y tensioactivos. La concentración del
10 plaguicida es generalmente de alrededor de 10% a alrededor de 90% en peso. El vehículo se elige generalmente entre las arcillas de atapulguita, arcillas de montmorillonita, tierras diatomáceas, o silicatos purificados. Los tensioactivos efectivos, que
15 comprenden desde aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10% del polvo humectable, se encuentran entre ligninas sulfonadas, naftalensulfonatos condensados, naftalensulfonatos, alquilbencensulfonatos, alquil sulfatos, y tensioactivos no iónicos como, por ejemplo,
20 aductos de óxido de etileno de alquilfenoles.

Los concentrados emulsionables de plaguicidas comprenden una concentración conveniente de un

plaguicida, como, por ejemplo, de aproximadamente 50 hasta aproximadamente 500 gramos por litro de líquido disuelto en un vehículo que es un solvente miscible en agua o una mezcla de solvente orgánico inmiscible en
5 agua y emulsionantes. Los solventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente fracciones de xilenos y petróleo, especialmente las porciones naftalénicas y olefínicas de alta ebullición de petróleo como, por ejemplo, nafta aromática pesada.
10 Otros solventes orgánicos pueden usarse también, como, por ejemplo, los solventes terpénicos que incluyen derivados de rosin, cetonas alifáticas como, por ejemplo, ciclohexanona, y alcoholes complejos como, por ejemplo, 2-etoxietanol. Los emulsionantes adecuados
15 para concentrados emulsionables se eligen a partir de tensioactivos aniónicos y no iónicos convencionales.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de plaguicidas insolubles en agua dispersadas en un vehículo acuoso a una concentración en el rango de
20 aproximadamente 5% a aproximadamente 50% en peso. Las suspensiones se preparan moliendo finamente el plaguicida y mezclándolo vigorosamente con un vehículo

que comprende agua y tensioactivos. Se pueden agregar también ingredientes, como, por ejemplo, sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales, a los efectos de aumentar la densidad y la viscosidad del
5 vehículo acuoso. Con frecuencia, resulta más efectivo moler y mezclar el plaguicida al mismo tiempo preparando la mezcla acuosa y homogenizándola en un elemento como, por ejemplo, un molino de arena, un molino de bola, o un homogenizador tipo pistón.

10 Los plaguicidas se pueden aplicar también como composiciones granulares particularmente útiles para aplicaciones al suelo. Las composiciones granulares contienen generalmente desde aproximadamente 0,5% hasta aproximadamente 10% en peso del plaguicida, dispersadas
15 en un vehículo que comprende arcilla o una sustancia similar. Dichas composiciones se preparan generalmente disolviendo el plaguicida en un solvente adecuado y aplicándolo a un vehículo granulado que se ha preformado al tamaño de partícula adecuado, en el rango
20 de aproximadamente 0,5 a 3 mm. Estas composiciones se pueden formular también mediante la preparación de una masa o pasta del vehículo y el compuesto y su

trituration y secado para obtener el tamaño de partícula granular deseado.

Los polvos que contienen un plaguicida se preparan mezclando completamente el plaguicida en polvo con un
5 vehículo agrícola polvoriento, como, por ejemplo, arcilla caolín, roca volcánica triturada, y similares. Los polvos pueden contener adecuadamente de aproximadamente 1% a aproximadamente 10% del plaguicida. Ellos se pueden aplicar en forma de
10 agregado para semillas o como aplicación al follaje con una máquina atomizadora de polvo.

Resulta igualmente práctico aplicar un plaguicida en forma de solución en un solvente orgánico adecuado, generalmente aceite de petróleo, como, por ejemplo, los
15 aceites de atomización, que se utilizan ampliamente en la química agrícola.

Los plaguicidas se pueden aplicar también en forma de una composición en aerosol. En estas composiciones, el plaguicida se disuelve o dispersa en un vehículo,
20 que consiste en una mezcla propulsora generadora de presión. La composición en aerosol se envasa en un

recipiente del cual se administra la mezcla a través de una válvula atomizadora.

Los sebos plaguicidas se forman cuando el plaguicida se mezcla con alimentos o con un atrayente o
5 ambos. Cuando las plagas ingieren el sebo, también ingieren el plaguicida. Los sebos pueden tomar la forma de gránulos, geles, polvos fluibles, líquidos, o sólidos. Se utilizan en refugios de plagas.

Los fumigantes son plaguicidas que poseen una
10 presión de vapor relativamente alta y, por ende, pueden existir como un gas en concentraciones suficientes para matar las plagas en el suelo o en espacios cerrados. La toxicidad del fumigante es proporcionara a su concentración y al tiempo de exposición. Se
15 caracterizan por una buena capacidad de difusión y actúan penetrando el sistema respiratorio de la plaga o se absorben a través de la cutícula de la plaga. Los fumigantes se aplican a los efectos de controlar las plagas de productos almacenados bajo mantos a prueba de
20 gas, en ambientes de gas sellados o edificios o en cámaras especiales.

