Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

1 EXPEDIENTE No. 03-23860

4 TITUL [illegible] PIRROLIDINAS COMO PESTICIDAS

1 CLASIFICACION INTERNACIONAL C07D. 207/22 401N 43/34 A01N 43/36

1 SOLICITANTE BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO Monheim, República Federal de Alemania

4 APODERADO EMILIO FERRERO

Código No 1092

2. SANTAFE DE B GOTA, D.C.

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

X3 023860 00

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
Radicacion : 03023860 03000000 Folios: 436
Fecha (AMD): 2003-03-20 17:02:24
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE ASUNTOS ENERGIA

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 **SOLICITUD DE:**

☒ Patente de Invención. ☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☐ Capítulo I. ☒ Capítulo II.

2 **SOLICITANTE (71)**	Nombre: **BAYER CROPSCIENCE AG** sociedad constituida y existente bajo las leyes de la República Federal de Alemania. Dirección: Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim, República Federal de Alemania. Domicilio:. Monheim, República Federal de Alemania.	**IDENTIFICACIÓN** C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual_____ Número: _____
3 **REPRESENTANTE O APODERADO**	Nombre: EMILIO FERRERO Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax:: 217 92 11 E-mail: clientes@camyp.com. Domicilio: Bogotá, Colombia.	**IDENTIFICACIÓN** C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual_____ Número: 438.019 T.P. 31.929

4 **INVENTOR (ES) (72)**

1- **Johannes-Rudolf JANSEN**
Knippratherstr 47,
40789 Monheim,
República Federal de Alemania.

2- **Andrew PLANT**
1, Meadow View, Winnersh,
Berkshire RG 41/5PD.
Gran Bretaña.

3- **Bernd ALIG**
Im Rothsiefen 7,
53639 Königswinter,
República Federal de Alemania.

4- **Udo KRAATZ**
Andreasstr. 22a,
51375 Leverkusen,
República Federal de Alemania.

5- **Gerhard THIELKING**
Kastanienallee 13,
51399 Burscheid,
República Federal de Alemania.

6- **Christoph ERDELEN**
Unterbüscherhof 15,
42799 Leichlingen,
República Federal de Alemania.

7- **Andreas TURBERG**
Sinterstr. 86,
42781 Haan,
República Federal de Alemania.

8- **Olaf HANSEN**
Tannenweg 43,
40764 Langenfeld,
República Federal de Alemania.

5 **PCT (86)**
Solicitud Internacional No. PCT/EP01/10422 Fecha: 10 de septiembre de 2001
Publicación Internacional No. WO 02/24646 A1 Fecha : 28 de marzo de 2002

2

(6) **Título (54)** Δ^1- PIRROLINAS COMO PESTICIDAS

ver folio 454

(7) **Clasificación Internacional (51)** C07D 207/22 A01N 35/08 A01N 43/34 A01N 43/36

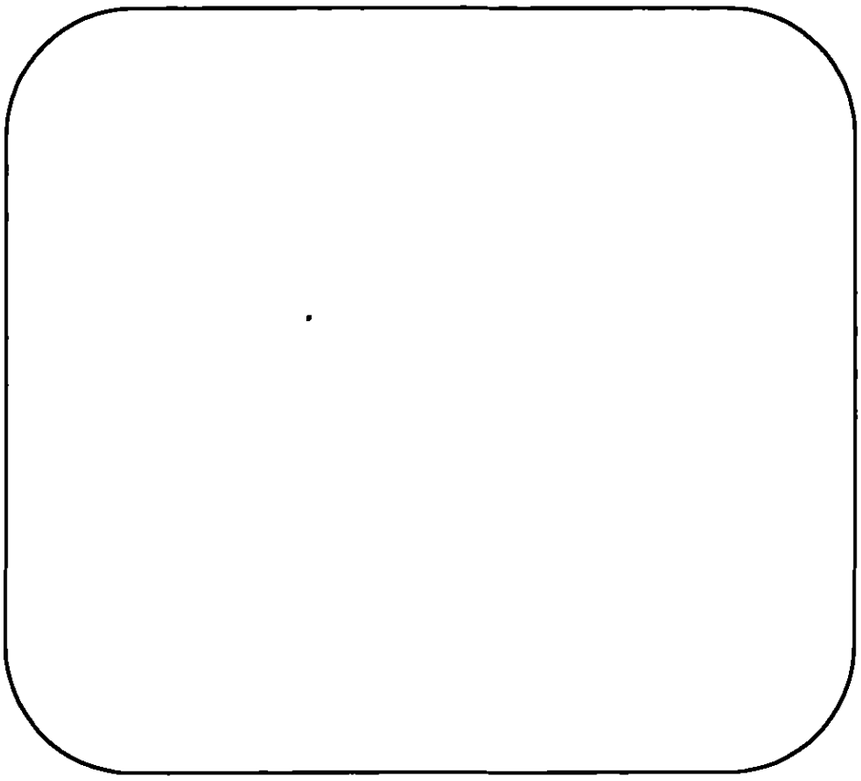
(8) Prioridad SI [X] NO [ ]	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
	DE.	22 de septiembre de 2000	100 47 116.1

(9) **Comprobante de pago No.:** 03 – 15.138 **Fecha:** 3 de marzo de 2003

(10) **Anexos:**

- [X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por $ 400.000.oo.
- [ ] Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- [X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- [X] Poderes, si fuere el caso.
- [ ] Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- [ ] Declaraciones.
- [X] Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- [X] Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- [X] 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.
- [X] Copia Básica No100 47 116.1, con su respectiva traducción.

11 **FIGURA CARACTERISTICA:**



12 **Solicito la concesión de la patente,**

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA :

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

MRE/mrm-ld-4

CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a Nº 72-35
BOGOTA, S - COLOMBIA

179

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

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

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER- OF-ATTORNEY

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

Bayer CropScience AG

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

40789 Monheim, Germany, hereby ratify the patent application No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4ª Nº 72 35, Bogotá, Colombia, en obedecimiento 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 el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciled at Carrera 4ª Nº 72 35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on 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.

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

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

DE BOGOTA HAGO CONSTAR QUE LA
QUE ANTECEDE ES COPIA FIEL DEL
QUE ME FUE PRESENTADO A LA VISTA

MAR 2003

NOTARIA

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

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

Dado y firmado hoy/Given and signed this 12th of February, 2003

en/in Leverkusen

por/by Dr. Axel Bader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Firma / Signature

Bayer CropScience AG

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CONCUERDA CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

19 MAR 2003

JUAN MANUEL OLANO MEDINA
NOTARIO

.CACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

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

,uténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo
de Secretarias
de la compañía Bayer CropScience AG

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

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

y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

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

El 12 de febrero, 2003

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature of
Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jesse
is authentic, that the signatory currently acts in the position of
secretaries
of the company Bayer CropScience AG

a company currently existing and organized under the laws of
Germany

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

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

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

On 12th of February, 2003

El Notario Público - The Notary Public
(Firma-sello) (Signature-seal)

DIRK HEIDERHOFF 1 NOTAR IN LEVERKUSEN

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HA TENIDO A LA VISTA

19 MAR 2003

DINA

URNr. 242/2003

Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften :

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

2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

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

Leverkusen, den 12. Februar 2003

Notar

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

19 MAR 2003

JUAN [illegible] MEDINA

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland
   Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Dirk Heiderhoff
3. in seiner Eigenschaft als Notar
4. sie ist versehen mit dem ~~Stempel/Siegel des (der)~~ Notars Dirk Heiderhoff in Leverkusen

Bestätigt

5. in Köln 6. am 17. FEB. 2003
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln
8. unter Nr. 482/03
9. Stempel/Siegel: Der Präsident des Landgerichts Köln
10. Unterschrift: Callebe

Kostenberechnung
§§ 14, 136 KostO.

[illegible]	EUR 10,-
[illegible]	EUR 10,-
Gebühr 180	EUR 13,-
Umsatzsteuer (19%)	EUR 528
Zus.	EUR 22,02

Frau Hüdepohl, Notar

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

19 MAR 2003

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

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

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

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003

en Leverkusen

por Dr. Axel Brader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible *Firma Ilegible*

COMO NOTARIO SESENTA Y UNO (61) DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CORRESPONDE CON EL ORIGINAL QUE ME FUE PRESENTADO A LA VISTA

19 MAR 2003

JUAN MANUEL [illegible] MEDINA
NOTARIO

(ANEXO)

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

Diego F. Vargas

DIEGO F. VARGAS Z.
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES – INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 19991
MINISTERIO DE JUSTICIA

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

Firma Ilegible
Notario Público *Sello*

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

Respaldo:

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

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

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

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

19 MAR 2003

NO SE ASUME RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 P 12:24

JEFE DE LEGALIZACIONES BOGOTA D.C.

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

IDENTIFICADO(S) CON C.C. No.(s)

ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES.

D.F. 208992

CUYA FIRMA APARECE EN EL DOCUMENTO DESEMPEÑA LAS FUNCIONES INDICADAS

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CORRESPONDE CON EL ORIGINAL QUE SE TUVO A LA VISTA

19 MAR 2003

JUAN MEDINA

TRADUCCION OFICIAL No. 9450

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

---

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

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

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Resolución No. [illegible] Justicia

EL SUSCRITO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

JUAN MANUEL [illegible] MEDINA
NOTARIO

Protocolo notarial 242/2003

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

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

a quienes conozco en persona.

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

Leverkusen, 12 de febrero 2003
(Hilo y oblea notarial)
Fdo.: firma ilegible, Notario

Costas
Art. 141, 154 KostO
Valor EUROS 3.000,-
Derechos Art. 32,45 EUROS 10,-

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
19 MAR 2003
JUAN [illegible] MEDINA

LUIZ AURIOLA DE HERBER
TRADUCTOR INTERPRETE OFICIAL
Resolución No.599 Minjusticia

Derechos Art. 58	EUROS 10,-
Derechos Art. 150	Euros 13,-
IVA	EUROS 5,28
Total	EUROS 38,28

Fdo.: Heiderhoff, notario

APOSTILLA

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

   Este documento público

2. Ha sido firmado por Dirk Heiderhoff

3. Actuando en calidad de notario

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

Certificado

5. en Colonia 6. El 17 de febrero 2003

7 por el Vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 482/03

9. Sello 10. Firma

El Presidente del Fdo.: firma ilegible

Tribunal Regional de Colonia Caliebe

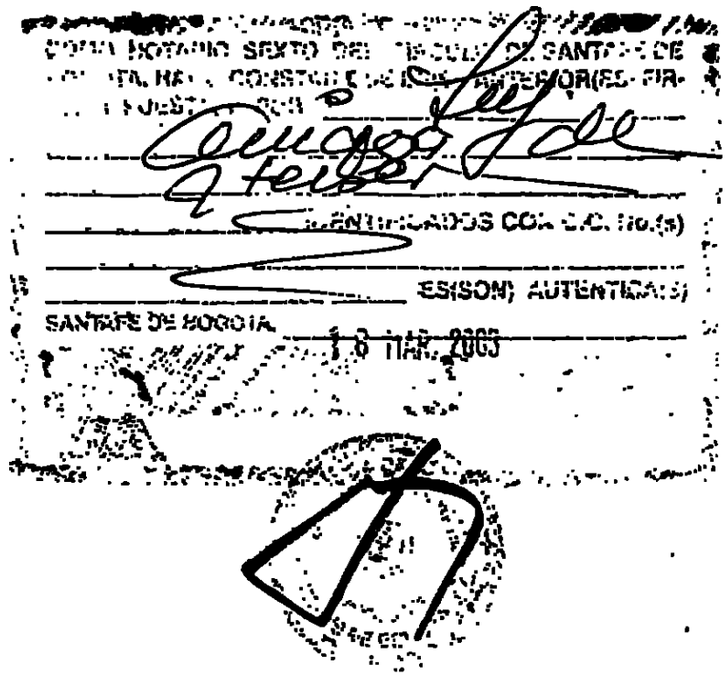
COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CONCUERDA CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

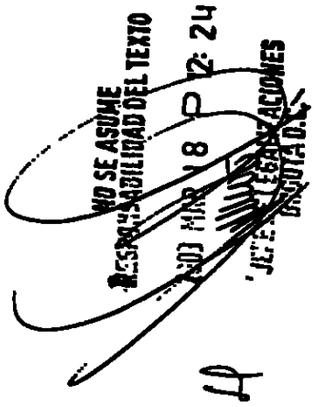
19 MAR 2003

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

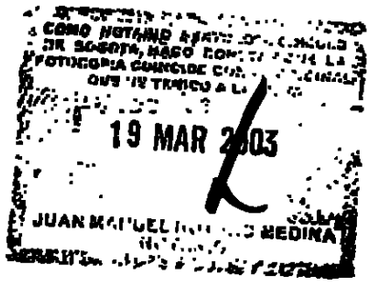
Bogotá, 14 de marzo 2003.

LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Resolución No.559 Minjusticia


NOTARIO SEXTO DEL
SANTA
CONSTA
ANTERIOR(ES) FIR-
2 folios
ENTE(S) CON C.C. No.(s)
ESISON) AUTENTICADO
SANTAFE DE BOGOTA
19 MAR 2003


NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2003 MAR 18 P 2:24
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.


MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
208993
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS


COMO NOTARIO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CORRESPONDE CON
QUE SE TRAJO A LA
19 MAR 2003
JUAN MANUEL
MEDINA

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
28. März 2002 (28.03.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer:
WO 02/24646 A1

not Sk

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 207/22, 207/26, 409/14, 401/14, 405/14, 417/14, A01N 43/36

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/10422

(22) Internationales Anmeldedatum:
10. September 2001 (10.09.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 47 116.1 22. September 2000 (22.09.2000) DE

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: JANSEN, Johannes-Rudolf [DE/DE]; Knippratherstr 47, 40789 Monheim (DE). PLANT, Andrew [GB/GB]; 1, Meadow View, Winnersh, Berkshire RG 41/5PD (GB). ALIG, Bernd [DE/DE]; Im Rothsiefen 7, 53639 Königswinter (DE). KRAATZ, Udo [DE/DE]; Andreasstr. 22a, 51375 Leverkusen (DE). THIELKING, Gerhard [DE/DE]; Kastanienallee 13, 51399 Burscheid (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüscherhof 15, 42799 Leichlingen (DE). TURBERG, Andreas [DE/DE]; Sinterstr. 86, 42781 Haan (DE). HANSEN, Olaf [DE/DE]; Tannenweg 43, 40764 Langenfeld (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*
— *vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen*
— *Insgesamt in elektronischer Form (mit Ausnahme des Kopfbogens); auf Antrag vom Internationalen Büro erhältlich*

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

WO 02/24646 A1

LeA 34277

(54) Title: DELTA1-PYRROLINES USED AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: DELTA1-PYRROLINE ALS PESTIZIDE

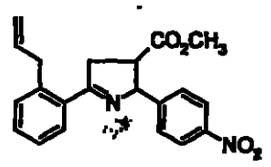
(57) Abstract: The invention relates to novel Δ^1-pyrrolines of formula (I), wherein Ar^1, Ar^2 and Q have the meanings given in the description, to several methods for producing these substances and to their use for controlling pests.

(57) Zusammenfassung: Neue Δ1-Pyrroline der Formel (I) in welcher Ar 1, Ar2 und Q die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen.

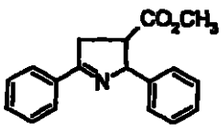
DELTA1-PYRROLINE ALS PESTIZIDE

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Δ^1-Pyrroline, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

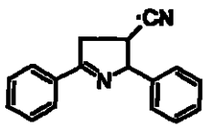
Bisher sind nur wenige 4-substituierte-2,5-bis-Aryl-Δ^1-Pyrroline bekannt geworden:



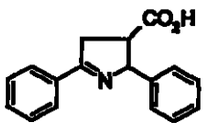
A. Padwa and A. Ku, J. Am. Chem. Soc. 1978, *100*, 2181



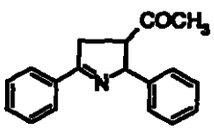
A. Padwa and J. Smolanoff, J. Am. Chem. Soc. 1971, *93*, 548



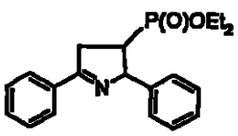
A. Padwa et al, J. Am. Chem. Soc. 1973, *95*, 1945



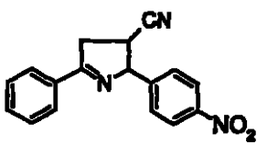
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1970, *103*, 2368



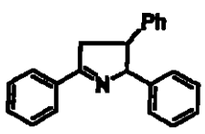
O. Tsuge *et al.*, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347



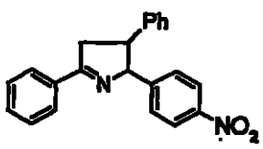
Gakis,N. *et al.*, Helv.Chim. Acta 1976, *68*, 748



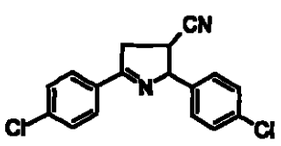
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1972, *105*, 1258



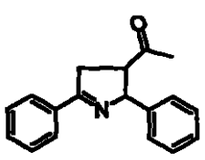
Padwa *et al.*, Tet. Lett. 1972, 4087



Huisgen *et al.*, Tet. Lett. 1966, 3603



A. R. Katritzky *et al.*, Synthesis 1991, *10*, 863



O. Tsuge, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347

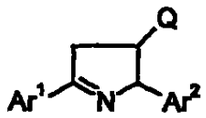
Über deren Eignung zur Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel ist nichts bekannt.

In WO 00/21958, WO 99/59968, WO 99/59967 und WO 98/22438 wurden andere Δ^1-Pyrroline und deren Eignung als Schädlingsbekämpfungsmittel beschrieben.

Die Wirkungshöhe und/oder Wirkungsdauer dieser vorbekannten Verbindungen ist jedoch, insbesondere gegen bestimmte Organismen und/oder bei niedrigen Anwendungskonzentrationen, nicht in allen Anwendungsgebieten völlig zufriedenstellend.

Wegen der vielfältigen Anforderungen an moderne Schädlingsbekämpfungsmittel, beispielsweise bezüglich Wirkhöhe, Wirkdauer, Wirkspektrum, Anwendungsspektrum, Toxizität, Kombination mit anderen Wirkstoffen, Kombination mit Formulierungshilfsmitteln oder die Synthese,. und wegen des möglichen Auftretens von Resistenzen kann die Entwicklung solcher Stoffe jedoch nie als abgeschlossen betrachtet werden, und es besteht beständig ein hoher Bedarf an neuen Verbindungen, die zumindest in Teilaspekten Vorteile gegenüber den bekannten Verbindungen besitzen.