Los plaguicidas se pueden microencapsular mediante la suspensión de las partículas o gotas plaguicidas en polímeros de plástico de diversos tipos. Al alterar la química del polímero o al cambiar los factores en el
5 procesamiento, es posible formar microcápsulas de tamaños, solubilidad, grosores de paredes y grados de penetrabilidad diversos. Estos factores rigen la velocidad con la que se libera el ingrediente activo que se encuentra dentro, el cual, a su vez, afecta el
10 desempeño residual, la velocidad de acción y el olor del producto.

Los concentrados de la solución de aceite se realizan disolviendo el plaguicida en un solvente que contendrá el plaguicida en solución. Las soluciones de
15 aceite de un plaguicida generalmente proveen una reducción y matanza más rápidas de las plagas que otras formulaciones, ya que los solventes mismos poseen una acción plaguicida y la disolución de la cobertura cerosa del integumento aumenta la velocidad de
20 absorción del plaguicida. Otras ventajas de las soluciones de aceite incluyen una mejor estabilidad de

almacenamiento, una mejor penetración en grietas y una mejor adhesión a las superficies grasosas.

Otra realización consiste en una emulsión de aceite en agua, en donde la emulsión comprende glóbulos
5 oleosos, cada uno de los cuales se encuentra provisto de un recubrimiento de cristal líquido lamelar y están dispersos en una fase acuosa, en donde cada glóbulo oleoso comprende por lo menos un compuesto que agrícolamente activo y se encuentra recubierto
10 individualmente con una capa monolamelar u oligolamelar que comprende: (1) por lo menos un agente superficie-activo lipófilo no iónico, (2) por lo menos un agente superficie-activo hidrófilo no iónico, y (3) por lo menos un agente superficie-activo iónico, en donde los
15 glóbulos poseen un diámetro medio de partícula inferior a 800 nanómetros. Mayor información sobre la realización se encuentra descripta en la publicación de la patente de invención estadounidense 20070027034, publicada el 1 de febrero de 2007, con número de
20 solicitud de patente de invención Acta 11/495.228.

Para facilitar su uso, esta realización se mencionará como "OIWE".

Para mayor información, consultar "Insect Pest Management" 2º Edición, de D. Dent, derecho de autor
5 CAB International (2000). Adicionalmente, para mayor información detallada, consultar el "Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests", de Arnold Mallis, 9ª Edición, derechos de autor 2004, por GIE Media Inc.

10 **Otros componentes de la formulación**

Generalmente, la invención se describe en este documento cuando se la utiliza en una formulación. Dicha formulación puede contener también otros componentes. Estos componentes incluyen, pero sin
15 limitación, (se trata de una lista no exhaustiva y no mutuamente exclusiva) humectantes, esparcidores, adherentes, penetrantes, tampones, agentes de secuestro, agentes de reducción de deriva, agentes de compatibilidad, agentes antiespuma, agentes de limpieza

y emulsionantes. A continuación, se describen unos pocos componentes.

Un agente humectante consiste en una sustancia que al agregarse a un líquido, aumenta la potencia de
5 esparcido o penetración del líquido reduciendo la tensión interfacial entre el líquido y la superficie sobre la que se esparce. Los agentes humectantes se utilizan para dos funciones principales en las formulaciones agroquímicas: durante el procesamiento y
10 la fabricación para aumentar la velocidad de la humectación de los polvos en agua para preparar concentrados para líquidos solubles o concentrados en suspensión; y durante la mezcla de un producto con agua en un tanque de atomización a fin de reducir el tiempo
15 de humedecimiento de los polvos humectables y mejorar la penetración del agua en los gránulos dispersables en agua. Los ejemplos de agentes humectantes utilizados en las formulaciones de polvo humectable, concentrado en suspensión y gránulos dispersables en agua son:
20 laurilsulfato de sodio; dioctilsulfosuccinato de sodio;

fenoletoxilatos de alquilo; y etoxilatos de alcohol alifático.

Un agente dispersante es una sustancia que se adsorbe sobre la superficie de las partículas y contribuye a conservar el estado de dispersión de las partículas y evita que se reagreguen. Los agentes dispersantes se agregan a las formulaciones agroquímicas para facilitar la dispersión y la suspensión durante la manufactura, y asegurar que las partículas se redispersen en agua en un tanque de atomización. Se utilizan ampliamente en polvos humectables, concentrados en suspensión y gránulos dispersables en agua. Los tensioactivos que se utilizan como agentes dispersantes poseen la capacidad de adsorberse fuertemente sobre una superficie de partículas y proveer una barrera cargada o estérica al reagregado de partículas. Los tensioactivos utilizados más comúnmente son aniónicos, no iónicos o mezclas de estos dos tipos. Para la formulaciones en polvo humectable, los agentes dispersantes más comunes son lignosulfonatos de sodio. Para los concentrados en

suspensión, se obtiene una muy buena adsorción y estabilización con el uso de polielectrolitos, como, por ejemplo, condensados de naftalen sulfonato formaldehído de sodio. Se utilizan también fosfato
5 ésteres de etoxilatos de triestirilfenol. Los no-iónicos como, por ejemplo, condensados de óxido de alquilariletileno y copolímeros de bloques de EO-PO se combinan a veces con aniónicos como agentes dispersantes para los concentrados en suspensión. En
10 años recientes, se han desarrollado nuevos tipos de tensioactivos poliméricos de muy alto peso molecular como agentes dispersantes. Ellos poseen "estructuras principales" hidrófobas muy largas y una gran cantidad de cadenas de óxido de etileno que forman los "dientes"
15 de un tensioactivo en forma de "peine". Estos polímeros de alto peso molecular pueden proveer una muy buena estabilidad a largo plazo a los concentrados en suspensión debido a que las estructuras principales hidrófobas poseen muchos puntos de anclaje sobre las
20 superficies de las partículas. Los ejemplos de agentes dispersantes utilizados en las formulaciones agroquímicas son: lignosulfonatos de sodio; condensados