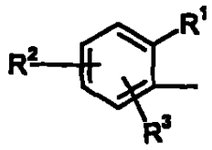
Es wurden nun neue Δ^1-Pyrroline der Formel (I)



(I)

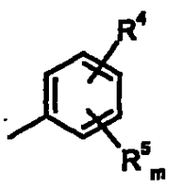
gefunden, in welcher

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in denen

m für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

R^1 für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_0R^6$, $-NR^7R^8$ steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_0R^6$, $-NR^7R^8$ stehen,

R^4 für Halogen oder eine der folgenden Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Halogen, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_0R^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Halogenalkylaminosulfonyl, Bisalkoxyboran, $-B(OH)_2$ steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_0$, $-NR^6$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen steht,

A für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit einem oder mehreren Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff oder $-S(O)_o-$ steht,

D für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Halogenalkylen, Halogenalkenylen steht,

E für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

Q außerdem für $-CO_2R^{13}$ oder $-CONR^{14}R^{15}$ steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Aralkyl, Phenyl steht,

R^{10} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl steht,

R^{11} für Alkyl, Aryl steht,

R^{12} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl oder Aryl steht,

R^{13} für Wasserstoff; für einfach oder mehrfach substituiertes Alkyl; für gegebenenfalls substituiertes Aminocarbonylalkyl; für Alkenyl, Phenylalkenyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl oder Phenoxyalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl steht,

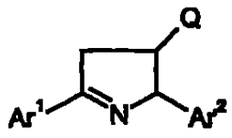
R^{14} und R^{15} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogenalkyl, Alkoxyalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes, jeweils gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,

R^{14} und R^{15} außerdem gemeinsam für Alkylenoxyalkylen oder Alkylenthioalkylen stehen.

Die Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere bzw. Regioisomere oder deren Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Sowohl die reinen Isomere als auch die Isomerengemische werden erfindungsgemäß beansprucht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man die neuen Verbindungen der Formel (I) nach einem der im folgenden beschriebenen Verfahren erhalten kann.

Δ^1-Pyrroline der Formel (I)



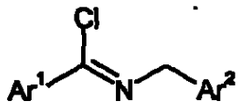
(I)

in welcher

Ar^1, Ar^2, und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

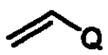
lassen sich herstellen,

A-1.) indem man Iminochloride der Formel (II-a)



(II-a)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



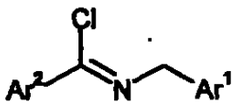
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

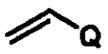
in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

A-2.) indem man Iminochloride der Formel (II-b)



(II-b)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



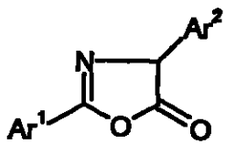
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

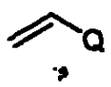
in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

B.) indem man Oxazolinone der Formel (IV)



(IV)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



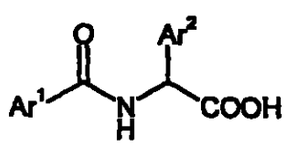
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2 und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

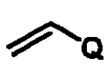
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

C.) indem man Carbonsäuren der Formel (V)



(V)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



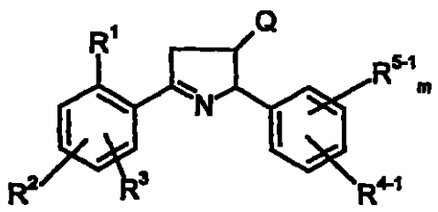
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2 und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart von Essigsäureanhydrid und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

D.) Δ^1-Pyrroline der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher

R^1, R^2, R^3, Q und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

R^{4-1} für A oder B-Z-D

steht, wobei

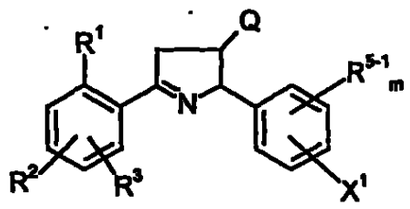
A, B, Z und D die oben angegebenen Bedeutungen haben, und

R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Haloalkylaminosulfonyl steht,

wobei

R^6, R^7, R^8 und o die oben angegebenen Bedeutungen haben,

lassen sich herstellen, indem man Verbindungen der Formel (I-b)



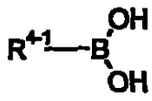
(I-b)

in welcher

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q und m die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X^1 für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht

mit Boronsäuren der Formel (VI)



(VI)

in welcher

R^{4-1} die oben angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder indem man Verbindungen der Formel (I-b)

in welcher

X^1 für 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan) steht

mit (Hetero)cyclen der Formel (VII)

T—A (VII)

in welcher A die oben angegebene Bedeutung hat und

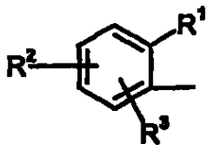
T für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

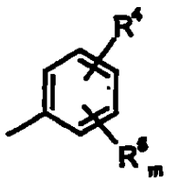
Schließlich wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sehr gute insektizide Eigenschaften besitzen und sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz zur Bekämpfung unerwünschter Schädlinge, wie Insekten, verwenden lassen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend erwähnten Formeln aufgeführten Reste werden im folgenden erläutert.

Ar^1 steht bevorzugt für den Rest



Ar^2 steht bevorzugt für den Rest



m steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3.

R^1 steht bevorzugt für Halogen, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$.

R^2 und R^3 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$.

R^4 steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindliche Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

R^5 steht bevorzugt für Halogen, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, Tri(C_1-C_6-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (C_1-C_6-Halogenalkyl)aminosulfonyl, Bis(C_1-C_6-alkoxy)boran, $-B(OH)_2$.

X steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_o$, $-NR^6$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen.

A steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere

Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl).

B steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen.

Z steht bevorzugt für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff oder $-S(O)_o-$.

D steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)-sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl.

Y steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen, C_1-C_6-Halogenalkylen, C_2-C_6-Halogenalkenylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen.

E steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)-sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl.

W^1 steht bevorzugt für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

W^2 steht bevorzugt für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy,

C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

n steht bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.

Q steht bevorzugt für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel.

Q steht außerdem bevorzugt für $-CO_2R^{13}$ oder $-CONR^{14}R^{15}$.

o steht bevorzugt für 0, 1 oder 2.

R^6 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl.

R^7 und R^8 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen.

R^9 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl, Phenyl.

R^{10} steht bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl.

R^{11} steht bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, Phenyl.

R^{12} steht bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl oder Phenyl.

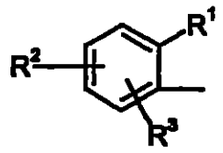
R^{13} steht bevorzugt für Wasserstoff, für einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl oder

2-Pyrrolidinon substituiertes C_1-C_6-Alkyl; für Aminocarbonyl-C_1-C_6-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C_1-C_4-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C_2-C_8-Alkenyl, Phenyl-C_2-C_6-alkenyl; für Phenyl-C_1-C_4-alkyl oder Phenoxy-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy oder C_1-C_4-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach durch C_1-C_4-Alkyl substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C_1-C_4-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen substituiert sein kann; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl.

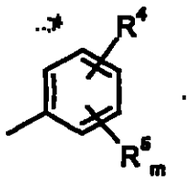
R^{14} und R^{15} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Halogenalkyl oder C_1-C_4-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Halogenalkyl oder C_1-C_4-Halogenalkoxy substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C_1-C_4-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen oder C_1-C_4-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann.

R^{14} und R^{15} stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für C_1-C_4-Alkylenoxy-C_1-C_4-alkylen oder C_1-C_4-Alkylenthio-C_1-C_4-alkylen.

Ar^1 steht besonders bevorzugt für den Rest



Ar^2 steht besonders bevorzugt für den Rest



m steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

R^1 steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy.

R^2 und R^3 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy.

R^4 steht besonders bevorzugt für Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

R^5 steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy, $-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan).

X steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen.

A steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl).

B steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen.

Z steht besonders bevorzugt für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff oder $-S(O)_o-$.

D steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_4-Alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_4-Alkylsulfonyl.

Y steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen; jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkylen oder C_2-C_6-Alkenylen; C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen.

E steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_6-Alkylsulfonyl.

W^1 steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_4-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

W^2 steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, $-OSO_2CF_3$, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

n steht besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3.

Q steht besonders bevorzugt für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel (insbesondere Dihydrodioxazin, Oxazolin, Thiazolin, Imidazolin, Tetrazol).

Q steht außerdem besonders bevorzugt für $-CO_2R^{13}$ oder $-CONR^{14}R^{15}$.

o steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

R^6 steht besonders bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl oder jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl.

R^7 und R^8 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, oder gemeinsam für C_4-C_5-Alkylen.

R^9 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, Benzyl, Phenyl.

R^{10} steht besonders bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl.

R^{11} steht besonders bevorzugt für C_1-C_4-Alkyl, Phenyl.

R^{12} steht besonders bevorzugt für C_1-C_4-Alkyl oder für durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl.

R^{13} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff; für einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, Methoxy, Methoxycarbonyl oder 2-Pyrrolidinon substituiertes C_1-C_4-Alkyl; für Aminocarbonyl-C_1-C_4-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C_1-C_4-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C_2-C_6-Alkenyl, Phenyl-C_2-C_3-alkenyl; für Phenyl-C_1-C_4-alkyl oder Phenoxy-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach durch Methyl substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl,

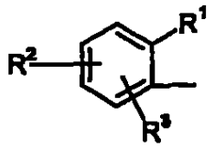
welche jeweils im Heterocyclus durch Chlor substituiert sein können; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl.

R^{14} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff.

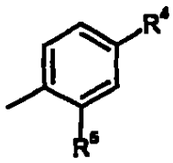
R^{15} steht besonders bevorzugt für C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl oder durch C_1-C_4-Alkoxycarbonyl substituiertes Thiazolyl.

R^{14} und R^{15} stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für Morpholino oder Thiomorpholino.

Ar^1 steht ganz besonders bevorzugt für den Rest



Ar^2 steht ganz besonders bevorzugt für den Rest



R^1 steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy.

R^2 und R^3 stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy.

R^4 steht ganz besonders bevorzugt für Chlor, Brom oder eine der folgenden Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

R^5 steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$ oder $-SO_2CF_3$.

R^5 steht außerdem ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

X steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

A steht ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Ox-

azolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl.

B steht ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen.

Z steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder $-SO_2-$.

D steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

Y steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

E steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

W^1 steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$, $-SOCHF_2$, $-SOCF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$,

$-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

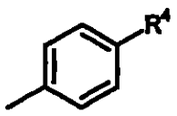
W^2 steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

Q steht ganz besonders bevorzugt für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec-Butyl, $-CO_2$-tert-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, $-CO_2$-Trifluorethyl, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-Propyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, $-PO(OMe)_2$, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl, $-PO(OEt)_2$, $-PO(OPh)_2$, Dihydrodioxacinyl, Oxazolyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Tetrazolyl.

Q steht außerdem ganz besonders bevorzugt für $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2H$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethyloxycarbonyl, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH-Ph$, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyl-

oxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthyloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, -CON(H)CH_2CF_3, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenylaminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl.

Ar^2 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für den Rest



R^1 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

R^2 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor oder Fluor.

R^4 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für -B-Z-D.

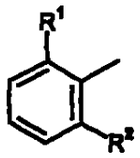
B steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für p-Phenylen.

Z steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

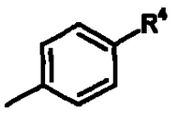
D steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für $-CF_3$.

Q steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec-Butyl, $-CO_2$-tert-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl.

Ar^1 steht hervorgehoben für den Rest



Ar^2 steht hervorgehoben für den Rest



R^1 steht hervorgehoben für Fluor oder Chlor.

R^2 steht hervorgehoben für Wasserstoff, Chlor oder Fluor.

R^4 steht hervorgehoben für -B-Z-D.

B steht hervorgehoben für p-Phenylen.

Z steht hervorgehoben für Sauerstoff oder Schwefel.

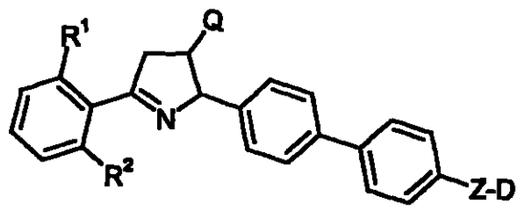
D steht hervorgehoben für $-CF_3$.

Q steht hervorgehoben für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec-Butyl, $-CO_2$-tert-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH-(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl.

Q steht außerdem hervorgehoben für $-CO_2H$, $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethyloxycarbonyl, $-CO_2(CH_2)_3CH{=}CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3){=}CH_2$, $-CO_2CH_2CH{=}CH$-Ph, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyloxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthyloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, $-CON(H)CH_2CF_3$, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzylaminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenylaminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-amino-

carbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel (I-c)

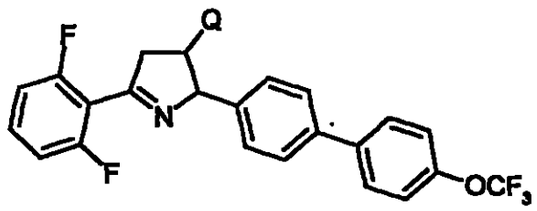


(I-c)

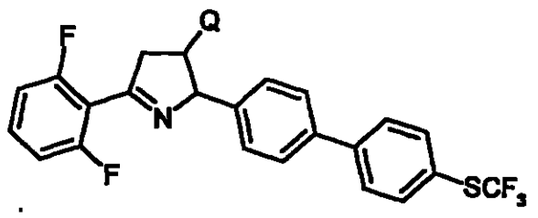
in welcher

R^1, R^2, Z, D und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben.

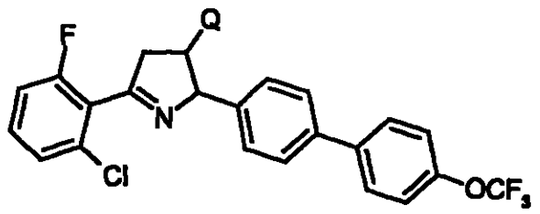
Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)



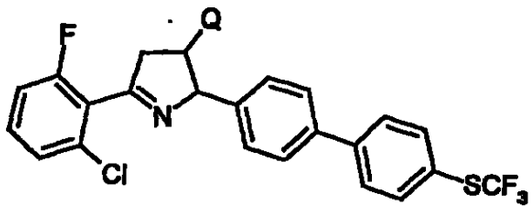
(I-d)



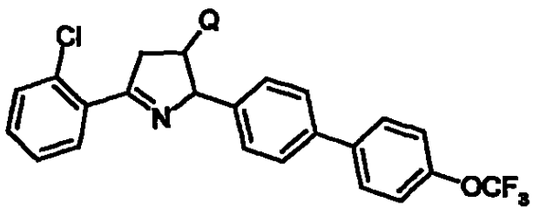
(I-e)



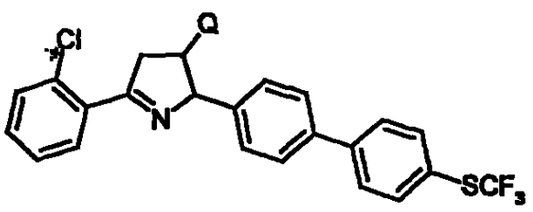
(I-f)



(I-g)



(I-h)



(I-i)

in denen

Q für $-CO_2R^9$, $-CONHR^8$ oder $-CONR^7R^8$ steht,

wobei R^7, R^8 und R^9 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)

in welchen

Q für CO_2R^{13} oder $-CONR^{14}R^{15}$ steht,

wobei R^{13}, R^{14} und R^{15} die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)

in welchen

Q für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec-Butyl, $-CO_2$-tert-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, $-CONHCH_3$, $-CONHCH_2CH_3$, -CONH-(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl steht.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)

in welchen

Q für $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, $-CO_2H$, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethyloxycarbonyl, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH$-Ph, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyloxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthyloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, $-CON(H)CH_2CF_3$, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methyl-

benzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenyl-aminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl steht.

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, und

Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} und R^{11} die oben angegebenen allgemeinen Bedeutungen haben.

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, steht und

Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} und R^{11} die oben angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben.

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel (insbesondere Dihydrodioxacin, Oxazolin, Thiazolin, Imidazolin, Tetrazol) steht und

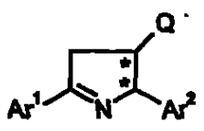
Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} und R^{11} die oben angegebenen besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

Eine weitere bevorzugte Gruppe sind die Verbindungen der Formel (I), in welchen

Q für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec-Butyl, $-CO_2$-tert-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, $-CO_2$-Trifluorethyl, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-Propyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH-(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, $-PO(OMe)_2$, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl, $-PO(OEt)_2$, $-PO(OPh)_2$, Dihydrodioxacinyl, Oxazolyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Tetrazolyl steht und

Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} und R^{11} die oben angegebenen ganz besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

Die allgemeine Formel (I) besitzt zwei, hier durch * gekennzeichnete, Asymmetriezentren.



(I)

Bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in denen die Substituenten Q und Ar^2 an den beiden chiralen Zentren cis-ständig sind.

In den oben genannten Definitionen stehen Oxyalkylen bzw. Thioalkylen für -O-Alkyl- bzw. -S-Alkyl-, wobei die Bindung z.B. an Ar^2 über das Sauerstoff- bzw. Schwefelatom erfolgt und am Alkylrest gegebenenfalls weitere Substituenten wie z.B. A in –X-A gebunden sind. Alkylenoxy bzw. Alkylenthio stehen für -Alkyl-O- bzw. -Alkyl-S-, wobei die Bindung z.B. an Ar^2 jeweils über den Alkylrest erfolgt und am Sauerstoff- bzw. Schwefelatom gegebenenfalls weitere Substituenten wie z.B. A in –X-A gebunden sind. Oxyalkylenoxy steht für -O-Alkyl-O.

Heterocyclyl steht in der vorliegenden Beschreibung für einen gesättigten oder ungesättigten cyclischen Kohlenwasserstoff in welchem einer oder mehrere Kohlenstoffatome durch ein oder mehrere Heteroatome ausgetauscht sind. Heteroatome steht dabei bevorzugt für O, S, N, P, insbesondere für O, S und N.

Bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen, welche die unter bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt genannten Substituenten tragen.

Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

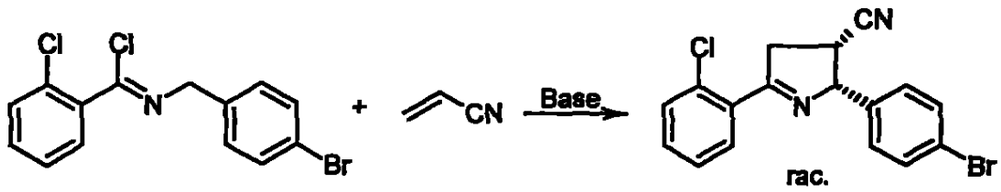
Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein

können. Mehrere Reste mit denselben Indizes wie beispielsweise m Reste R^5 für m >1, können gleich oder verschieden sein.

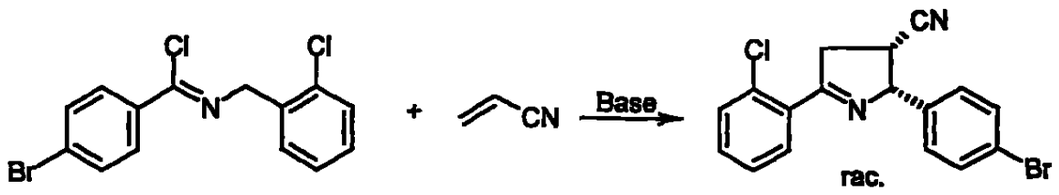
Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

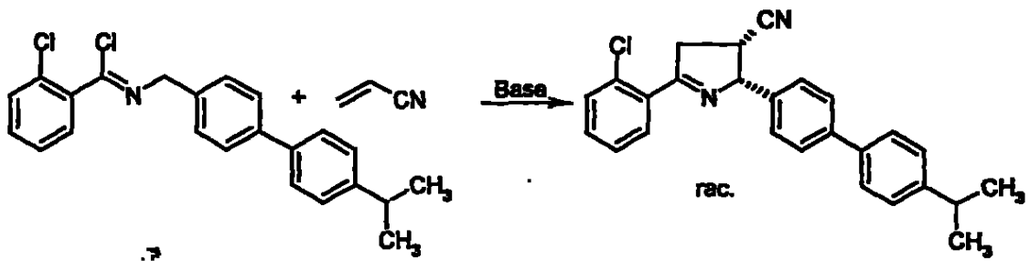
Verwendet man N-(4-Brombenzyl)-2-chlorphenyl-carboximidoyl-chlorid und Acrylsäurenitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



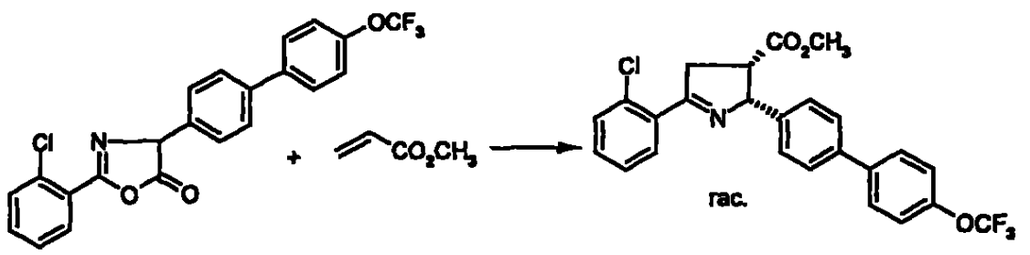
Verwendet man N-(2-chlorbenzyl)-4-bromphenyl-carboximidoyl-chlorid und Acrylsäurenitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-2) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



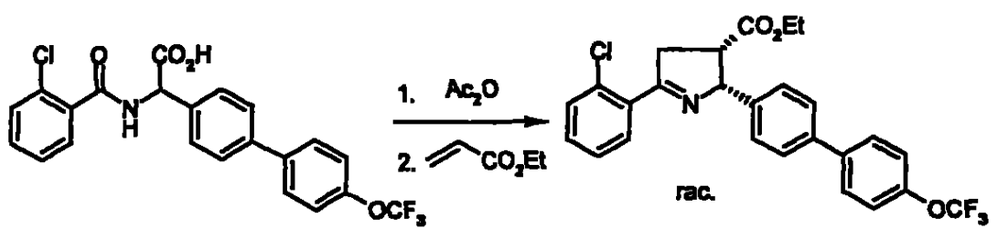
Verwendet man 2-Chlor-N-[(4'-isopropyl-1,1'-biphenyl-4-yl)methyl]benzolcarboximidoyl-chlorid und Acrylnitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



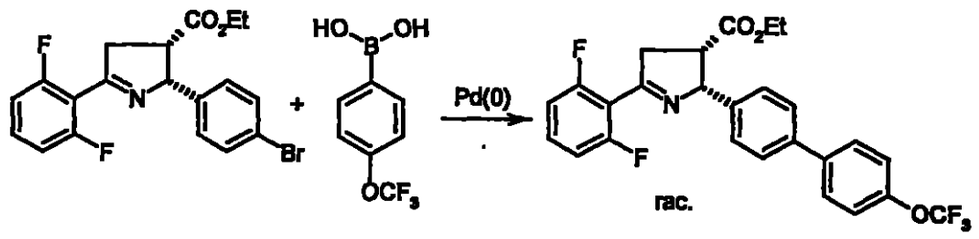
Verwendet man 2-(2'-Chlorbenzyl)-4-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl]oxazolidin-5-on und Acrylsäuremethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Verwendet man N-(2-Chlorbenzoyl)-2-[(4'-trifluormethoxy)biphenyl]glycin und Essigsäureanhydrid und Acrylsäureethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

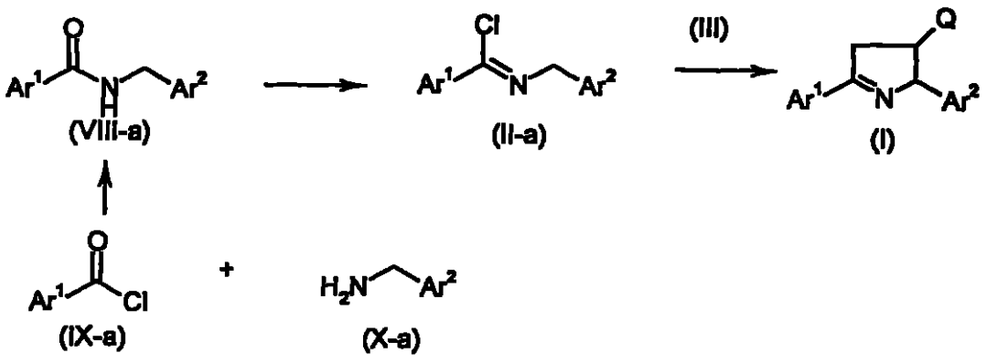


Verwendet man 2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrole-3-carbonsäureethylester und 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

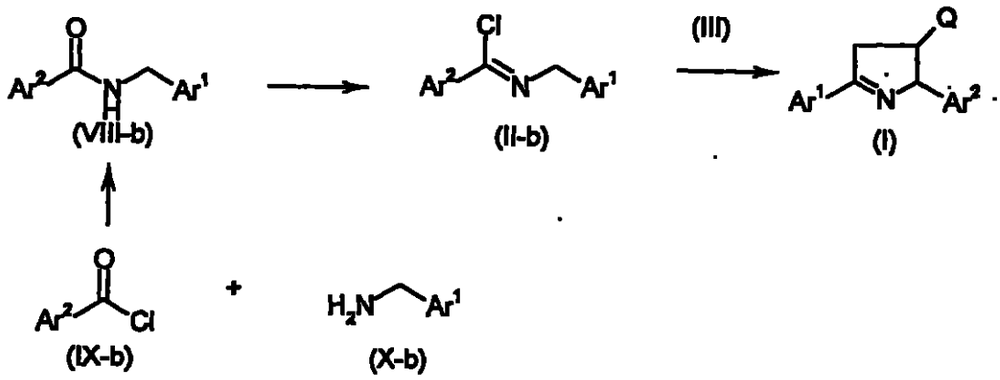


Erläuterungen der Verfahren und Zwischenprodukte:

Verfahren (A-1)



Verfahren (A-2)



Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Iminochloride sind durch die Formeln (II-a) und (II-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Die zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Iminochloride der Formeln (II-a) und (II-b) lassen sich herstellen, indem man Amide der Formeln (VIII-a) und (VIII-b) mit einem Chlorierungsreagenz (z.B. $SOCl_2$) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt. (Für weitere Methoden siehe „The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond", in Patai, Interscience, New York, 1970, S. 597-662).

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Amide sind durch die Formeln (VIII-a) und (VIII-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

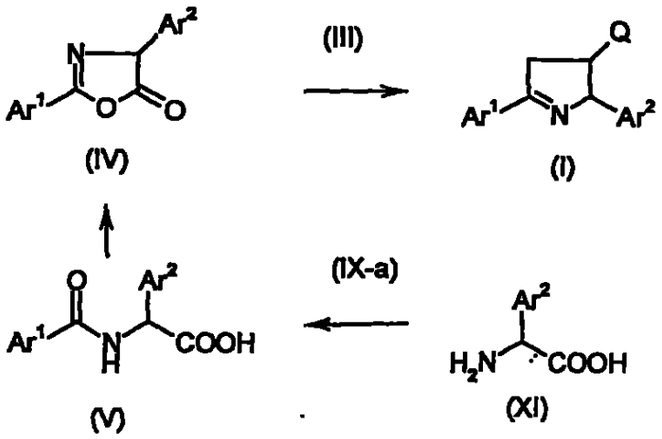
Amide der Formeln (VIII-a) und (VIII-b) lassen sich z.B. herstellen, indem man Säurechloride der Formeln (IX-a) und (IX-b) mit Benzylaminen der Formeln (X-a) und (X-b) in Gegenwart einer Base (z.B. Et_3N oder NaOH) und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Säurechloride und Benzylamine sind durch die Formeln (IX-a) und (IX-b) bzw. durch die Formeln (X-a) und (X-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der

Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Säurechloride der Formeln (IX-a) und (IX-b) sind allgemein bekannt. Benzylamine der Formeln (X-a) und (X-b) sind zum Teil bekannt, können aber aus den entsprechenden Nitrilen bzw. Aldehyden über bekannte Methoden (Reduktion bzw. reduktive Aminierung) hergestellt werden (s. z.B. Vogel's Textbook Of Practical Organic Chemistry, Fifth Edition 1989, John Wiley and Sons, New York, Author: Vogel, Arthur, Israel; Revised by Furniss, Hannaford, Smith, and Tatchell, ISBN 0-582-46236-3).

Verfahren (B)



Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Oxazolidinone sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

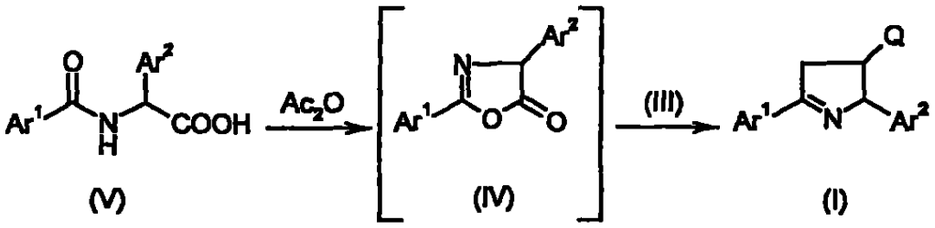
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Oxazolidinone der Formel (IV) lassen sich analog zu den in der Literatur bekannten Beispielen aus N-Benzoyl-aminosäuren der Formel (V) herstellen. Oxazoli-

dinone der Formel (IV) werden anschließend mit Dipolarophilen der Formel (III) umgesetzt (vgl. z.B. Chem. Ber. 1970, 103, 2368-2387, und dort zitierte Literatur).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten N-Benzoyl-aminosäuren sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (V) lassen sich aus Aminosäure-Derivaten der Formel (XI) durch Umsetzung mit Säurechloriden der Formel (IX-a) in Gegenwart einer Base und eines Verdünnungsmittels erhalten. Aminosäuren der Formel (XI) sind zum Teil kommerziell erhältlich und/oder können über bekannte Verfahren hergestellt werden (z.B. Tetrahedron 1994, 50, 1539-1650 und dort zitierte Literatur).

<u>Verfahren (C)</u>



(V) (IV) (I)

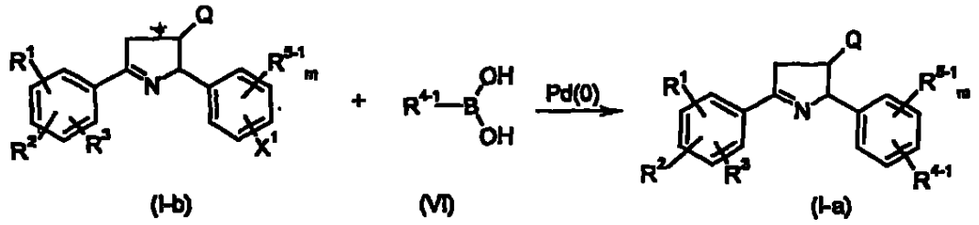
N-Benzoyl-aminosäuren der Formel (V) können zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch in einer Tandem-Reaktion umgesetzt werden. Hierzu werden die Oxazolidinone der Formel (IV) *in situ* aus Verbindungen der Formel (V) und Essigsäureanhydrid (vgl. z.B. Chem. Ber. 1970, 103, 2368-2387) hergestellt und anschließend gemäß Verfahren (B) mit Dipolarophilen der Formel (III) umgesetzt.

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B) und (C) als Ausgangsstoffe benötigten Dipolarophile sind durch die Formel (III) allge-

mein definiert. In dieser Formel steht Q bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (III) (Q = Ester, Nitril, Keton, Amid, Phosphorester, Sulfon) sind allgemein bekannt bzw. kommerziell erhältlich.

Verfahren (D)



(I-b) (VI) (I-a)

Für den Fall, dass Ar^2 im erfindungsgemäßen Wirkstoff der Formel (I) für ein gegebenenfalls substituiertes Biphenyl steht, lassen sich Verbindungen der Formel (I-a) herstellen, indem man Verbindungen der Formel (I-b) mit Boronsäuren der Formel (VI) in Gegenwart eines Palladium-Katalysators und in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittel kuppelt.

In Verbindungen der Formeln (I-a) bzw. (I-b) stehen R^1, R^2, R^3 und m bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

R^{5-1} steht bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, Tri(C_1-C_6-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_0R^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (C_1-C_6-Halogenalkyl)aminosulfonyl.

R^{5-1} steht besonders bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$.

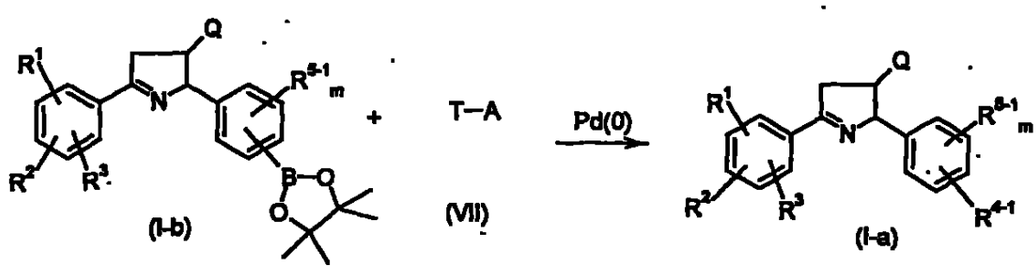
R^{5-1} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, $-OSO_2NMe_2$ oder $-SO_2CF_3$.

In Verbindungen der Formel (I-b) steht X^1 bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom, ganz besonders bevorzugt für Brom.

In Verbindungen der Formeln (I-a) und (VI) steht R^{4-1} für A oder -B-Z-D. A, B, Z und D stehen dabei bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (I-b) werden über Verfahren A, B oder C hergestellt. Boronsäuren der Formel (VI) sind z. Teil bekannt, können aber auch ausgehend vom (Brom)aromaten durch Lithiierung bzw. Br-Li (Mg)-austausch und anschließende Umsetzung mit Trisalkoxyborverbindungen hergestellt werden (vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 1993, 34, 8237-8240).

Weiterhin können Verbindungen der Formel (I-a) ausgehend von Verbindungen der Formel (I-b) [X^1 = 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan] und (Hetero)cyclen der Formel (VII) analog Literatur bekannten Methoden (J.Org. Chem. 1995, 60, 7508; Tetrahedron Lett. 1997, 38, 3841) hergestellt werden.



In den (Hetero)cyclen der Formel (VII) steht T bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom, ganz besonders bevorzugt für Chlor. A steht bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Verbindungen der Formel (VII) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man im allgemeinen einen Palladium-Katalysator ein, der wiederum mit oder ohne Zusatz von weiteren Liganden verwendet werden kann. Vorzugsweise verwendet man als Katalysator $PdCl_2(dppf)$ [dppf = 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocene], $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$, $PdCl_2(CH_3CN)_2$, $Pd_2(dba)_3$ [dba = Dibenzylidenaceton] oder $Pd(OAc)_2$, besonders bevorzugt $PdCl_2(dppf)$, $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$ oder $Pd(OAc)_2$, ganz besonders bevorzugt $PdCl_2(dppf)$ oder $Pd(PPh_3)_4$. Als Liganden kommen Triarylphosphine, Trialkylphosphine oder Arsine in Frage. Vorzugsweise verwendet man dppf, PPh_3, $P(t\text{-}Bu)_3$, Pcy_3 oder $AsPh_3$, besonders bevorzugt dppf.

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) erhält man Verbindungen der Formel (I) bzw. (I-a), in welchen Q für $-CO_2H$ steht, indem man z.B. die entsprechenden Methylester nach bekannten Verfahren verseift (vgl. T.W. Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd edition, S. 232-234).

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Es ist jedoch auch möglich, ohne zusätzliches Säurebindemittel zu arbeiten, oder die Aminkomponente in einem Überschuss einzusetzen, so dass sie gleichzeitig als Säurebindemittel fungiert.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils in einem größeren Bereich variiert

werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 140°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) oder (A-2) setzt man auf 1 Mol an Iminochlorid der Formeln (II-a) oder (II-b) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man auf 1 Mol an Oxazolinon der Formel (IV) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) setzt man auf 1 Mol an Carbonsäure der Formel (V) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Essigsäureanhydrid ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls

nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man auf 1 Mol an Verbindungen der Formeln (I) im allgemeinen 1 Mol an Dipolarophil der Formel (III) oder auch einen Überschuss daran, sowie 1 bis 5 Mol an Säurebindemittel und 1/20 mol Katalysator ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch zwischen Wasser und Methyl-tert-butylether verteilt, die organische Phase über Natriumsulfat trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblüttertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spp.

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus spp., Schistocerca gregaria.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Reticulitermes spp..

Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp., Trichodectes spp., Damalinia spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci, Thrips palmi, Frankliniella accidentalis.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Aphis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella xylostella, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Mamestra brassicae, Panolis flammea, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana, Cnaphalocerus spp., Oulema oryzae.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Antho-

nomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

Aus der Klasse der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch eine hervorragende Wirkung gegen Raupen, Käferlarven, Spinnmilben, Blattläuse und Minierfliegen aus.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere ganz besonders durch hervorragende Wirkung gegen Larven des Meerettichblattkäfers (Phaedon cochleariae), Raupen des Eulenfalters (Spodoptera frugiperda), Larven der Grünen Reiszikade (Nephotettix cincticeps), Pfirsichblattläuse (Myzus persicae) und alle Stadien der gemeinen Spinnmilbe (Tetranychus urticae) aus.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobizide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen,

Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:
z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie syn-

thetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängeln;

als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate;

als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit anderen, auch bekannten Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In

vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Edifenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox,

Guazatin,

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

39

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozen (PCNB),

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol,

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

Dagger G, OK-8705, OK-8801,

α-(1,1-Dimethylethyl)-ß-(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α-(2,4-Dichlorphenyl)-ß-fluor-ß-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α-(2,4-Dichlorphenyl)-ß-methoxy-α-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α-(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)-ß-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

(E)-α-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
{2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-isopropylester
1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,
2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
2-Aminobutan,
2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
2-Phenylphenol(OPP),
3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
3-(1,1-Dimethylpropyl)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,

4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
8-Hydroxychinolinsulfat,
9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,
Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
Kaliumhydrogencarbonat,
Methantetrathiol-Natriumsalz,
Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
N-(6-Methoxy)-pyridin-3-yl)-cyclopropancarboxamid,
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
4-[(3,4-Dimethoxyphenyl)-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopfthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene, Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kernpolyederviren

Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

Ribavirin

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Theta-cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanyliden)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin

2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol

2-(Acetlyoxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion

2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

3-Methylphenyl-propylcarbamat

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-3(2H)-pyridazinon

4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyridazinon

4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon

Bacillus thuringiensis strain EG-2348

Benzoesäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-ester

[3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid

Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat

N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid

N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin

N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid

3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekälkten Unterlagen aus.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile" bzw. „Teile von Pflanzen" oder „Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften („Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch über additive („synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide

Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus Bacillus thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden „Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften („Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard (Baumwolle), Nucotn® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zu-

künftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Aus der Ordnung der Heteropterida z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..
Aus der Ordnung der Blattarida z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattela germanica, Supella spp..