de naftalen sulfonato formaldehído de sodio; fosfato ésteres de etoxilato de triestirilfenol; etoxilatos de alcohol alifáticos; etoxilatos de alquilo; copolímeros de bloques de EO-PO; y copolímeros de injertos.

5 Un agente emulsionante es una sustancia que estabiliza una suspensión de gotas de una fase líquida en otra fase líquida. Sin el agente emulsionante, los dos líquidos se separarían en dos fases líquidas miscibles. Las combinaciones de emulsionantes
10 utilizadas comúnmente contienen alquilfenol o alcohol alifático con 12 o más unidades de óxido de etileno y la sal de calcio soluble en aceite del ácido dodecilobencensulfónico. Un rango de valores de equilibrio hidrófilo-lipófilo ("HLB") de 8 a 18
15 proveerá normalmente buenas emulsiones estables. La estabilidad de las emulsiones se puede mejorar a veces mediante la adición de una pequeña cantidad de un tensioactivo de copolímero de bloques de EO-PO.

20 Un agente solubilizante es un tensioactivo que formará micelas en agua a concentraciones superiores a la concentración crítica de micelas. Las micelas pueden entonces disolver o solubilizar los materiales

insolubles en agua dentro de la parte hidrófoba de la micela. Los tipos de tensioactivos utilizados para la solubilización son no iónicos: monooleatos de sorbitán; etoxilatos de monooleato de sorbitán; y ésteres de
5 oleato de metilo.

Los tensioactivos se utilizan a veces, ya sea solos o con otros aditivos como, por ejemplo, aceites minerales o vegetales como adyuvantes para mezclas de tanques de atomización a fin de mejorar el desempeño
10 biológico del plaguicida en el objetivo. Los tipos de tensioactivos utilizados para la biomejora dependen generalmente de la naturaleza y el modo de acción del plaguicida. Sin embargo, con frecuencia, son no iónicos como, por ejemplo: etoxilatos de alquilo; etoxilatos de
15 alcohol alifático lineales; etoxilatos de amina alifática.

Un vehículo o diluyente en una formulación agrícola es un material agregado al plaguicida para proveer un producto de la fuerza requerida. Los
20 vehículos generalmente consisten en materiales con altas capacidades de absorción, mientras que los diluyentes normalmente son materiales con bajas

capacidades de absorción. Los vehículos y diluyentes se utilizan en la formulación de polvos, polvos humectables, gránulos y gránulos dispersables en agua.

Los solventes orgánicos se utilizan,
5 principalmente, en la formulación de concentrados emulsionables, formulaciones de ULV, y en menor grado en formulaciones granulares. A veces, se utilizan mezclas de solventes. Los primeros grupos principales de solventes son aceites parafínicos alifáticos como,
10 por ejemplo, queroseno o parafinas refinadas. El segundo grupo principal y el más común comprende los solventes aromáticos como, por ejemplo, xileno y fracciones de mayor peso molecular de solventes aromáticos C9 y C10. Los hidrocarburos clorados son
15 útiles como cosolventes a fin de evitar la cristalización de plaguicidas cuando la formulación se emulsiona en agua. A veces, se utilizan alcoholes como cosolventes para aumentar el poder del solvente.

Los espesantes y agentes de gelificación se
20 utilizan, principalmente, en la formulación de concentrados en suspensión, emulsiones y suspoemulsiones para modificar la reología o las

propiedades del flujo del líquido y evitar la separación y sedimentación de las partículas o gotas dispersadas. Los agentes espesantes, gelificantes, y de antisedimentación generalmente quedan comprendidos en

5 dos categorías, a saber: macropartículas insolubles en agua y polímeros solubles en agua. Es posible producir formulaciones de concentrados en suspensión con el uso de arcillas y sílices. Los ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero sin limitación,

10 montmorillonita, por ejemplo bentonita; silicato de aluminio de magnesio; y attapulgita. Se han utilizado durante muchos años polisacáridos solubles en agua como agentes espesantes-gelificantes. Los tipos de polisacáridos utilizados más comúnmente son extractos

15 naturales de semillas y algas marinas o bien son derivados sintéticos de celulosa. Los ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero sin limitación, gomar guar; goma de algarroba; carragenan; alginatos; celulosa de metilo; carboximetilcelulosa de sodio

20 (SCMC); hidroxietil celulosa (HEC). Otros tipos de agentes de antisedimentación se basan en almidones modificados, poliacrilatos, alcohol de polivinilo y

óxido de polietileno. Otro agente antisedimentación bueno es la goma de xantán.

Los microorganismos estropean los productos formulados. Por lo tanto, se utilizan agentes de
5 conservación para eliminar o reducir su efecto. Los ejemplos de dichos agentes incluyen, pero sin limitación: ácido propiónico y su sal de sodio; ácido ascórbico y sus sales de sodio o potasio; ácido benzoico y sus sales de sodio; sal de sodio del ácido
10 p-hidroxibenzoico; p-hidroxibenzoato de metilo; y 1,2-benzisotiazalin-3-ona (BIT).

La presencia de tensioactivos, que disminuyen la tensión interfacial inferior, con frecuencia causa el espumado de las formulaciones a base de agua durante
15 las operaciones de mezcla en la producción y aplicación a través de un tanque de atomización. A los efectos de reducir la tendencia al espumado, se agregan, con frecuencia, agentes antiespuma, ya sea durante la etapa de producción o antes del rellenado en botellas.
20 Generalmente, existen dos tipos de agentes antiespuma, a saber siliconas y no siliconas. Las siliconas son, generalmente, emulsiones acuosas de dimetil

polisiloxano mientras los agentes antiespuma que no son de silicona son aceites insolubles en agua, como, por ejemplo, octanol y nonanol, o sílice. En ambos casos, la función del agente antiespuma consiste en desplazar
5 el tensioactivo de la interfaz de aire-agua.

Para mayor información, véase "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations", editado por D.A. Knowles, derechos de autor 1998 por Kluwer Academic Publishers. También, véase "Insecticides in
10 Agriculture and Environment - Retrospects and Prospects" de A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya, y R. Perry, derechos de autor 1998 por Springer-Verlag.

Aplicaciones

La cantidad real de plaguicida que se ha de
15 aplicar a los lugares de las plagas no es esencial y puede ser determinada fácilmente por los expertos en la técnica. En general, se espera que concentraciones de aproximadamente 0,01 gramos de plaguicida por hectárea hasta aproximadamente 5000 gramos de plaguicida por
20 hectárea provean un buen control.

El lugar en el que se aplica un plaguicida puede ser cualquier lugar habitado por una plaga, por ejemplo, cultivos vegetales, árboles frutales y nogales, viñedos, plantas ornamentales, animales
5 domésticos, superficies internas o externas de los edificios y el suelo que rodea dichos edificios.

Generalmente, con los sebos, éstos se aplican en el suelo donde, por ejemplo, las termitas pueden tomar contacto con el sebo. Los sebos se pueden aplicar
10 también a una superficie de un edificio, (superficie horizontal, vertical, o inclinada) donde, por ejemplo, las hormigas, termitas, cucarachas, y moscas pueden tener contacto con el sebo.

En virtud de la capacidad única de los huevos de
15 algunas plagas para resistir a los plaguicidas, puede ser conveniente realizar aplicaciones repetidas a los efectos de controlar las larvas recién nacidas.

El movimiento sistémico de los plaguicidas en los vegetales puede utilizarse para controlar plagas en una
20 porción de la planta mediante la aplicación de los plaguicidas a una porción diferente de la planta. Por ejemplo, el control de los insectos de alimentación

foliar se puede realizar mediante irrigación por goteo o aplicación en surcos, o bien mediante el tratamiento de las semillas antes de ser plantadas. El tratamiento de las semillas se puede llevar a cabo en todo tipo de
5 semillas, incluso aquellas de las cuales germinarán las plantas transformadas genéticamente de manera que expresen características especializadas. Los ejemplos representativos incluyen semillas o plantas que expresan proteínas y/o ARN de doble hebra tóxicos para
10 las plagas de invertebrados, como, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis*, toxinas Bt Cry, toxinas Bt Vip, ARNi, u otras toxinas insecticidas, aquellas que expresan resistencia herbicida, como, por ejemplo, semillas "Roundup Ready", o aquellas con genes extraños
15 "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia herbicida, aumento de la nutrición o cualesquiera otros rasgos beneficiosos. Además, dichos tratamientos de las semillas con la invención descrita en este documento puede incrementar además la capacidad
20 de una planta para soportar mejor las condiciones de crecimiento estresantes. Ello resulta en una planta más

saludable, más fuerte, que puede conducir a mayores rendimientos durante la cosecha.

Debería ser fácilmente evidente que la invención se puede utilizar con plantas genéticamente transformadas para expresar características especializadas, como, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis*, ARNi, u otras toxinas insecticidas, o aquellas que expresan resistencia herbicida, o aquellas con genes extraños "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia herbicida, aumento de la nutrición o cualesquiera otras características beneficiosas.

La invención descrita en este documento es adecuada para controlar endoparásitos y ectoparásitos en el sector de la medicina veterinaria o en el campo del cuidado de animales (que para evitar toda duda incluye mascotas, por ejemplo, gatos, perros y aves). Los compuestos de acuerdo con la invención se aplican en la presente de manera conocida, como, por ejemplo, mediante administración oral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, gránulos, mediante aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, inmersión,

atomización, vertido, manchado, y pulverización, y mediante administración parenteral en forma de, por ejemplo, una inyección.

La invención descrita en este documento se puede
5 emplear también de manera ventajosa en el cuidado del ganado, por ejemplo, ganado bovino, ovino, porcino, pollos y gansos. Las formulaciones adecuadas se administran en forma oral a los animales con el agua para beber o con el alimento. Las dosis y formulaciones
10 adecuadas dependen de las especies.