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodorus spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

Beispielsweise zeigen sie eine hervorragende Wirksamkeit gegen die Entwicklungsstadien von Zecken wie zum Beispiel Amblyomma hebraeum, gegen parasitierende Fliegen wie zum Beispiel gegen Lucilia cuprina.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und

Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitonal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Außerdem wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.

Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie
Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpini,

Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis, Xyleborus spec. Tryptodendron spec. Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. Dinoderus minutus.

Hautflügler wie
Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.

Termiten wie
Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus.

Borstenschwänze wie Lepisma saccharina.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft zu verstehen:

Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit mindestens einem Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Binde- oder Fixiermittels, Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölartiges schwer flüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle

oder deren Aromatenfraktionen oder mineralölhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dgl. zum Einsatz.

In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindelöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise α-Monochlornaphthalin, verwendet.

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, dass das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und dass das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches oder ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycolether, Ester oder dgl. zur Anwendung.

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes verwendet.

Das als Bindemittel verwendete Kunstharz kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dgl. eingesetzt werden.

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällen vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).
Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder

Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der WO 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyriphos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyfenozide und Triflumuron, sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolylfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken,

Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Ledamorpha (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorpha (Seepocken), wie Balanus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise Ectocarpus sp. und Ceramium sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflusskrebse) zusammengefasst werden, besondere Bedeutung zu.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-*n*-butylzinnlaurat, Tri-*n*-butylzinnchlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinnchlorid, Tri-*n*-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdändisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyltitanat, Phenyl-(bispyridin)-wismutchlorid, Tri-*n*-butylzinnfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamoylzinkethylenbisthiocarbamat, Zinkoxid, Kupfer(I)-ethylen-bisdithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphthenat und Tributylzinnhalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Verbindungen entscheidend reduziert werden.

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

Algizide wie
2-*tert*-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

Fungizide wie
Benzo[*b*]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, Tolylfluanid und Azole wie
Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

Molluskizide wie
Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb;
oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie
4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Dimethylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutyldistannoxan, 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachloroisophthalonitril, Tetramethylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.

Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten des weiteren die üblichen Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* 1985, *37*, 730-732 und Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973 beschrieben.

Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.

Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittelsystem, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wässrigen System, Vinylchlorid/Vinylacetat-Copolymersysteme in Form wässriger Dispersionen oder in Form von organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke, trocknende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination mit Teer oder Bitumina, Asphalt sowie Epoxyverbindungen, geringe Mengen Chlorkautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.

Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten

verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam. Zu diesen Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. Buthus occitanus.

Aus der Ordnung der Acarina z.B. Argas persicus, Argas reflexus, Bryobia ssp., Dermanyssus gallinae, Glyciphagus domesticus, Ornithodorus moubat, Rhipicephalus sanguineus, Trombicula alfreddugesi, Neutrombicula autumnalis, Dermatophagoides pteronissimus, Dermatophagoides forinae.

Aus der Ordnung der Araneae z.B. Aviculariidae, Araneidae.

Aus der Ordnung der Opiliones z.B. Pseudoscorpiones chelifer, Pseudoscorpiones cheiridium, Opiliones phalangium.

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp..

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus spp..

Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalies, Blattella germanica, Blattella asahinai, Leucophaea maderae, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta australasiae, Periplaneta americana, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Supella longipalpa.

Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. Acheta domesticus.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Kalotermes spp., Reticulitermes spp.

Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. Lepinatus spp., Liposcelis spp.

Aus der Ordnung der Coleptera z.B. Anthrenus spp., Attagenus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae, Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles spp., Calliphora erythrocephala, Chrysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Drosophila spp., Fannia canicularis,

Musca domestica, Phlebotomus spp., Sarcophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Achroia grisella, Galleria mellonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Phthirus pubis.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodinus prolixus, Triatoma infestans.

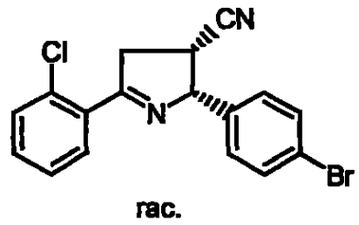
Die Anwendung im Bereich der Haushaltsinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern, Carbamaten, Pyrethroiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.

Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel- und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Stoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

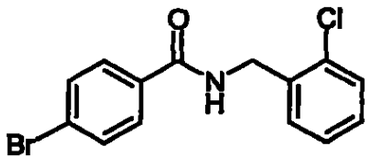
Herstellungsbeispiele

Beispiel 1



rac.

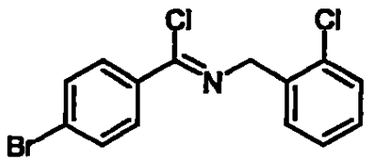
Synthese 1.Stufe:



(VIII-b-1)

Zu einer Mischung bestehend aus 100.5 g (0.50 mol) 4-Brombenzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 1200 ml Dichlormethan wird unter Rühren eine Lösung von 63.5 g (0.50 mol) Oxalychlorid in 50 ml Dichlormethan zugetropft. Nach 4-stündigem Rühren und nach Beendigung der Gasentwicklung (HCl, CO, CO_2) kühlt man unter Argon auf –60°C und tropft innerhalb von 10 Minuten ein Gemisch aus 70.8 g (0.50 mol) 2-Chlorbenzylamin und 161.0 g (1.25 mol) N,N-Diisopropylethylamin hinzu. Nach Rühren über Nacht wird die so erhaltene gelbe Lösung nacheinander dreimal mit je 250 ml 2N Salzsäure, einmal mit 300 ml Wasser und einmal mit 300 ml gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat und vollständigem Einengen erhält man einen Rückstand, der mit 200 ml Dichlormethan bei Raumtemperatur aufgerührt und anschließend abgesaugt wird. Den so erhaltenen Rückstand nimmt man in 200 ml Methyl-tert-butylether auf, erhitzt kurz zum Sieden, lässt Abkühlen und saugt erneut ab.
Man erhält 108 g (83% der Theorie) 4-Brom-N-(2-chlorbenzyl)benzamid vom Schmelzpunkt 133°C.

Synthese 2. Stufe:



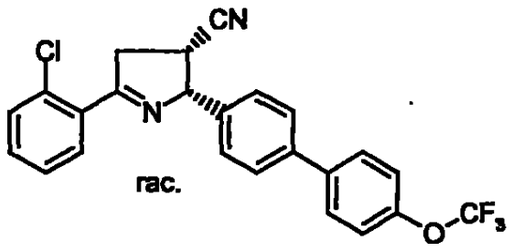
(II-b-1)

Eine Mischung aus 106.4 g (0.34 mol) der Verbindung (VIII-b-1) und 200 ml Thionylchlorid wird für 2 h zum Rückfluss erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur entfernt man das überschüssige Thionylchlorid unter vermindertem Druck. Das so erhaltene gelbe Öl kristallisiert nach kurzem Stehen bei Raumtemperatur.
Man erhält 112.5 g (97 % der Theorie) 4-Brom-N-(2-chlorbenzyl)phenylcarboximidoyl-chlorid vom Schmelzpunkt 58 bis 61°C.

Synthese 3. Stufe:

Eine Mischung aus 55.9 g (163 mmol) der Verbindung (II-b-1), 17.3 g (327 mmol) Acrylsäurenitril und 33.0 g (327 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man mit dreimal 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan chromatographiert.
Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2-chlorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrole-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 110°C.

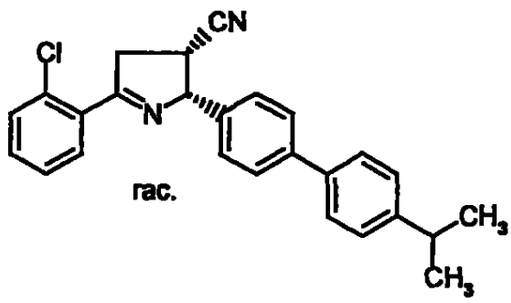
Beispiel 2



Eine Mischung aus 0.997 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-1), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert-butylether ergibt einen weißen Feststoff.

Man erhält 320 mg (26% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 132°C.

Beispiel 3

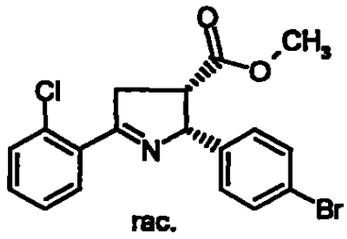


Eine Mischung aus 0.803 g (2.23 mmol) der Verbindung (I-b-1), 0.732 g (4.46 mmol) 4-Isopropyl-phenyl-boronsäure, 0.130 g (0.12 mmol) Tetrakis-tri-

phenylphosphin-Palladium, 15 ml 1,2-Dimethoxyethan und 3.7 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 40 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Chromatographie des so erhaltenen Rückstandes an Kieselgel mit Cyclohexan/ Essigsäureethylester als Eluens ergibt das gewünschte Produkt.

Man erhält 230 mg (26% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(isopropyl)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 127-128°C.

Beispiel 4

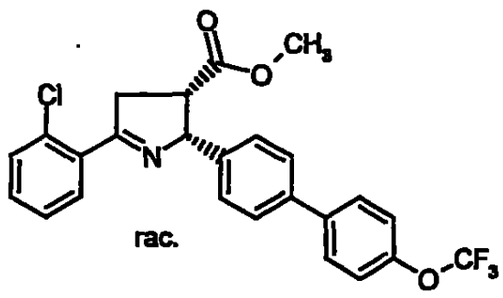


rac.

Eine Mischung aus 55.9 g (163 mmol) der Verbindung (II-b-1), 28.1 g (327 mmol) Acrylsäuremethylester und 33.0 g (327 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man dreimal mit je 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml Konz. Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S)-2-(4-Bromphenyl)-5-(2-chlorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 134°C.

Beispiel 5

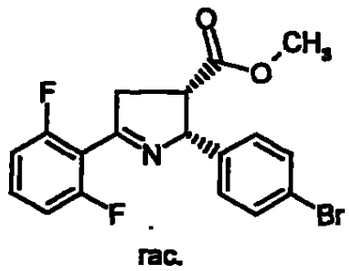


Eine Mischung aus 1.09 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-2), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 prozentige Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Der Rückstand wird an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigsäureethylester als Eluens chromatographiert.

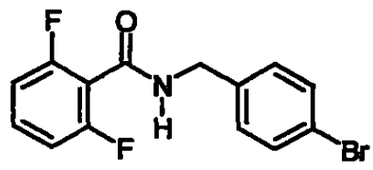
Man erhält 620 mg (47% d. Th.) ((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester als gelbliches Öl.

log P (pH 2.3) = 5.05.

Beispiel 6



Synthese 1. Stufe:

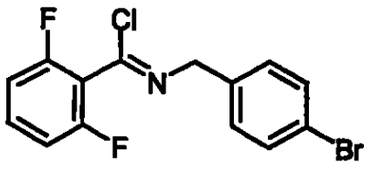


(VIII-a-1)

Zu einer Lösung von 73.3 g (464 mmol) 2,6-Difluorbenzoesäure in 1000 ml Dichlormethan und 2 ml Dimethylformamid wird eine Lösung von 64.8 g (510 mmol) Oxalylchlorid in 200 ml Dichlormethan bei 20°C unter Argon zugetropft (1 h, Innentemperatur fällt ohne Argonstrom auf 15°C). Nach Ende der starken Gasentwicklung (CO_2, CO, HCl) wird auf 35°C erwärmt und 5 min nachgerührt. Anschließend gibt man 103.2 g (464 mmol) 4-Brombenzylaminhydrochlorid zu und tropft eine Lösung von 140.5 g (1391 mmol) Triethylamin in 100 ml Dichlormethan bei 0°C zu der Lösung des Säurechlorids. Nach Beendigung der Reaktion gibt man 200 ml Dichlormethan zu. Dann wird zweimal mit je 500 ml 2N HCl, zweimal mit je 250 ml 2 N NaOH ausgeschüttelt, anschließend neutral gewaschen und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchloridlösung extrahiert. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird filtriert und das Filtrat unter vermindertem Druck vollständig eingeengt. Die gewünschte Verbindung kristallisiert aus Dichlormethan/n-Hexan.

Man erhält 125.7 g (83 % d. Th.) N-(4-Brombenzyl)-2,6-difluorbenzamid vom Schmelzpunkt 142°C.

Synthese 2. Stufe:



(II-a-1)

25 g (76.7 mmol) der Verbindung (VIII-a-1) wird in 60 ml Thionylchlorid für 2 h unter Rückfluss erhitzt. Anschließend engt man unter vermindertem Druck vollständig ein.

Der so erhaltene Rückstand wird ohne weitere Reinigung für die Folgereaktionen eingesetzt.

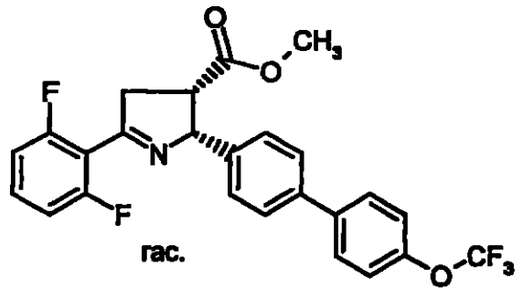
Synthese 3. Stufe:

Eine Mischung von 25.4 g (73.7 mmol) der Verbindung (II-a-1), 25.3 g Acrylsäuremethylester (294 mmol) und 29.8 g (295 mmol) Triethylamin wird für 14 d unter Licht- und Luftausschluss stehen gelassen.

Zur Aufarbeitung nimmt man in 500 ml Dichlormethan auf und extrahiert die organische Phase dreimal mit je 500 ml 2N Salzsäure. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck eingeengt und der so erhaltene Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Methanol als Laufmittel chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 133°C.

Beispiel 7

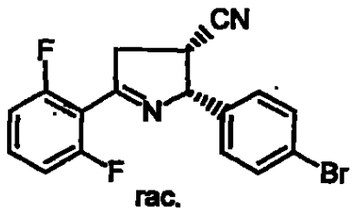


Eine Mischung aus 1.10 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-3), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollstän-

dig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert-butylether ergibt einen weißen Feststoff.

Man erhält 480 mg (39% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-Difluorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 125°C.

Beispiel 8

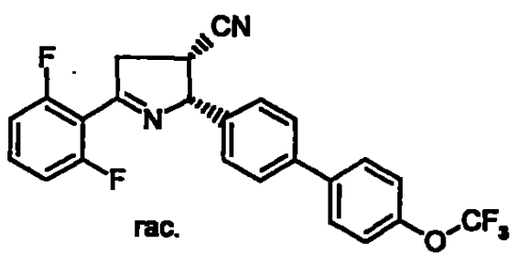


rac.

Eine Mischung aus 25.4 g (76.6 mmol) der Verbindung (II-a-1), 16.2 g (303 mmol) Acrylsäurenitril und 30.7 g (303 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man dreimal mit je 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan als Eluens chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 159°C.

Beispiel 9

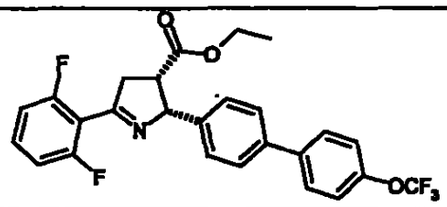
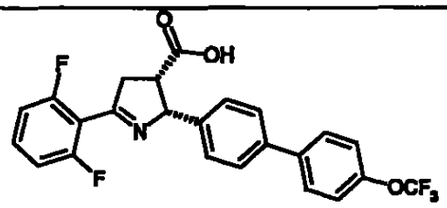
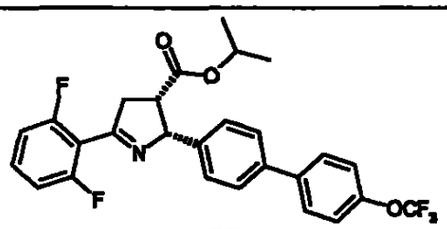


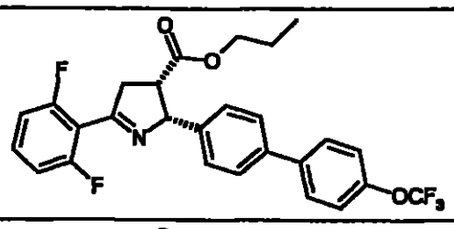
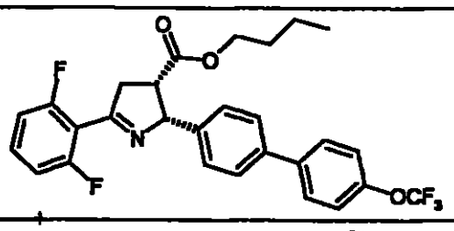
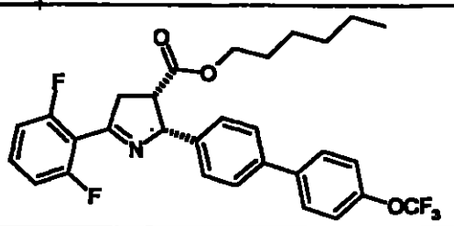
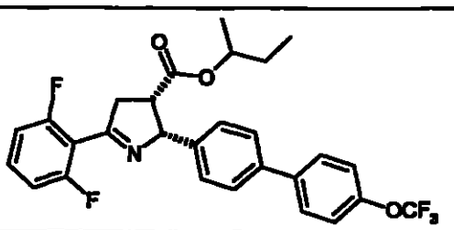
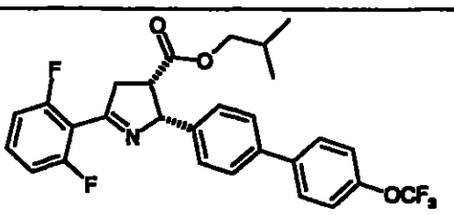
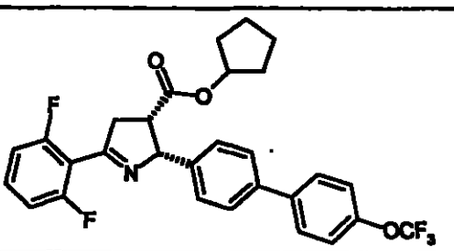
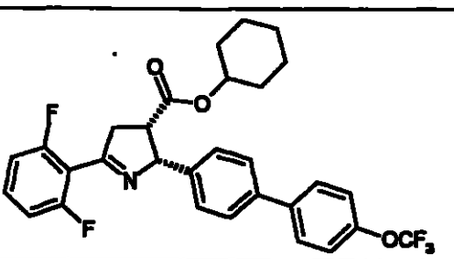
rac.

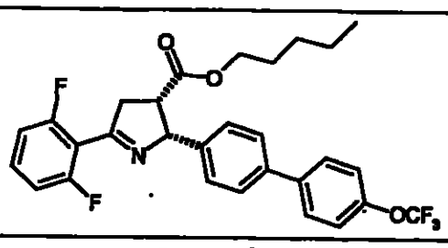
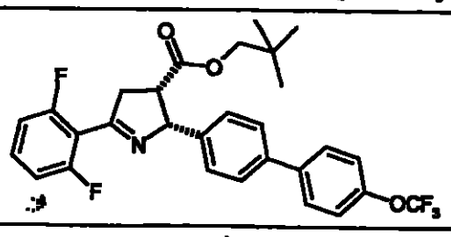
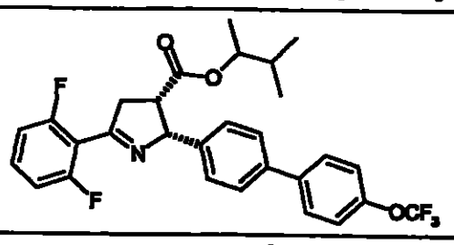
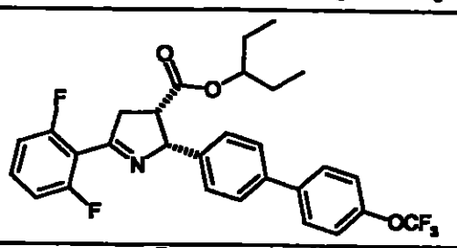
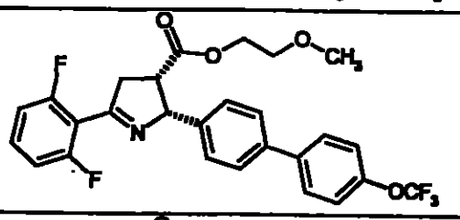
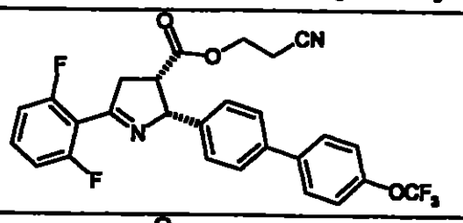
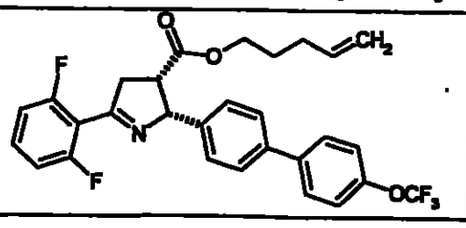
Eine Mischung aus 1.00 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-4), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert-butylether ergibt einen hellgelben Feststoff.

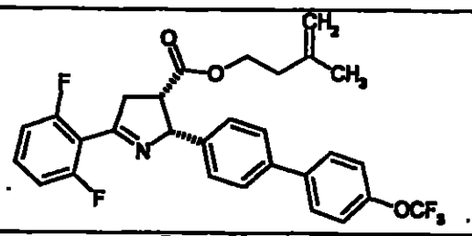
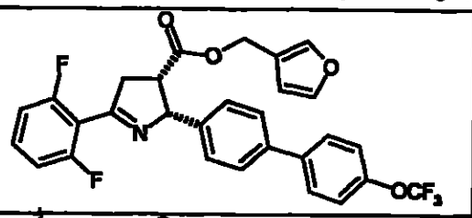
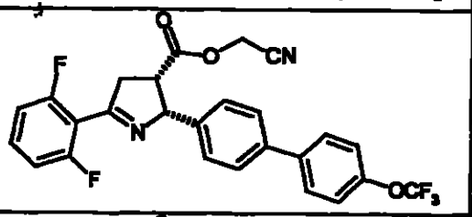
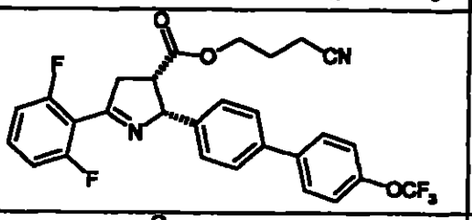
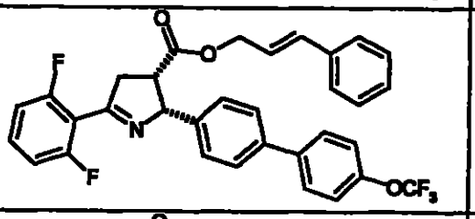
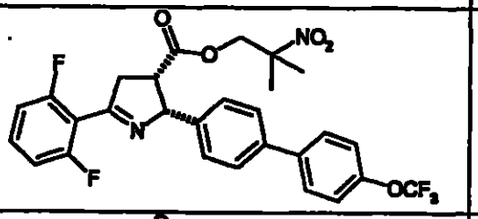
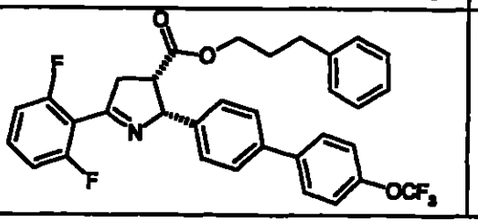
Man erhält 520 mg (42% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-Difluorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt: 145°C.

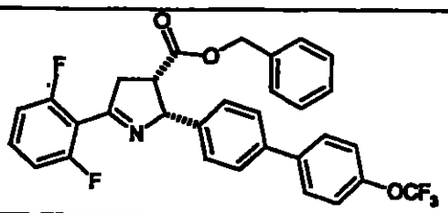
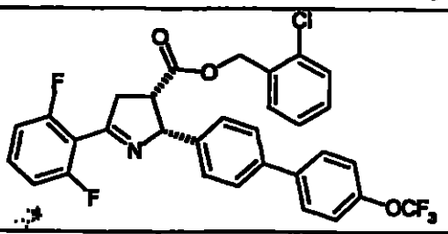
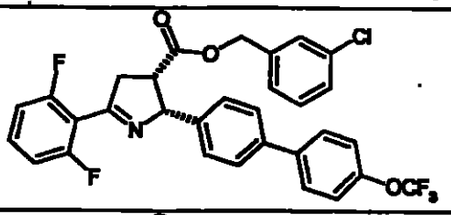
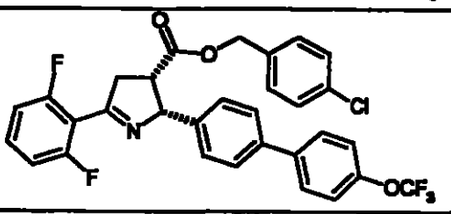
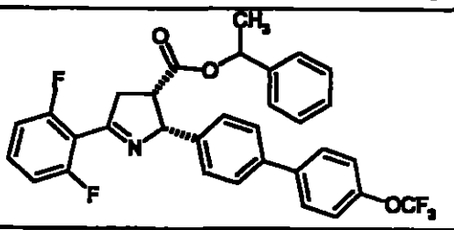
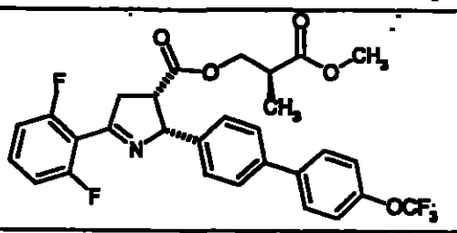
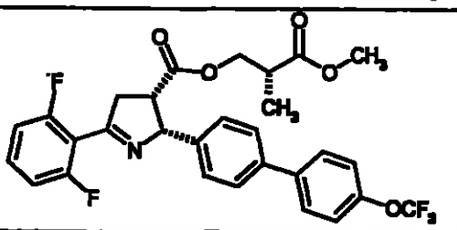
Die in der folgenden Tabelle aufgeführten Verbindungen können entsprechend einem der oben beschriebenen erfindungsgemäßen Verfahren hergestellt werden.

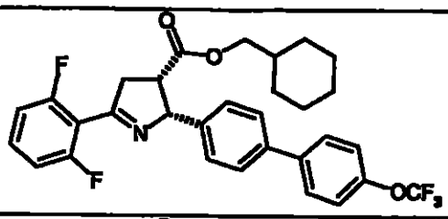
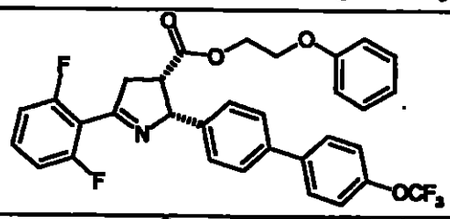
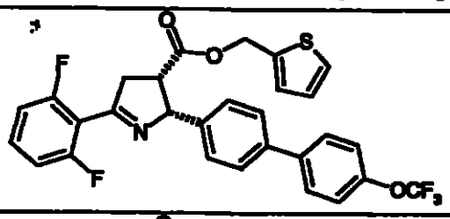
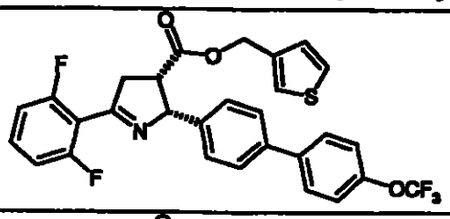
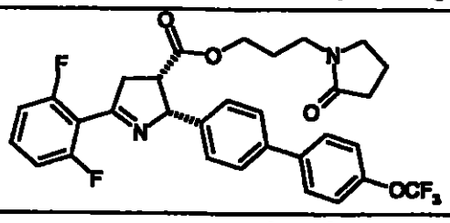
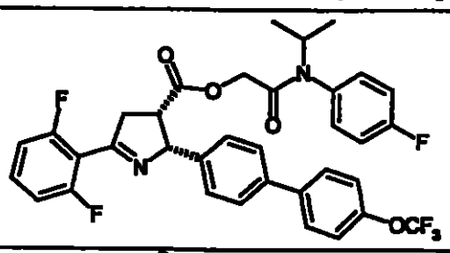
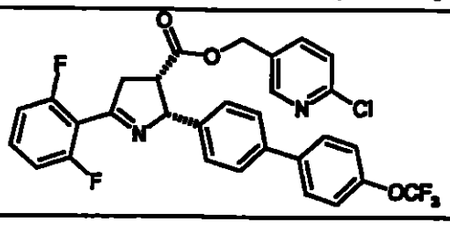
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
10		4.73[a)]	
11		3.35[a)]	
12		5,05[a)]	

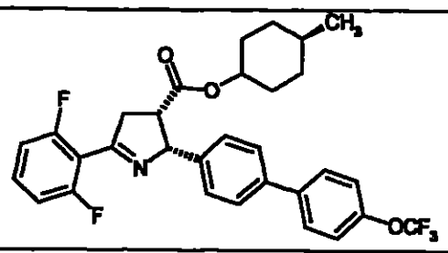
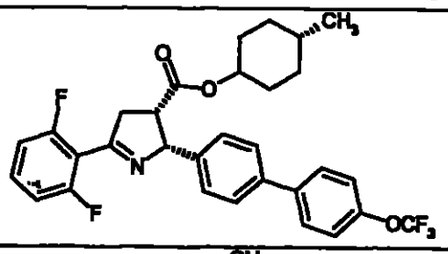
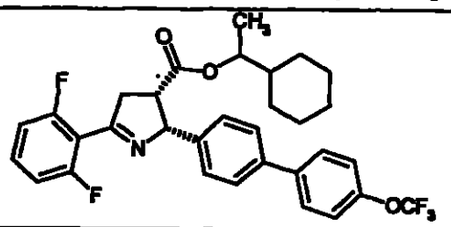
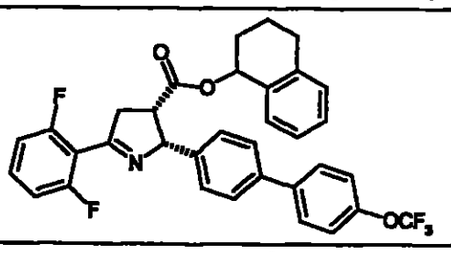
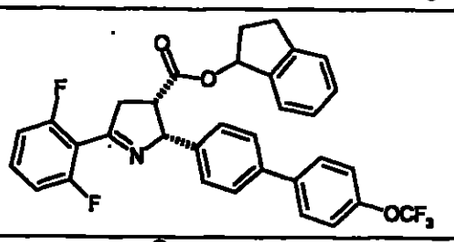
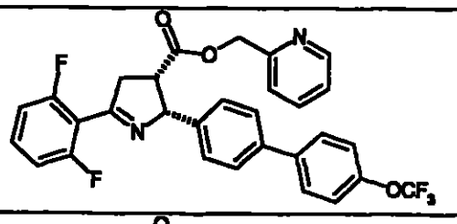
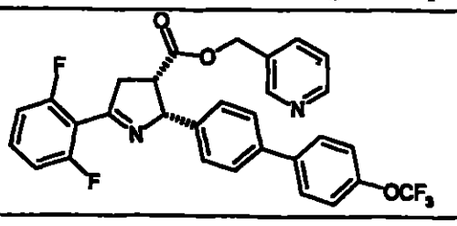
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
13			
14		5,41[a)] 5,49[b)]	
15		6,11[a)] 6,18[b)]	
16		5,40[a)] 5,48[b)]	
17		5,38[a)] 5,47[b)]	
18		5,47[a)] 5,54[b)]	
19		5,85[a)] 5,91[b)]	

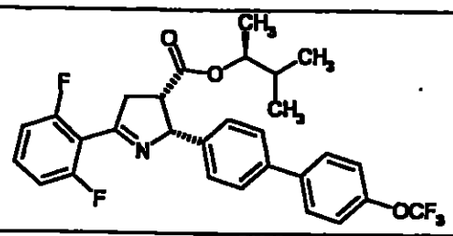
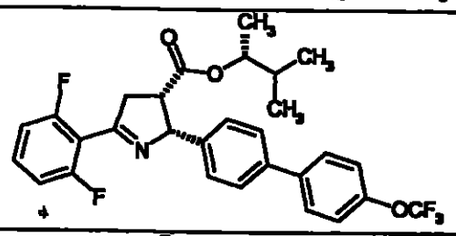
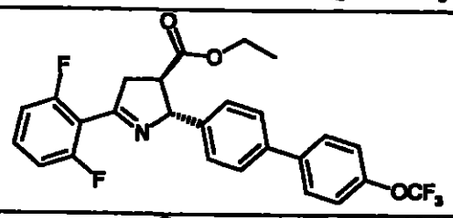
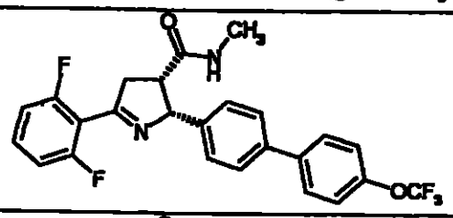
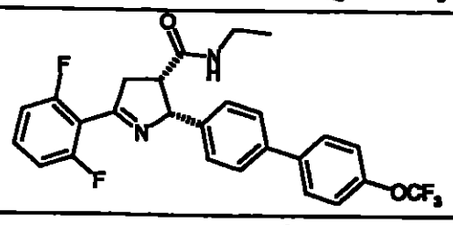
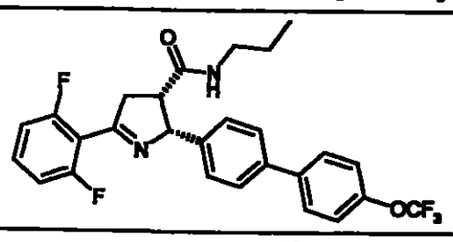
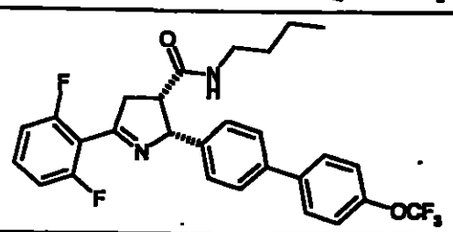
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
20		5,84[a)]	
21		5,78[a)]	
22		5,71[a)]	
23		5,78[a)]	
24		4,37[a)]	
25		4,08[a)]	
26		5,48[a)]	

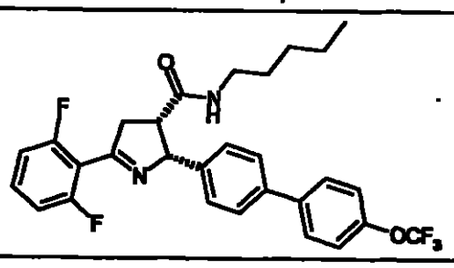
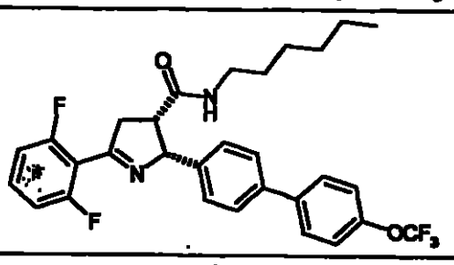
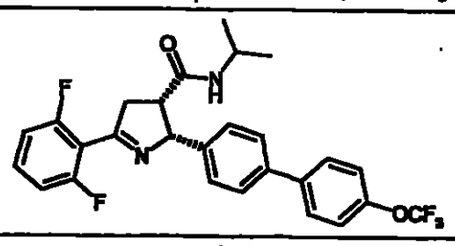
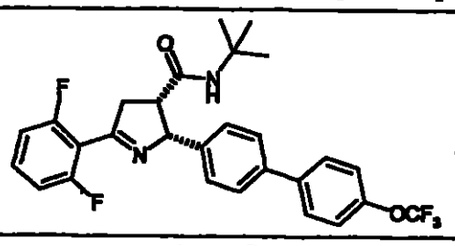
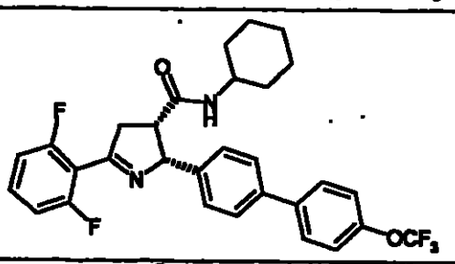
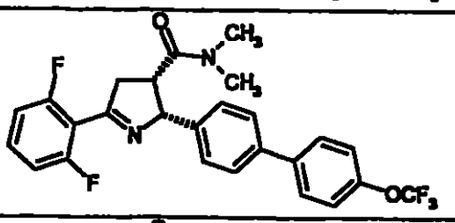
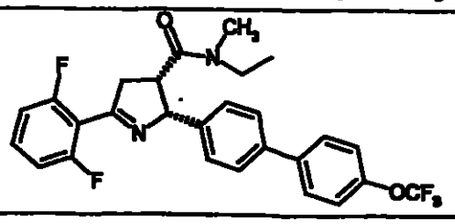
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
27		5,48[a)]	
28		4,87[a)]	
29		4,23[a)]	
30		4,18[a)]	
31		5,55[a)]	
32		4,77[a)]	
33		5,78[a)]	

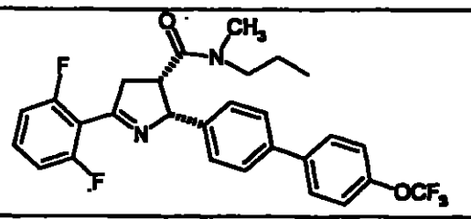
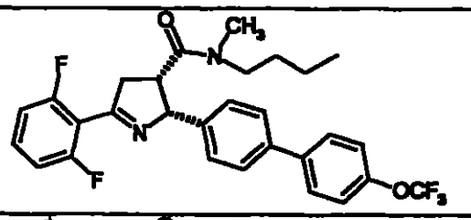
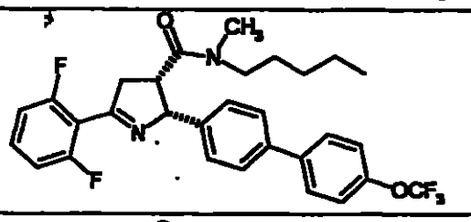
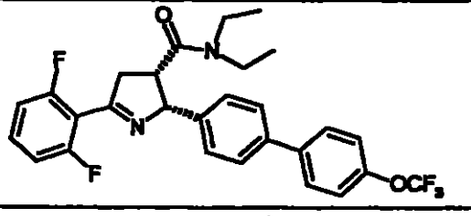
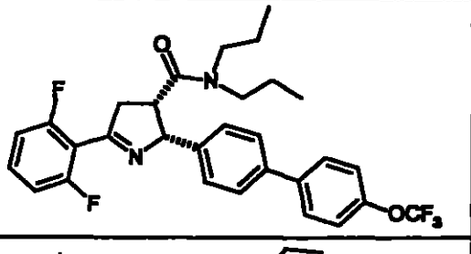
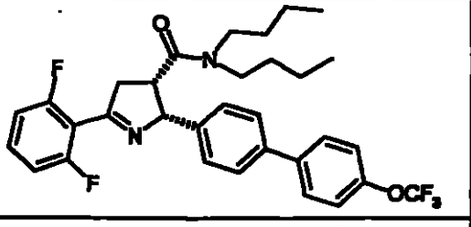
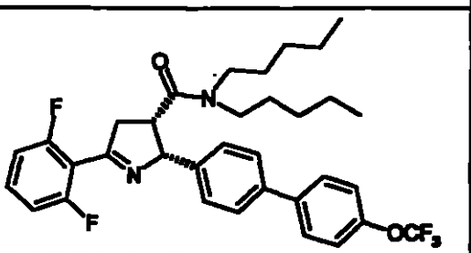
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
34		5,31[a)]	
35		5,65[a)]	
36		5,58[a)]	
37			
38		5,54[a)]	
39		4,67[a)]	
40		4,67[a)]	