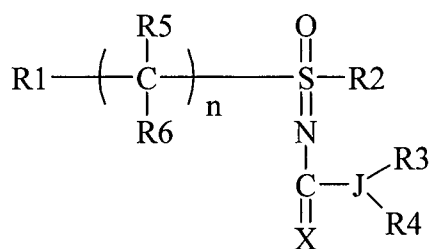
Antes de que un plaguicida se pueda utilizar o vender en el comercio, ese plaguicida es sometido a un proceso de evaluación prolongado por parte de diversas autoridades gubernamentales (locales, regionales,
15 estatales, nacionales, internacionales). Los requisitos de datos voluminosos son especificados por las autoridades reglamentarias y se deben abordar a través de la generación y presentación de datos por parte del registrante del producto o por otra persona
20 en representación del registrante del producto. Estas autoridades gubernamentales revisan entonces esos datos y si llegaren a una determinación de seguridad, proveen

al usuario o vendedor potencial la aprobación para el registro del producto. Posteriormente, en la localidad en la que se otorga y fundamenta el registro del producto, el usuario o vendedor puede utilizar o vender
5 dicho plaguicida.

Los títulos en este documento se proveen sólo por conveniencia y no deben utilizarse para interpretar ninguna parte del mismo.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que posee la siguiente fórmula (I)



(I)

en donde:

- 5 (a) R1 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}

haloalquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10, y heterociclilo;

- 5 (b) R2 es alquenilo C_2-C_8 , alqueniloxi C_2-C_8 , alqueniltio C_2-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alquilo C_1-C_8 , alquiltio C_1-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , alquiniloxi C_2-C_8 , alquiniltio C_2-C_8 , arilo, cicloalquenilo C_3-C_8 , cicloalqueniloxi C_3-C_8 , cicloalqueniltio C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquiltio C_3-C_8 , heterociclilo, o alquilo $C_0-C_8-C(=O)OR_8$, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , $S(=O)_{n_1}$ alquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), $S(=O)_{n_1}$ haloalquilo C_1-C_6 (donde $n_1=0-2$), OSO_2 haloalquilo C_1-C_6 , $C(=O)O$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ alquilo C_1-C_6 , $C(=O)$ haloalquilo C_1-C_6 , arilo, hidroxialquilo C_1-C_6 , NR9R10, y heterociclilo, y en donde R2 y R5 pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros;

(c) R3 es F, Cl, Br, I, alqueno C₂-C₈, alquenoilo C₂-C₈, alquenoiltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alqueno C₂-C₈, alquenoilo C₂-C₈, alquenoiltio C₂-C₈, arilo, cicloalqueno C₃-C₈, cicloalquenoilo C₃-C₈, cicloalquenoiltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) arilo C₁-C₆, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido

10 (excepto H, F, Cl, Br, I) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alqueno C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}

15 haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo (donde dicho arilo puede estar sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxi C₁-C₈) hidroxialquilo C₁-C₆,

20 NR₉R₁₀, y heterociclilo, y en donde R3 y R4 pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros;

(d) R4 es F, Cl, Br, I, alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈,
5 cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) arilo C₁-C₆, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido
10 (excepto H, F, Cl, Br, I) con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1}
15 haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo (donde dicho arilo puede estar sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxi C₁-C₈) hidroxialquilo C₁-C₆,
20 NR₉R₁₀, y heterociclilo, y en donde R₃ y R₄ pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros;

(e) R5 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-
5 C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes
10 sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O
15 alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, cicloalquilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀, y heterociclilo, y en donde R₂ y R₅ pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros, y en donde R₅ y R₆ pueden formar también un anillo de 3, 4,
20 5, o 6 miembros;

- (f) R6 es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, H, heterociclilo, o alquilo C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido (excepto H) con uno o más de los siguientes
- 10 sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O
- 15 alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, cicloalquilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀, y heterociclilo, y en donde R₂ y R₅ pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros, y en donde R₅ y R₆ pueden formar también un anillo de 3, 4,
- 20 5, o 6 miembros;
- (g) n es 0 a 4;
- (h) X es NR₈, O, o S;

(i) J es N o CR7;

(j) R7 es H, F, Cl, Br, I, alquenilo C₂-C₈,
 alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxí C₁-C₈,
 alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈,
 5 alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo,
 cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈,
 cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxí
 C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, heterociclilo, o alquilo
 C₀-C₈-C(=O)OR₈, donde cada uno de ellos puede estar
 10 independientemente sustituido (excepto H, F, Cl, Br, I)
 con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl,
 Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆,
 alquinilo C₂-C₆, alcoxí C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆,
 haloalcoxí C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo
 15 C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde
 n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆,
 C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo,
 hidroxialquilo C₁-C₆, NR₉R₁₀ y heterociclilo;

(k) R₈ es H, OH, OC(=O) alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₈,
 20 alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxí C₁-C₈,
 alquilo C₁-C₈, alquiltio C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈,

alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo,
 cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈,
 cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi
 C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o heterociclilo, donde cada
 5 uno de ellos puede estar independientemente sustituido
 con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl,
 Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆,
 alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈,
 halocicloalquilo C₃-C₈, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi
 10 C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde
 n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂
 haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo
 C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo (donde dicho arilo
 puede estar sustituido con uno o más sustituyentes
 15 seleccionados de F, Cl, Br, I, o alcoxi C₁-C₈),
 hidroxialquilo C₁-C₆, y heterociclilo;