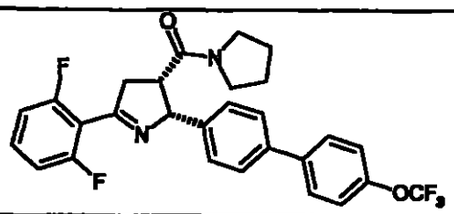
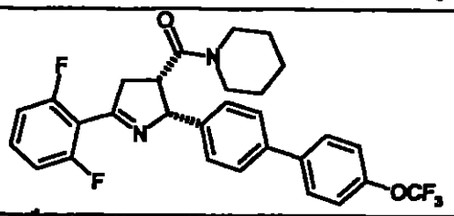
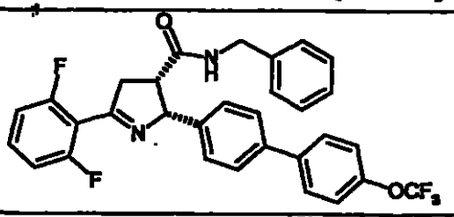
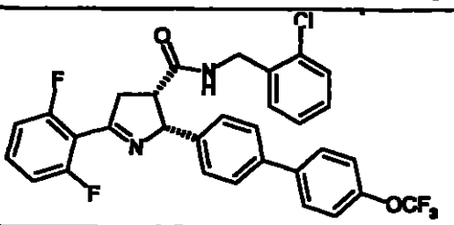
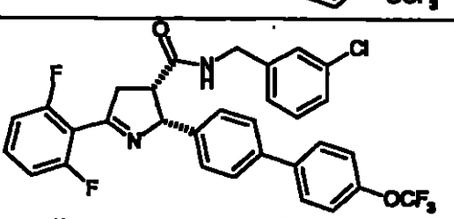
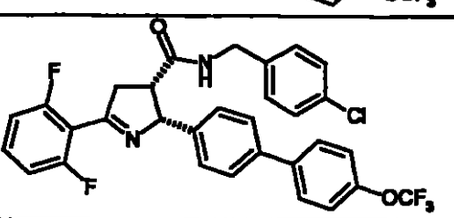
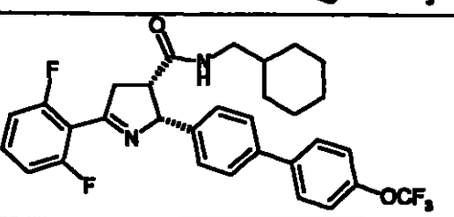
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
41		6,28[a)]	
42		5,21[a)]	
43		5,19[a)]	
44		5,14[a)]	
45		3,72[a)]	
46		4,98[a)]	
47		4,82[a)]	

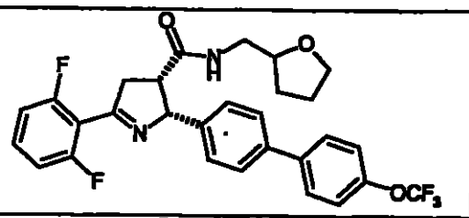
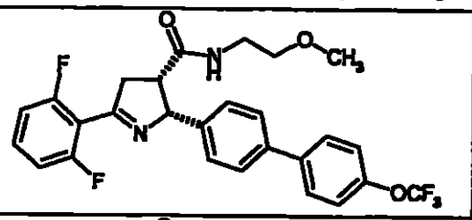
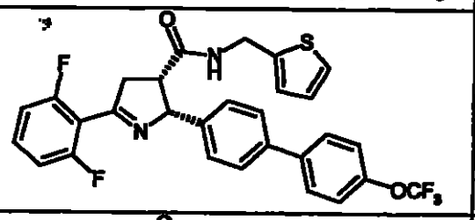
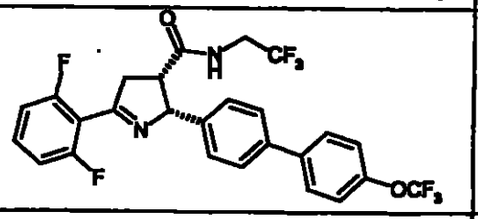
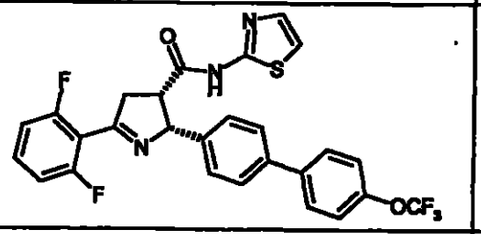
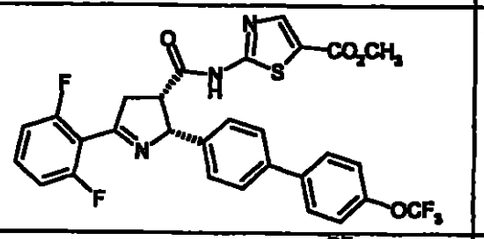
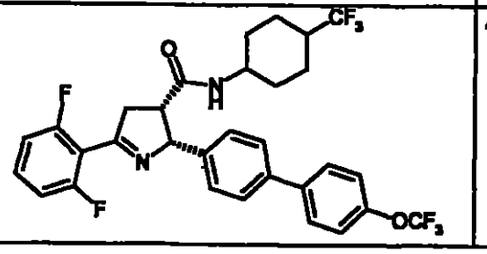
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
48		6,22[a)]	
49		6,28[a)]	
50		6,54[a)]	
51		5,97[a)]	
52		5,71[a)]	
53		4,13[a)]	
54		3,59[a)]	

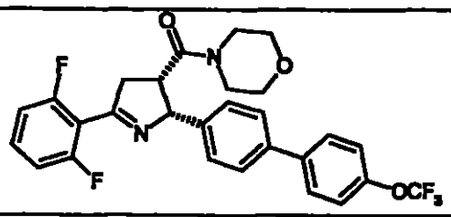
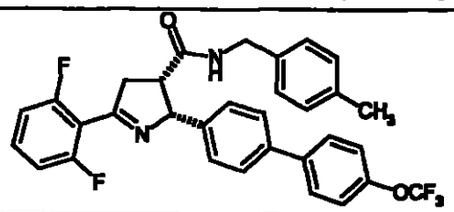
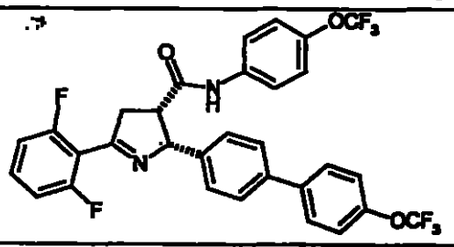
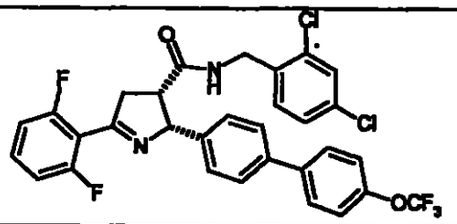
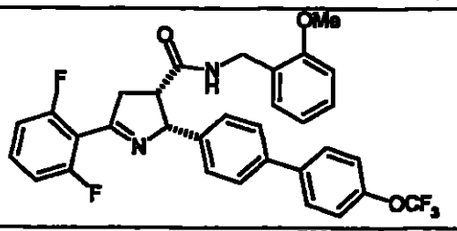
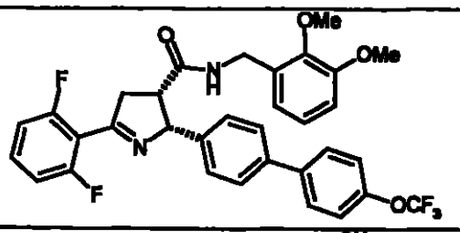
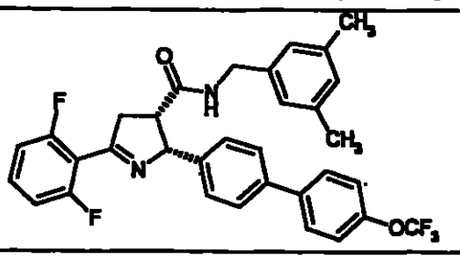
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
55		5,74[a)] 5,77[b)]	
56		5,65[a)] 5,68[b)]	
57			
58		3,26[a)]	
59		3,49[a)]	
60		3,78[a)]	
61		4,03[a)]	

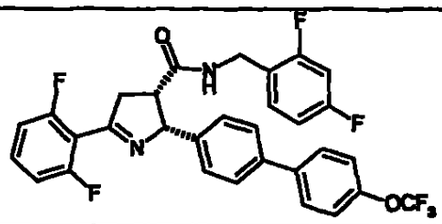
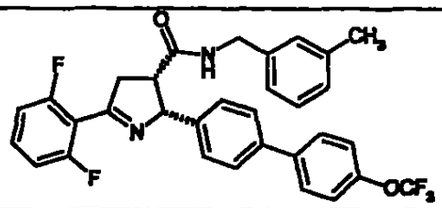
Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
62		4,37[a)]	
63		4,67[a)]	
64		3,74[a)]	
65		4,23[a)]	
66		4,37[a)]	
67		3,61[a)]	
68		3,90[a)]	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
69		4,23[a)]	
70		4,56[a)]	
71		4,92[a)]	
72		4,18[a)]	
73		4,92[a)]	
74		5,65[a)]	
75		6,43[a)]	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
76		3,82[a)]	
77		4,32[a)]	
78		3,94[a)]	
79		4,46[a)]	
80		4,46[a)]	
81		4,41[a)]	
82		4,67[a)]	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
83		3,49[a)]	
84		3,33[a)]	
85		4,03[a)]	
86		3,94[a)]	
87		3,78[a)]	
88		3,94[a)]	
89		4,46[a)]	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
90		3,49a)	
91		4,37a)	
92		4,87a)	
93		4,87a)	
94		4,18a)	
95		4,03a)	
96		4,72a)	

Nr.	Struktur	LogP	Fp/°C
97		4,23[a)]	
98		4,41[a)]	

Die Bestimmung der in den voranstehenden Tabellen und Herstellungsbeispielen angegebenen logP-Werte erfolgt gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Die Bestimmung erfolgt im sauren Bereich bei pH 2.3 mit 0,1% wässriger Phosphorsäure und Acetonitril als Eluenten; linearer Gradient von 10% Acetonitril bis 90% Acetonitril (in der Tabelle mit [a)] markiert).

Die Bestimmung erfolgt im neutralen Bereich bei pH 7.5 mit 0,01-molare wässriger Phosphatpuffer-Lösung und Acetonitril als Eluenten; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril (in der Tabelle mit [b)] markiert).

Die Eichung erfolgt mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele

Beispiel A

Liriomyza-Test

Lösungsmittel:	3	Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator:	1	Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

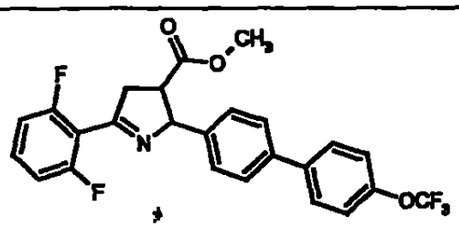
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Bohnenpflanzen (Phaseolus vulgaris), die von Eiern und Entwicklungsstadien der Thripse (Liriomyza trifolii) befallen sind, werden in eine Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration getaucht.

Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Thripse abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Thripse abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle A: Liromyza-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100

Beispiel B

Meloidogyne-Test

Lösungsmittel:	30	Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator:	1	Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

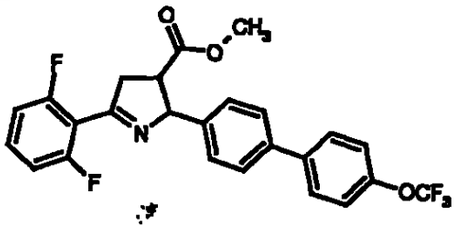
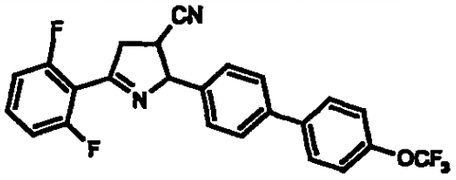
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, Meloidogyne incognita-Ei-Larvensuspension und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass keine Gallen gefunden wurden; 0% bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der der unbehandelten Kontrolle entspricht.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B: Meloidogyne-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 Tagen
	20	100
	20	90

Beispiel C

Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

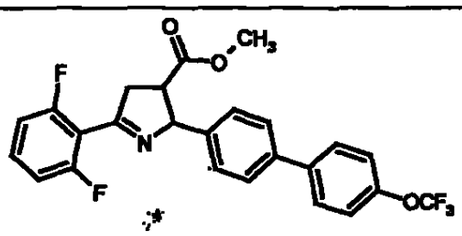
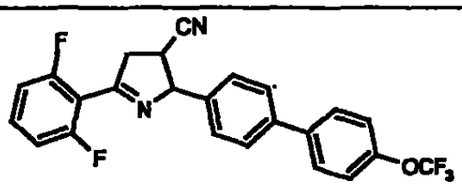
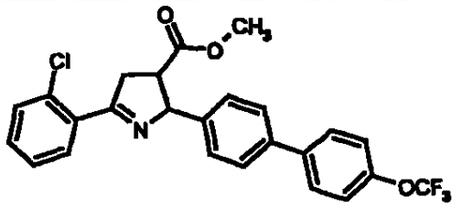
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichkäfers (Phaedon cochleariae) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C: Phaedon-Larven-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Beispiel D

Spodoptera frugiperda-Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

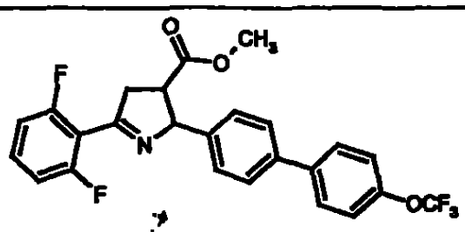
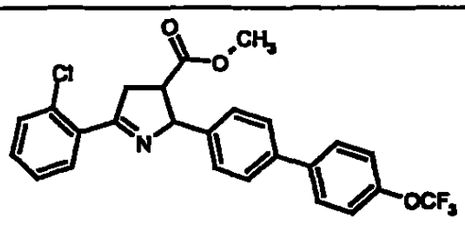
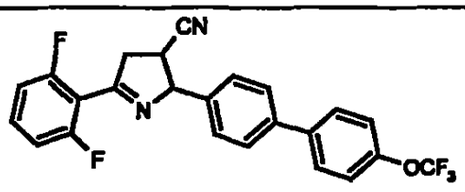
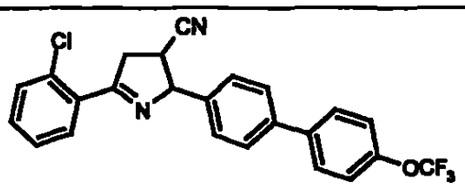
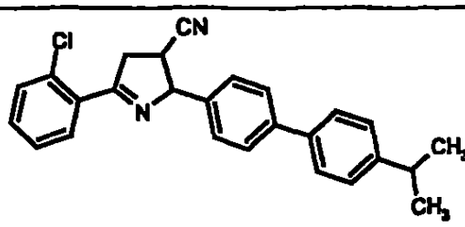
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurmes (Spodoptera frugiperda) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle D: Spodoptera frugiperda -Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Beispiel E

Diabrotica balteata – Test (Larven im Boden)

Grenzkonzentrations-Test / Bodeninsekten - Behandlung transgener Pflanzen

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Die Wirkstoffzubereitung wird auf den Boden gegossen. Dabei spielt die Konzentration des Wirkstoffs in der Zubereitung praktisch keine Rolle, entscheidend ist allein die Wirkstoffgewichtsmenge pro Volumeneinheit Boden, welche in ppm (mg/l) angegeben wird. Man füllt den Boden in 0,25 l Töpfe und lässt diese bei 20°C stehen.

Sofort nach dem Ansatz werden je Topf 5 vorgekeimte Maiskörner der Sorte YIELD GUARD (Warenzeichen von Monsanto Comp., USA) gelegt. Nach 2 Tagen werden in den behandelten Boden die entsprechenden Testinsekten gesetzt. Nach weiteren 7 Tagen wird der Wirkungsgrad des Wirkstoffs durch Auszählen der aufgelaufenen Maispflanzen bestimmt (1 Pflanze = 20 % Wirkung).

Beispiel F

Heliothis virescens - Test (Behandlung transgener Pflanzen)

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

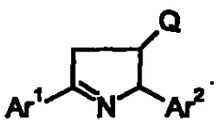
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Sojatriebe (Glycine max) der Sorte Roundup Ready (Warenzeichen der Monsanto Comp. USA) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit der Tabakknospenraupe Heliothis virescens besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

Patentansprüche

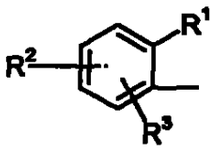
1. Δ^1-Pyrroline der Formel (I)



(I)

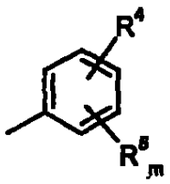
in welcher

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in denen

m für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

R^1 für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_0R^6$, $-NR^7R^8$ steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_0R^6$, $-NR^7R^8$ stehen,

R^4 für Halogen oder eine der folgenden Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Halogen, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_cR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Halogenalkylaminosulfonyl, Bisalkoxyboran, $-B(OH)_2$ steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_c$, $-NR^6$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen steht,

A für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit einem oder mehreren Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff oder $-S(O)_c-$ steht,

D für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Halogenalkylen, Halogenalkenylen steht,

E für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

Q außerdem für $-CO_2R^{13}$ oder $-CONR^{14}R^{15}$ steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Aralkyl, Phenyl steht,

R^{10} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl steht,

R^{11} für Alkyl, Aryl steht,

R^{12} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl oder Aryl steht,

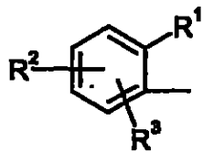
R^{13} für Wasserstoff; für einfach oder mehrfach substituiertes Alkyl; für gegebenenfalls substituiertes Aminocarbonylalkyl; für Alkenyl, Phenylalkenyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylalkyl oder Phenoxyalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl steht,

R^{14} und R^{15} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogenalkyl, Alkoxyalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkylalkyl; für jeweils gegebenenfalls substituiertes, jeweils gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,

R^{14} und R^{15} außerdem gemeinsam für Alkylenoxyalkylen oder Alkylenthioalkylen stehen.

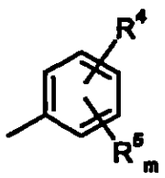
2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, worin

m für 0, 1, 2 oder 3 steht,

R^1 für Halogen, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$ steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$ stehen,

R^4 für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindliche Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Halogen, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, Tri(C_1-C_6-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (C_1-C_6-Halogenalkyl)aminosulfonyl, Bis(C_1-C_6-alkoxy)boran, $-B(OH)_2$ steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_o$, $-NR^6$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen steht,

A für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl) steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n$-, Sauerstoff oder $-S(O)_o$- steht,

D für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen, C_1-C_6-Halogenalkylen, C_2-C_6-Halogenalkenylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen steht,

E für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder

ungesättigten Heterocyclus mit 2 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

Q außerdem für $-CO_2R^{13}$ oder $-CONR^{14}R^{15}$ steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl, Phenyl steht,

R^{10} für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl steht,

R^{11} für C_1-C_6-Alkyl, Phenyl steht,

R^{12} für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl oder Phenyl steht,

R^{13} für Wasserstoff; für einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl oder 2-Pyrrolidinon substituiertes C_1-C_6-Alkyl; für Aminocarbonyl-C_1-C_6-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C_1-C_4-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C_2-C_8-Alkenyl, Phenyl-C_2-C_6-alkenyl; für Phenyl-C_1-C_4-alkyl oder Phenoxy-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy oder C_1-C_4-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im

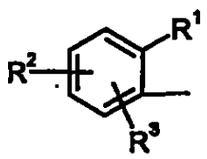
Cycloalkylring einfach bis dreifach durch C_1-C_4-Alkyl substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C_1-C_4-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen substituiert sein kann; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl steht,

R^{14} und R^{15} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Halogenalkyl oder C_1-C_4-Halogenalkoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Halogenalkyl oder C_1-C_4-Halogenalkoxy substituiert sein können; für 5- oder 6-gliedriges gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C_1-C_4-alkyl mit jeweils 1 bis 4 Heteroatomen kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl), wobei der Heterocyclus jeweils durch Halogen oder C_1-C_4-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann stehen,

R^{14} und R^{15} außerdem gemeinsam für C_1-C_4-Alkylenoxy-C_1-C_4-alkylen oder C_1-C_4-Alkylenthio-C_1-C_4-alkylen stehen.

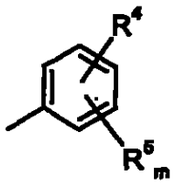
3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in welchen

m für 0, 1 oder 2 steht,

R^1 für Fluor, Chlor, Brom, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy stehen,

R^4 für Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy, $-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan) steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropylen, Oxiranylen steht,

A für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen (insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl) steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff oder $-S(O)_o-$ steht,

D für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_4-Alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_4-Alkylsulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen; jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkylen oder C_2-C_6-Alkenylen; C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen steht,

E für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_6-Alkylsulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_4-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_nR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, $-OSO_2CF_3$, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_nR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2 oder 3 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, $-CN$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4

Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel (insbesondere Dihydrodioxazin, Oxazolin, Thiazolin, Imidazolin, Tetrazol) steht,

Q außerdem für $-CO_2R^{13}$ oder $-CONR^{14}R^{15}$ steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für C_1-C_6-Alkyl oder jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, oder gemeinsam für C_4-C_5-Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, Benzyl, Phenyl steht,

R^{10} für C_1-C_6-Alkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl steht,

R^{11} für C_1-C_4-Alkyl, Phenyl steht,

R^{12} für C_1-C_4-Alkyl oder für durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl steht,

R^{13} für Wasserstoff; für einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Cyano, Nitro, Methoxy, Methoxycarbonyl oder 2-Pyrrolidinon substituiertes C_1-C_4-Alkyl; für Aminocarbonyl-C_1-C_4-alkyl, welches an der Aminogruppe gleich oder verschieden durch C_1-C_4-Alkyl, Phenyl oder Halogenphenyl substituiert sein kann; für C_2-C_6-Alkenyl,

Phenyl-C_2-C_5-alkenyl; für Phenyl-C_1-C_4-alkyl oder Phenoxy-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach durch Methyl substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Pyridinyl, Furfuryl, Thenyl oder Pyridinylmethyl, welche jeweils im Heterocyclus durch Chlor substituiert sein können; für Tetrahydronaphthyl oder Indanyl steht,

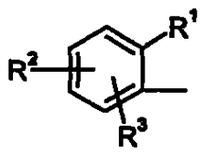
R^{14} für Wasserstoff steht,

R^{15} für C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl; für Phenyl oder Phenyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Phenylring einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für C_3-C_6-Cycloalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl-C_1-C_4-alkyl, welche jeweils im Cycloalkylring einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein können; für Furyl, Thienyl, Tetrahydrofuryl, Furfuryl, Thenyl, Tetrahydrofurylmethyl, Thiazolyl oder durch C_1-C_4-Alkoxycarbonyl substituiertes Thiazolyl steht,

R^{14} und R^{15} außerdem gemeinsam für Morpholino oder Thiomorpholino stehen.

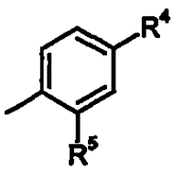
4. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in welchen

R^1 für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy stehen,

R^4 für Chlor, Brom oder eine der folgenden Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$ oder $-SO_2CF_3$ steht,

R^5 außerdem für Wasserstoff steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, $-CH=CH-$ (E oder Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$ steht,

A für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl steht,

B für gegebenenfalls einfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für Sauerstoff, Schwefel oder $-SO_2-$ steht,

D für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$ steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, $-CH=CH-$ (E oder Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$ steht,

E für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$,

$-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$ steht,

W^1 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec-Butoxy, tert-Butoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$, $-SOCHF_2$, $-SOCF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe steht,

W^2 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe steht,

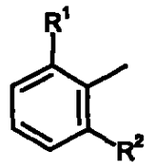
Q für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec-Butyl, $-CO_2$-tert-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, $-CO_2$-Trifluorethyl, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-Propyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, $-PO(OMe)_2$, Pyrrolidi-

nocarbonyl, Piperidinocarbonyl, -PO(OEt)$_2$, -PO(OPh)$_2$, Dihydrodioxacinyl, Oxazolyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Tetrazolyl steht,

Q außerdem für -CO_2CH_2CN, -$CO_2(CH_2)_2CN$, -$CO_2(CH_2)_3CN$, -$CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, -$CO_2(CH_2)_2OCH_3$, -CO_2H, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethyloxycarbonyl, -$CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, -$CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, -$CO_2CH_2CH=CH$-Ph, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyloxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthyloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, -CON(H)CH_2CF_3, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenyl-aminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl steht,

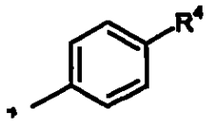
5. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^1 für den Rest



steht,

Ar^2 für den Rest



steht,

R^1 für Fluor oder Chlor steht,

R^2 für Wasserstoff, Chlor oder Fluor steht,

R^4 für -B-Z-D steht,

B für p-Phenylen steht,

Z für Sauerstoff oder Schwefel steht,

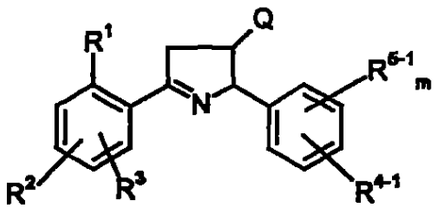
D für $-CF_3$ steht,

Q für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec-Butyl, $-CO_2$-tert-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH-(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et,

-CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl steht,

Q außerdem für $-CO_2H$, $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, 2-Methoxycarbonyl-propyloxycarbonyl, 3-(2-Oxo-1-pyrrolidinyl)propyloxycarbonyl, N-4-Fluorphenyl-N-isopropyl-amino-2-oxo-ethyloxycarbonyl, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH-Ph$, 2-Chlorbenzyloxycarbonyl, 3-Chlorbenzyloxycarbonyl, 4-Chlorbenzyloxycarbonyl, 1-Phenylethyloxycarbonyl, 3-Phenylpropyloxycarbonyl, 2-Phenoxyethyloxycarbonyl, 4-Methylcyclohexyloxycarbonyl, Cyclohexylmethyloxycarbonyl, 1-Cyclohexylethyloxycarbonyl, 3-Furfuryloxycarbonyl, 2-Thenyloxycarbonyl, 3-Thenyloxycarbonyl, 2-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 3-Pyridinylmethyloxycarbonyl, 6-Chlor-3-pyridinylmethyloxycarbonyl, 1-Tetrahydronaphthyloxycarbonyl, 1-Indanyloxycarbonyl, $-CON(H)CH_2CF_3$, Methoxyethylaminocarbonyl, 4-Trifluormethoxyphenyl-aminocarbonyl, Benzyl-aminocarbonyl, 2-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Chlorbenzyl-aminocarbonyl, 3-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 4-Methylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Dichlorbenzyl-aminocarbonyl, 2-Methoxybenzyl-aminocarbonyl, 2,3-Dimethoxybenzyl-aminocarbonyl, 3,5-Dimethylbenzyl-aminocarbonyl, 2,4-Difluorbenzyl-aminocarbonyl, 4-Trifluormethylcyclohexyl-aminocarbonyl, Cyclohexylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thenyl-aminocarbonyl, 2-Tetrahydrofurylmethyl-aminocarbonyl, 2-Thiazolyl-aminocarbonyl, 5-Methoxycarbonyl-2-thiazolyl-aminocarbonyl oder für Morpholinocarbonyl steht.

6. Δ^1-Pyrroline der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher

R^1, R^2, R^3, Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

R^{4-1} für A oder B-Z-D

steht, wobei

A, B, Z und D die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

und

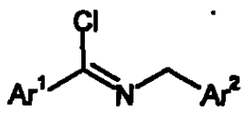
R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Haloalkylaminosulfonyl steht,

wobei

R^6, R^7, R^8 und o die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben.

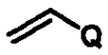
7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet,

A-1.) dass man Iminochloride der Formel (II-a)



(II-a)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



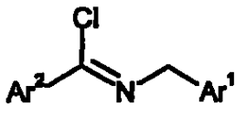
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

A-2.) dass man Iminochloride der Formel (II-b)



(II-b)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



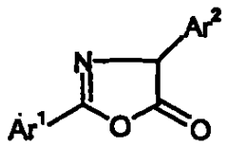
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

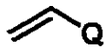
in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

B.) dass man Oxazolinone der Formel (IV)



(IV)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



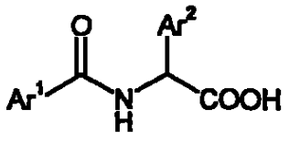
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

C.) dass man Carbonsäuren der Formel (V)



(V)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



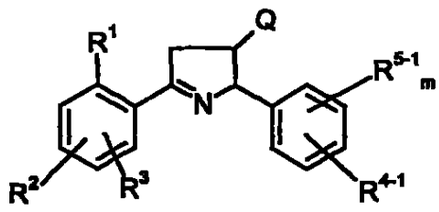
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart von Essigsäureanhydrid und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

D.) dass man Δ^1-Pyrroline der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher

R^1, R^2, R^3, Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

R^{4-1} für A oder B-Z-D

steht, wobei

A, B, Z und D die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

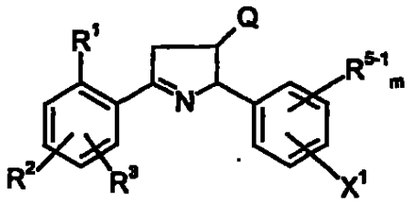
und

R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Haloalkylaminosulfonyl steht,

wobei

R^6, R^7, R^8 und o die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man Verbindungen der Formel (I-b)



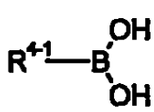
(I-b)

in welcher

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben und

X^1 für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht

mit Boronsäuren der Formel (VI)



(VI)

in welcher

R^{4-1} die in diesem Anspruch angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt

oder

dass man Verbindungen der Formel (I-a) erhält, indem man Verbindungen der Formel (I-b)

in welcher

X^1 für 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan) steht

mit (Hetero)cyclen der Formel (VII)

T—A (VII)

in welcher A die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebene Bedeutung hat und

T für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

8. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

9. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zur Bekämpfung von Schädlingen.

10. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.

11. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

12. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter nal Application No
PCT/EP 01/10422

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D207/22 C07D207/26 C07D409/14 C07D401/14 C07D405/14
C07D417/14 A01N43/36

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)
IPC 7 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, WPI 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.
A	WO 99 59968 A (ERDELEN CHRISTOPH ;BAYER AG (DE); GRAFF ALAN (DE); KRAATZ UDO (DE)) 25 November 1999 (1999-11-25) cited in the application claims 8-12; table 1	1,8
A	WO 98 22438 A (ERDELEN CHRISTOPH ;KLEEFELD GERD (DE); BAYER AG (DE); MENCKE NORBE) 28 May 1998 (1998-05-28) cited in the application claims 9-13; table 1	1,8
A	WO 99 59967 A (ERDELEN CHRISTOPH ;BACKHAUS DIRK (DE); BAYER AG (DE); MENCKE NORBE) 25 November 1999 (1999-11-25) cited in the application claims 8-12; table 1	1,8

-/—

[X] Further documents are listed in the continuation of box C. [X] Patent family members are listed in 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	Date of mailing of the international search report
3 January 2002	15/01/2002

Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016	Seitner, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter nal Application No
PCT/EP 01/10422

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 0 183 217 A (CIBA GEIGY AG) 4 June 1986 (1986-06-04) claims 1,21-29	1,8

Form PCT/ISA/210 (continuation of second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

ormation on patent family members

Inter nal Application No
PCT/EP 01/10422

81

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9959968 A	25-11-1999	DE 19822247 A1	25-11-1999
		AU 4138499 A	06-12-1999
		BR 9910539 A	16-01-2001
		CN 1309636 T	22-08-2001
		WO 9959968 A1	25-11-1999
		EP 1080072 A1	07-03-2001
		HU 0102615 A2	28-11-2001
WO 9822438 A	28-05-1998	DE 19648011 A1	28-05-1998
		AU 737059 B2	09-08-2001
		AU 5319798 A	10-06-1998
		BR 9713520 A	21-03-2000
		CN 1244860 A	16-02-2000
		WO 9822438 A1	28-05-1998
		EP 0942901 A1	22-09-1999
		HU 0000437 A2	28-06-2000
		JP 2001506592 T	22-05-2001
		PL 333268 A1	22-11-1999
		TR 9901601 T2	21-09-1999
		US 6274613 B1	14-08-2001
WO 9959967 A	25-11-1999	DE 19822245 A1	25-11-1999
		AU 4036999 A	06-12-1999
		BR 9910540 A	30-01-2001
		WO 9959967 A1	25-11-1999
		EP 1077938 A1	28-02-2001
EP 0183217 A	04-06-1986	AT 53574 T	15-06-1990
		AU 612838 B2	18-07-1991
		AU 3491489 A	07-09-1989
		AU 586653 B2	20-07-1989
		AU 5039685 A	05-06-1986
		CA 1253509 A1	02-05-1989
		CA 1256884 A2	04-07-1989
		CA 1256869 A2	04-07-1989
		DE 3578171 D1	19-07-1990
		EP 0183217 A1	04-06-1986
		IL 88372 A	10-06-1990
		JP 61137858 A	25-06-1986
		US 4778901 A	18-10-1988
		US 4687861 A	18-08-1987
		ZA 8509068 A	30-07-1986

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 01/10422

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	EP 0 183 217 A (CIBA GEIGY AG) 4. Juni 1986 (1986-06-04) Ansprüche 1,21-29	1,8

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 9959968	A	25-11-1999	DE	19822247 A1	25-11-1999
			AU	4138499 A	06-12-1999
			BR	9910539 A	16-01-2001
			CN	1309636 T	22-08-2001
			WO	9959968 A1	25-11-1999
			EP	1080072 A1	07-03-2001
			HU	0102615 A2	28-11-2001
WO 9822438	A	28-05-1998	DE	19648011 A1	28-05-1998
			AU	737059 B2	09-08-2001
			AU	5319798 A	10-06-1998
			BR	9713520 A	21-03-2000
			CN	1244860 A	16-02-2000
			WO	9822438 A1	28-05-1998
			EP	0942901 A1	22-09-1999
			HU	0000437 A2	28-06-2000
			JP	2001506592 T	22-05-2001
			PL	333268 A1	22-11-1999
			TR	9901601 T2	21-09-1999
			US	6274613 B1	14-08-2001
WO 9959967	A	25-11-1999	DE	19822245 A1	25-11-1999
			AU	4036999 A	06-12-1999
			BR	9910540 A	30-01-2001
			WO	9959967 A1	25-11-1999
			EP	1077938 A1	28-02-2001
EP 0183217	A	04-06-1986	AT	53574 T	15-06-1990
			AU	612838 B2	18-07-1991
			AU	3491489 A	07-09-1989
			AU	586653 B2	20-07-1989
			AU	5039685 A	05-06-1986
			CA	1253509 A1	02-05-1989
			CA	1256884 A2	04-07-1989
			CA	1256869 A2	04-07-1989
			DE	3578171 D1	19-07-1990
			EP	0183217 A1	04-06-1986
			IL	88372 A	10-06-1990
			JP	61137858 A	25-06-1986
			US	4778901 A	18-10-1988
			US	4687861 A	18-08-1987
			ZA	8509068 A	30-07-1986

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

83

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	WEITERES VORGEHEN	siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)
Le A 34 277-WO		

Internationales Aktenzeichen	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)
PCT/EP 01/ 10422	10/09/2001	22/09/2000

Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK

C07D207/22

Anmelder

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT et al.

1. Der internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.

2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt _____ Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften zum PCT)

Diese Anlagen umfassen insgesamt _____ Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben und die entsprechenden Seiten zu folgenden Punkten:

I ☒ Grundlage des Berichts

II ☐ Priorität

III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

IV. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen

VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags	Datum der Fertigstellung dieses Berichts
12/02/2002	25/03/2002

Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde	Bevollmächtigter Bediensteter
Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d Fax: (+49-89) 2399-4465	VERHULST W

Formblatt PCT/IPEA/409 (Deckblatt)(Juli 1998)

I. Grundlage des Berichts

Grundlage dieses Berichtes sind die Anmeldungsunterlagen in der ursprünglich eingereichten Fassung.

V. Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit

In Anbetracht der im internationalen Recherchenbericht angeführten Unterlagen wird festgestellt, daß die Erfindung, wie sie in den Ansprüchen gekennzeichnet ist, die in Artikel 33(1) PCT aufgeführten Kriterien erfüllt, d.h. als neu und auf erfinderischer Tätigkeit beruhend anzusehen ist.

Translation

85

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

7

Applicant's or agent's file reference LEA34277-WO	FOR FURTHER ACTION	See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)
International application No. PCT/EP01/10422	International filing date (*day/month/year*) 10 September 2001 (10.09.01)	Priority date (*day/month/year*) 22 September 2000 (22.09.00)

International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC
C07D 207/22

Applicant
BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 2 sheets, including this cover sheet.

☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of _____ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand	Date of completion of this report
12 February 2002 (12.02.02)	25 March 2002 (25.03.2002)
Name and mailing address of the IPEA/EP Facsimile No.	Authorized officer Telephone No.

I. Basis of the report

The basis of international preliminary examination report is the application as originally filed.