(1) R₉ es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈,
 alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio
 C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio
 20 C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-
 C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈,

cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
 5 alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O)
 10 haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, y heterociclilo, y en donde R₉ y R₁₀ pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros; y

(m) R₁₀ es alquenilo C₂-C₈, alqueniloxi C₂-C₈, alqueniltio C₂-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquilo C₁-C₈, alquiltio
 15 C₁-C₈, alquinilo C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, alquiniltio C₂-C₈, arilo, cicloalquenilo C₃-C₈, cicloalqueniloxi C₃-C₈, cicloalqueniltio C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquiltio C₃-C₈, o heterociclilo, donde cada uno de ellos puede estar
 20 independientemente sustituido con uno o más de los siguientes sustituyentes, F, Cl, Br, I, CN, NO₂,

alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, S(=O)_{n1} alquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), S(=O)_{n1} haloalquilo C₁-C₆ (donde n1=0-2), OSO₂ haloalquilo C₁-
5 C₆, C(=O)O alquilo C₁-C₆, C(=O) alquilo C₁-C₆, C(=O) haloalquilo C₁-C₆, arilo, hidroxialquilo C₁-C₆, y heterociclilo, y en donde R9 y R10 pueden formar también un anillo de 4, 5 o 6 miembros.

2. Un compuesto que consiste en una sal de
10 adición de ácido plaguicidamente aceptable de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1.

3. Un solvato que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1.

4. Un proceso que comprende aplicar un compuesto
15 de acuerdo con la reivindicación 1 a un lugar para controlar plagas.

5. Un proceso que comprende aplicar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 a un lugar para controlar plagas de Phylum Nematoda o Phylum
20 Arthropoda.

6. Una composición que comprende una mezcla de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 con por lo menos otro plaguicida.

7. Una composición que comprende una mezcla de
5 un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, con por lo menos un herbicida, por lo menos un fungicida, o por lo menos un herbicida y fungicida.

8. Una composición que comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 con por lo menos uno de
10 los siguientes ítems: inhibidor de acetil colina estearasa; modulador de canal de sodio; inhibidor de la biosíntesis de la quitina; antagonista del canal de cloruro dependiente de GABA; agonista del canal de cloruro dependiente de glutamato; agonista del receptor
15 de acetil colina; inhibidor de MET I; inhibidor de ATPasa estimulada por Mg; receptor de acetilcolina nicotínico; disruptor de la membrana del intestino medio; o disruptor de la fosforilación oxidante.

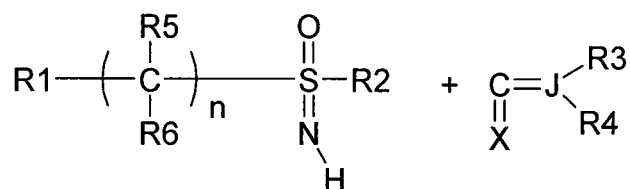
9. Un proceso para aplicar un compuesto de la
20 reivindicación 1 a una semilla.

10. Un proceso para aplicar un compuesto de la reivindicación 1 a una semilla que se ha transformado genéticamente para expresar una o más características especializadas.

5 11. Un proceso para aplicar un compuesto de la reivindicación 1 a una planta genéticamente transformada que se ha transformado genéticamente a los efectos de que exprese una o más características especializadas.

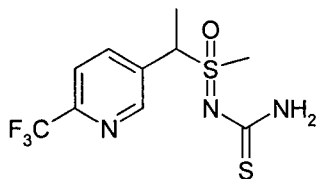
10 12. Un proceso para administrar oralmente o aplicar un compuesto de la reivindicación 1 a un animal.

13. Un proceso que comprende hacer reaccionar:



15 para proporcionar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R1, R2, R3, R4, R5, y R6 son como se especifican en la reivindicación 1.

14. Un compuesto que posee la siguiente fórmula:



Buenos Aires, 2 de marzo de 2009, p.p de DOW

AGROSCIENCES LLC:

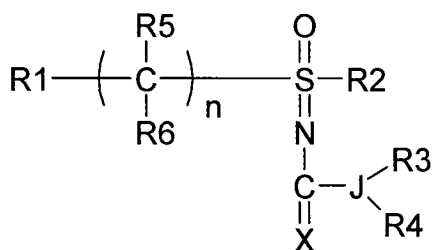
5

Daniel de las Carreras.

10

Resumen

Se describen compuestos que poseen la siguiente fórmula genérica.



284

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2009/035475

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07C381/10 C07D213/14 C07D213/75 C07D403/12 C07D407/12 C07D413/12 A01P7/04 A01N43/40 A01N47/00		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07C C07D 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, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2006/000333 A (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]; FISCHER RUEDIGER [DE]; MALSAM OLGA [DE]; KR) 5 January 2006 (2006-01-05)	1-11
Y	claims 1,11-15 page 55; compounds IB-2,IB-4,IB-6,IB-9 page 4, lines 5-7 page 30, lines 28-32 page 33, line 18 - page 34, line 18 page 35, line 5 - page 38, line 27 page 40, line 5 - page 41, line 10 page 42, lines 17,18 ----- -/--	13,14
☒ 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 9 July 2009		Date of mailing of the international search report 21/07/2009
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Grenouillat, N

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/US2009/035475

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2006/037945 A (SYNGENTA LTD [GB]; PLANT ANDREW [GB]; BOEHMER JUTTA ELISABETH [GB]; PE) 13 April 2006 (2006-04-13)	1-4,6,7,9-11
Y	claims 1,17,22-25 tables 2,16-22,65,66,B1 pages 64-65 pages 72-82	13,14
X	US 2002/032328 A1 (SHERMOLOVICH YURIY GRIGORIEVIC [UA] ET AL) 14 March 2002 (2002-03-14)	1-11
Y	claims 1,9-16 tables 1-3 examples 1-4 paragraphs [0158] - [0164], [0172]	13,14
X	TETRAHEDRON LETTERS, vol. 19, no. 6, 1978, pages 503-506, XP002536166 page 504; compounds 7,8	1
X	ORGANIC MASS SPECTROMETRY, vol. 9, 1974, pages 422-434, XP002536167 table 1 page 431	1,13
X	YOSHIDA H ET AL: "THE CYCLOADDITION REACTION OF N-IMIDOYL SULFOXIMIDES WITH DIPHENYLCYCLOPROPENONE TO YIELD PYRIMIDINONE OR PYRROLINONE DERIVATIVES" BULLETIN OF THE CHEMICAL SOCIETY OF JAPAN, CHEMICAL SOCIETY OF JAPAN, TOKYO, JP, vol. 56, no. 8, 1 August 1983 (1983-08-01), pages 2438-2441, XP002064348 ISSN: 0009-2673 table 1; compound 7 page 2438	1
X	WEHR R: "Dimethylsulphoxylideneureas and Dimethylsulphoxylidenethioureas" JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, CHEMICAL SOCIETY, LETCHWORTH., GB, 1 January 1965 (1965-01-01), pages 3004-3005, XP009119623 ISSN: 0368-1769 page 3005; compounds I,II page 3004	1,13
	-/--	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/US2009/035475

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	GARAPON ET AL: "n DEG 500.- REACTIONS D'ÉLIMINATIONS SUR LES O-CHLOROBENZOATES D'ANILIDE-OXIMES FORMATION DES ARYLIMINONITRÈNES SOUS L'ACTION DES BASES AZOTÉES" BULLETIN DE LA SOCIETE CHIMIQUE DE FRANCE, SOCIETE FRANCAISE DE CHIMIE. PARIS, FRANCE, 1 January 1975 (1975-01-01), pages. 2677-2681, XP009119634 ISSN: 0037-8968 compounds 13,20 page 2680	1
X	JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, vol. 44, 1979, pages 2510-2513, XP002536168 examples 13-15; table II	1
X	US 4 556 413 A (FRATER GEORG [CH] ET AL) 3 December 1985 (1985-12-03) claims 1,9 examples 6-9	1
A	WO 2007/149134 A (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 27 December 2007 (2007-12-27) claims 1,3 example II	1
X,P	WO 2008/155140 A (BAYER SCHERING PHARMA AG [DE]; HARTUNG INGO [DE]; BOTHE ULRICH [DE]; K) 24 December 2008 (2008-12-24) page 90 - page 107 page 81	1
X,P	WO 2008/027539 A (DOW AGROSCIENCES LLC [US]; LOSO MICHAEL R [US]; NUGENT BENJAMIN M [US]) 6 March 2008 (2008-03-06) claims 1-3	1-11,13, 14
X,P	WO 2008/057129 A (DOW AGROSCIENCES LLC [US]) 15 May 2008 (2008-05-15) claims 1,8,9	1-11,13, 14

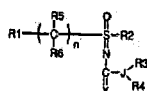
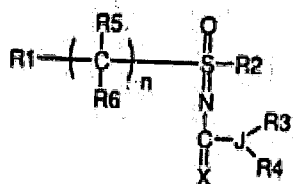
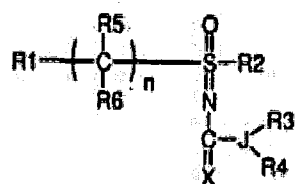
INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/US2009/035475

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2006000333 A	05-01-2006	BR PI0512788 A	08-04-2008
		CN 1976585 A	06-06-2007
		DE 102004031323 A1	19-01-2006
		EP 1763303 A1	21-03-2007
		JP 2008504317 T	14-02-2008
		KR 20070029260 A	13-03-2007
		US 2008214552 A1	04-09-2008
WO 2006037945 A	13-04-2006	AR 051317 A1	03-01-2007
		AU 2005291117 A1	13-04-2006
		BR PI0516442 A	02-09-2008
		CA 2579091 A1	13-04-2006
		EP 1799657 A1	27-06-2007
		SV 2006002257 A	26-06-2006
		US 2008051287 A1	28-02-2008
US 2002032328 A1	14-03-2002	AR 027688 A1	09-04-2003
		AU 6210501 A	03-10-2001
		BR 0109473 A	03-06-2003
		CA 2403807 A1	20-09-2002
		CN 1419542 A	21-05-2003
		WO 0170692 A2	27-09-2001
		EP 1274683 A2	15-01-2003
		HU 0300406 A2	28-06-2003
		JP 2003528081 T	24-09-2003
		MX PA02009313 A	19-04-2005
		PL 359666 A1	23-08-2004
US 4556413 A	03-12-1985	AU 2083783 A	10-05-1984
		DK 504883 A	05-05-1984
		EP 0109575 A2	30-05-1984
WO 2007149134 A	27-12-2007	AR 059438 A1	09-04-2008
		AU 2007261706 A1	27-12-2007
		CA 2653186 A1	27-12-2007
		EP 2043436 A1	08-04-2009
		KR 20090021355 A	03-03-2009
		US 2007299264 A1	27-12-2007
WO 2008155140 A	24-12-2008	EP 2022785 A1	11-02-2009
		US 2009099219 A1	16-04-2009
WO 2008027539 A	06-03-2008	AR 062620 A1	19-11-2008
		CA 2661517 A1	06-03-2008
		CL 25462007 A1	07-03-2008
		EP 2057135 A1	13-05-2009
		US 2008058394 A1	06-03-2008
WO 2008057129 A	15-05-2008	AR 059434 A1	09-04-2008
		AU 2007318244 A1	15-05-2008
		US 2008108667 A1	08-05-2008



290

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

PEDIDO OFICIAL DE CAJA : 10 - 67,888
FECHA : AGOSTO 18 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-108108- -00000-0000

Fecha: 2010-09-01 16:53:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra.11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act.411 PRESENTACION Folios: 293

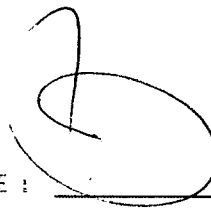
**** CONSIGNACION ****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754327	354662860	17/08/2010	60,633,000.00

**** CONCEPTO ****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1	TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN
			TOTAL : \$ 554,000.00

SON: QUINIENTOS CINCUENTA Y CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO: 10975-841-044-2.

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 67,830
FECHA : AGOSTO 18 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-108108- -00000-0000

Fecha: 2010-09-01 16:53:27 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 293

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754327	354682860	17/08/2010	60,033,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-08	PRORROGA DE TERMINOS	83,000.00
*** N.CREACION PRORROGA DE TERMINOS D			83,000.00
TOTAL :			\$ 83,000.00

SON: OCHENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO: 10975-841-044-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 67,958

FECHA

: AGOSTO 18 DE 2010

Fecha: 2010-09-01 16:53:27 Dep. 2020 DIR. NUEVAS COR
Tia. 11 PATENTE III Eje: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 293

No. 10-108108-00000-0000



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754327	354662660	17/08/2010	60,533,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD :	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS
			TOTAL : \$
			20,000.00
			20,000.00

SON: VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

COLO: 10975-841-044-2.

293

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 69,569
 FECHA : AGOSTO 23 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-108108- -00000-0000

Fecha: 2010-09-01 16:53:27

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 411 PRESENTACION

Folios: 293

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	156798795	23/08/2010	83,297,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
99		OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
TOTAL :			\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE :

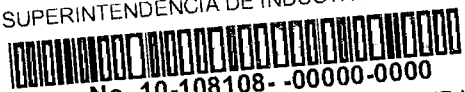
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
 COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
 SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

C.C.O.: 10975-841-044-2.



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-108108-00000-0000

Fecha: 2010-09-01 16:53:27
 Tra. 11 PATENTEIYII
 Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
 Eve: 378 FASENACIONALI
 Folios: 293

PATENTE DE INVENCION ☐MODELO DE U. ☐

Art 33 Decisión 486/00

- ☐ Indicación que se solicita 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 (De ser el caso formato de descuento)
- Completa ☐ Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☐ MODELO DE UTILIDAD PCT ☐ Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

- ☐ Indicación que se solicita una PCT
 - ☐ Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
 - ☐ Dibujos de ser estos pertinentes
 - ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
- Completa ☐ Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

- ☐ Indicación que se solicita 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 ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

- ☐ Indicación que se solicita un esquema de trazado
 - ☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
 - ☐ Representación gráfica de un esquema de trazado
 - ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas
- Completa ☐ Incompleta ☐



Bogotá D.C.,
2020

Doctor(a)
SUAREZ DE PAEZ LUZ CLEMENCIA
Apoderado(a) y/o Representante de
DOW AGROSCIENCES LLC

REFERENCIA	Radicación No.	10 108108
	Solicitud internacional	PCT/US2009/035475
	Fecha inicio fase nacional	03/10/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	14064

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

1. El solicitante debe presentar un nuevo título que permita identificar la materia de la cual trata la solicitud, ya que el título relacionado no se encuentra con la precisión necesaria para identificar claramente el objeto de la solicitud de patente. (Regla 4.3 PCT, Art 26-27 D-486, Circular única 5.2.9)
2. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

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

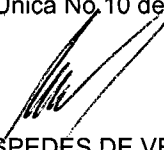
Continúa en la página siguiente...



Continuación radicado No: 10 108108



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


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha
adpa11

29 OCT. 2010