V. Reasoned statement under Rule 66.2(a)(ii) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability

In light of the documents cited in the international search report, it is considered that the invention as defined in the claims meets the criteria mentioned in Article 33(1) PCT, i.e. it appears to be novel, to involve an inventive step and to be industrially applicable.

PCT-ANTRAG LEA34277-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 26.07.2001 08:21:24 AM

0	Vom Anmeldeamt auszufüllen	
0-1	Internationales Aktenzeichen	
0-2	Internationales Anmeldedatum	
0-3	Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"	
0-4	Formular - PCT/RO/101 PCT-Antrag	
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-EASY Version 2.91 (aktualisiert 01.01.2001)
0-5	Antragsersuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird	
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	LEA34277-WO
I	Bezeichnung der Erfindung	DELTA1-PYRROLINE
II	Anmelder	
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US
II-4	Name	BAYER AKTIENGESELLSCHAFT
II-5	Anschrift:	D-51368 Leverkusen Deutschland
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-8	Telefonnr.	0214 30 71166
II-9	Telefaxnr.	0214 30 53482
III-1	Anmelder und/oder Erfinder	
III-1-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-1-2	Anmelder für	Nur US
III-1-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	JANSEN, Johannes-Rudolf
III-1-5	Anschrift:	Knippratherstr 47 D-40789 Monheim Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-2	Anmelder und/oder Erfinder	
III-2-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-2-2	Anmelder für	Nur US
III-2-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	PLANT, Andrew
III-2-5	Anschrift:	1, Meadow View Winnersh, Berkshire RG 41/5PD Vereinigtes Königreich
III-2-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	GB
III-2-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	GB
III-3	Anmelder und/oder Erfinder	
III-3-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-3-2	Anmelder für	Nur US
III-3-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ALIG, Bernd
III-3-5	Anschrift:	Im Rothsiefen 7 D-53639 Königswinter Deutschland
III-3-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-3-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-4	Anmelder und/oder Erfinder	
III-4-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-4-2	Anmelder für	Nur US
III-4-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	KRAATZ, Udo
III-4-5	Anschrift:	Andreasstr. 22a D-51375 Leverkusen Deutschland
III-4-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-4-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-5	Anmelder und/oder Erfinder	
III-5-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-5-2	Anmelder für	Nur US
III-5-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	THIELKING, Gerhard
III-5-5	Anschrift:	Kastanienallee 13 D-51399 Burscheid Deutschland
III-5-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-5-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-6	Anmelder und/oder Erfinder	
III-6-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-6-2	Anmelder für	Nur US
III-6-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ERDELEN, Christoph
III-6-5	Anschrift:	Unterbüscherhof 15 D-42799 Leichlingen Deutschland
III-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-7	Anmelder und/oder Erfinder	
III-7-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-7-2	Anmelder für	Nur US
III-7-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	TURBERG, Andreas
III-7-5	Anschrift:	Sinterstr. 86 D-42781 Haan Deutschland
III-7-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-7-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-8	Anmelder und/oder Erfinder	
III-8-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-8-2	Anmelder für	Nur US
III-8-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	HANSEN, Olaf
III-8-5	Anschrift:	Tannenweg 43 D-40764 Langenfeld Deutschland
III-8-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-8-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
IV-1	Anwalt oder gemeinsamer Vertreter; oder besondere Zustellanschrift Die unten bezeichnete Person ist/wird hiermit bestellt, um den (die) Anmelder vor den internationalen Behörden zu vertreten, und zwar als:	gemeinsamer Vertreter
IV-1-1	Name	BAYER AKTIENGESELLSCHAFT
IV-1-2	Anschrift:	D-51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr.	0214 30 71166
IV-1-4	Telefaxnr.	0214 30 53482
V	Bestimmung von Staaten	
V-1	Regionales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AP: GH GM KE LS MW MZ SD SL SZ TZ UG ZW und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat des Harare-Protokolls und Vertragsstaat des PCT ist EA: AM AZ BY KG KZ MD RU TJ TM und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Eurasischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist EP: AT BE CH&LI CY DE DK ES FI FR GB GR IE IT LU MC NL PT SE TR und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist OA: BF BJ CF CG CI CM GA GN GW ML MR NE SN TD TG und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat der OAPI und Vertragsstaat des PCT ist

V-2	Nationales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AE AG AL AM AT AU AZ BA BB BG BR BY BZ CA CH&LI CN CR CU CZ DE DK DM DZ EE ES FI GB GD GE GH GM HR HU ID IL IN IS JP KE KG KP KR KZ LC LK LR LS LT LU LV MA MD MG MK MN MW MX MZ NO NZ PL PT RO RU SD SE SG SI SK SL TJ TM TR TT TZ UA UG US UZ VN YU ZA ZW	
V-3	Nationales Patent (Staaten, die dem PCT nach Veröffentlichung dieser PCT-EASY-Version beigetreten sind.)	und alle weiteren Staaten, die am Anmeldetag dem PCT angehören.	
V-5	Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen Zusätzlich zu den unter Punkten V-1, V-2 and V-3 vorgenommenen Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.9 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der nachstehend unter Punkt V-6 angegebenen Staaten. Der Anmelder erklärt, daß diese zusätzlichen Bestimmungen unter dem Vorbehalt einer Bestätigung stehen und jede zusätzliche Bestimmung, die vor Ablauf von 15 Monaten ab dem Prioritätsdatum nicht bestätigt wurde, nach Ablauf dieser Frist als vom Anmelder zurückgenommen gilt.		
V-6	Staaten, die von der Erklärung über vorsorgliche Bestimmungen ausgenommen werden	KEINE	
VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht		
VI-1-1	Anmeldedatum	22 September 2000 (22.09.2000)	
VI-1-2	Aktenzeichen	10047116.1	
VI-1-3	Staat	DE	
VII-1	Gewählte Internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)	
VIII	Kontrolliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigefügt
VIII-1	Antrag	5	-
VIII-2	Beschreibung	104	-
VIII-3	Ansprüche	27	-
VIII-4	Zusammenfassung	1	EZABST00.TXT
VIII-5	Zeichnung(en)	0	-
VIII-7	INSGESAMT	137	
	Beigefügte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigefügt	Elektronische Datei(en) beigefügt
VIII-8	Blatt für die Gebührenberechnung	✓	-
VIII-9	Gesonderte unterzeichnete Vollmacht	✓	-
VIII-12	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1	-
VIII-16	PCT-EASY-Diskette	-	Diskette
VIII-18	Nr. der Abb. der Zeichn., die mit der Zusammenf. veröffentlicht werden soll		
VIII-19	Sprache der Int. Anmeldung	Deutsch	

IX-1	Unterschrift des Anmelders oder Anwalts	i.V.
IX-1-1	Name	Dipl. Dr. Gunter Schumacher BAYER AKTIENGESELLSCHAFT i.V. Dr. Alexander Nowe

VOM ANMELDEAMT AUSZUFÜLLEN

10-1	Datum des tatsächlichen Eingangs dieser internationalen Anmeldung	
10-2	Zeichnung(en):	
10-2-1	Eingegangen	
10-2-2	Nicht eingegangen	
10-3	Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingeg. Unterlage(n) oder Zeichnung(en) zur Vervollständigung dieser Int. Anmeldung	
10-4	Datum des fristgerechten Eingangs der Berichtigung nach PCT Artikel 11(2)	
10-5	Internationale Recherchenbehörde	ISA/EP
10-6	Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchengebühr aufgeschoben	

VOM INTERNATIONALEN BÜRO AUSZUFÜLLEN

11-1	Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro	

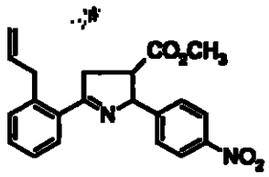
Δ^1-PIRROLINAS COMO PESTICIDAS

Campo de la invención

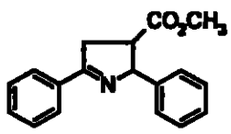
La presente invención se refiere a nuevas Δ^1-pirrolinas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo como agentes pesticidas.

Descripción de la técnica anterior

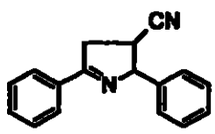
Hasta el presente se han dado a conocer solo algunas 2,5-bis-aril-Δ^1-pirrolinas substituidas:



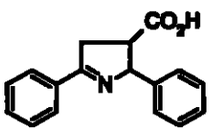
A. Padwa and A. Ku, J. Am. Chem. Soc. 1978, *100*, 2181



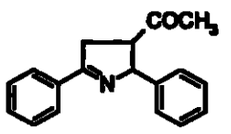
A. Padwa and J. Smolanoff, J. Am. Chem. Soc. 1971, *93*, 548



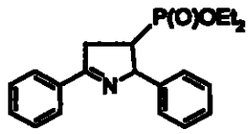
A. Padwa et al, J. Am. Chem. Soc. 1973, *95*, 1945



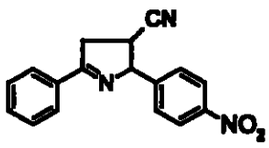
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1970, *103*, 2368



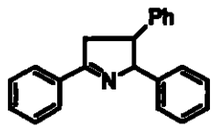
O. Tsuge *et al.*, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347



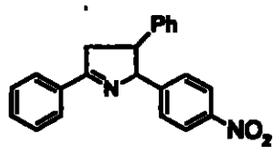
Gakis,N. *et al.*, Helv.Chim. Acta 1976, *59*, 746



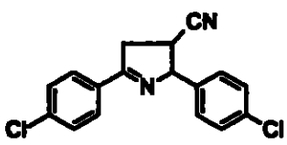
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1972, *105*, 1258



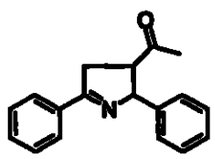
Padwa *et al.*, Tet. Lett. 1972, 4067



Huisgen *et al.*, Tet. Lett. 1966, 3603



A. R. Katritzky *et al.*, Synthesis 1981, *10*, 863



O. Tsuge, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347

No se conoce nada sobre su conveniencia para el empleo a modo de agentes pesticidas.

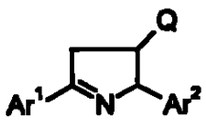
En las publicaciones WO 00/21958, WO 99/59968, WO 99/59967 y WO 98/22438 se han descrito otras Δ^1-pirrolinas y su conveniencia como agentes pesticidas.

Sin embargo el nivel de actividad y/o la duración de la actividad de estos compuestos conocidos con anterioridad, especialmente contra determinados organismos y/o con ocasión de bajas concentraciones de aplicación, no son completamente satisfactorios en todos los campos de aplicación.

Debido a la multiplicidad de requisitos exigidos a los agentes pesticidas modernos, por ejemplo en lo que se refiere al nivel de actividad, a la duración de la actividad, al espectro de actividad, al espectro de aplicación, a la toxicidad, a la combinación con otros productos activos, a la combinación con agentes auxiliares de la fórmulación o a la síntesis, y debido a la posible aparición de resistencias no puede considerarse, sin embargo, como concluido el desarrollo de tales productos, y existen permanentemente una elevada necesidad de nuevos compuestos, que tengan ventajas, al menos en lo que se refiere a aspectos parciales, frente a los compuestos conocidos.

Descripción detallada de la invención

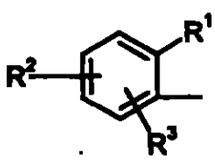
Se han encontrado ahora nuevas Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I)



(I)

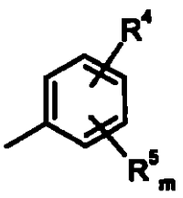
en la que

Ar^1 significa el resto



y

Ar^2 significa el resto



en los que

m significa 0, 1, 2, 3 o 4,

R^1 significa halógeno, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^4 significa halógeno o uno de los agrupamientos siguientes

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalquilsulfoniloxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2-NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, halógenoalquilaminosulfonilo, bisalcoxiborano, $-B(OH)_2$,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_o$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo, o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en

caso dado una o varias veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo, substituido en caso dado una o varias veces por restos de la lista W^2, con 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, con uno o varios heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo, halógenoalquenilo, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, halógenoalquileno, halógenoalquenileno,

E significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo, halógenoalquenileno, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

W^1 significa ciano, halógeno, ciano, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi, halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, pentaflúortio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi, halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno

y azufre,

Q significa además $-CO_2R^{13}$ o $-CONR^{14}R^{15}$,

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa hidrógeno, alquilo o halógenoalquilo,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, o conjuntamente significan alquileno,

R^9 significa hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, aralquilo, fenilo,

R^{10} significa alquilo, halógenoalquilo, aralquilo,

R^{11} significa alquilo, arilo,

R^{12} significa alquilo, halógenoalquilo, aralquilo o arilo,

R^{13} significa hidrógeno; significa alquilo substituido una o varias veces; significa aminocarbonilalquilo substituido en caso dado; significa alquenilo, fenilalquenilo; significa fenilalquilo o fenoxialquilo substituidos respectivamente en caso dado; significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo substituidos respectivamente en caso dado; significa heterociclilo o heterociclilalquilo, saturados o insaturados, con, respectivamente 1 hasta 4 heteroátomos combinados de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre; significa tetrahidronaftilo o indanilo,

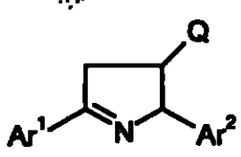
R^{14} y R^{15} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógenoalquilo, alcoxialquilo, significan fenilo o fenilalquilo substituidos respectivamente en caso dado; significan cicloalquilo o cicloalquilalquilo substituidos respectivamente en caso dado; significan heterociclilo o heterociclilalquilo substituidos respectivamente en caso dado, respectivamente saturados o insaturados con, respectivamente, 1 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

R^{14} y R^{15} significan, además, conjuntamente, alquilenoxialquileno o alquilentioalquileno.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden presentarse en caso dado, en función del tipo y del número de los substituyentes, a modo de isómeros geométricos y/o ópticos o bien a modo de regioisómeros o de sus mezclas isómeras en composición variable. Según la invención se reivindican tanto los isómeros puros como también las mezclas de los isómeros.

Se ha encontrado además que se obtienen los nuevos compuestos de la fórmula (I) según uno de los procedimientos descritos a continuación.

Pueden obtenerse las Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I)



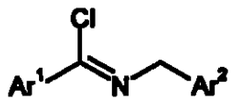
(I)

en la que

Ar^1, Ar^2, y Q tienen los significados anteriormente indicados,

porque

A-1.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-a)



(II-a)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



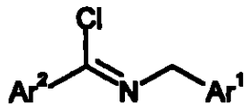
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados anteriormente indicados,

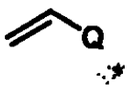
en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

A-2.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-b)



(II-b)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



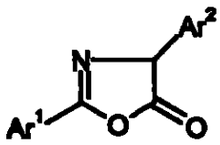
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2, y Q tienen los significados anteriormente indicados,

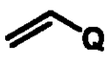
en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

B.) se hacen reaccionar oxazolinonas de la fórmula (IV)



(IV)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



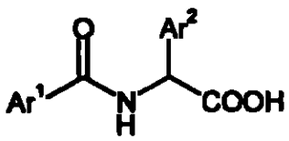
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un diluyente, o porque

C.) se hacen reaccionar ácidos carboxílicos de la fórmula (V)



(V)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



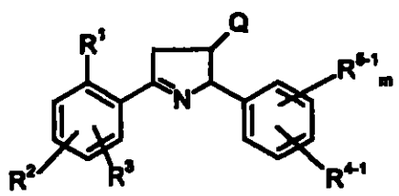
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados anteriormente indicados,

en presencia de anhidrido del ácido acético y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

D.) Pueden obtenerse las Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I-a)



(I-a)

en la que

R^1, R^2, R^3, Q y m tienen los significados anteriormente indicados,

R^{4-1} significas A o B-Z-D

donde

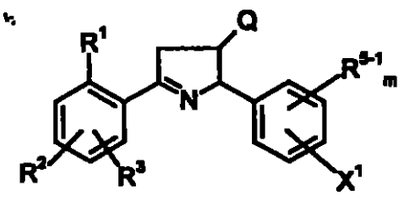
A, B, Z y D tienen los significados anteriormente indicados, y

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, haloalquilaminosulfonilo,

donde

R^6, R^7, R^8 y o tienen los significados anteriormente indicados,

porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (I-b)



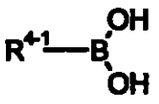
(I-b)

en la que

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q y m tienen los significados anteriormente indicados y

X^1 significa Cl, Br, I,-OSO_2CF_3

con ácidos borónicos de la fórmula (VI)



(VI)

en la que

R^{4-1} tiene el significado anteriormente indicado,

en presencia de un catalizador, y en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido y en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (I-b)

en la que

X^1 significa 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano),

con (hetero)ciclos de la fórmula (VII)

T—A (VII)

en la que A tiene el significado anteriormente indicado y

T significa Cl, Br, I, -OSO_2CF_3,

en presencia de un catalizador, y en caso dado en presencia de un agente aceptor de

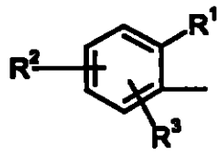
ácido y, en caso dado en presencia de un diluyente.

Finalmente se ha encontrado que los compuestos según la invención de la fórmula (I) tienen propiedades insecticidas muy buenas y que puede emplearse tanto en la protección de las plantas, como también en la protección de los materiales para la lucha contra las pestes indeseables, tales como insectos.

Los compuestos según la invención están definidos en general por medio de la fórmula (I). Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos indicados en las fórmulas anteriores, y que se indicarán a continuación se explican seguidamente.

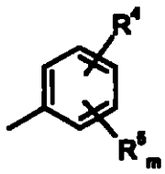
Preferentemente,

Ar^1 significa el resto



Preferentemente,

Ar^2 significa el resto



Preferentemente,

m significa 0, 1, 2 o 3.

Preferentemente,

R^1 significa halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$.

Preferentemente,

R^2 y R^3 significan, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$,$-NR^7R^8$.

Preferentemente,

R^4 significa flúor, cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes, que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E.

Preferentemente,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, tri(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)-sililo, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo, bis(alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono)borano, $-B(OH)_2$.

Preferentemente,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_o$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4

átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno.

Preferentemente,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en caso dado una a cuatro veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo con 5 a 10 miembros, que contiene uno o dos anillos aromáticos, substituido en caso dado de una a cuatro veces por restos de la lista W^2, con 1 a 4 heteroátomos, combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre (especialmente tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, tiazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo).

Preferentemente,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1.

Preferentemente,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$.

Preferentemente,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo.

Preferentemente,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6

átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquileno con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo.

Preferentemente,

W^1 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, pentaflúortio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

Preferentemente,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, -

$S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$,

$-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

Preferentemente,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4.

Preferentemente,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre.

Preferentemente,

Q significa $-CO_2R^{13}$ o $-CONR^{14}R^{15}$.

Preferentemente,

o significa 0, 1 o 2.

Preferentemente,

R^6 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

Preferentemente,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o conjuntamente significan alquileno.

Preferentemente,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo, fenilo.

Preferentemente,

R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6

átomos de carbono, bencilo.

Preferentemente,

R^{11} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, fenilo.

Preferentemente,

R^{12} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo o fenilo.

Preferentemente,

R^{13} significa hidrógeno; significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido de una a tres veces, de forma igual o de formas diferentes por ciano, por nitro, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por 2-pirrolidinona; significa aminocarbonil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, que puede estar substituido sobre el grupo amino, de forma igual o de formas diferentes, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por fenilo o por halógenofenilo; significa alquenilo con 2 a 8 átomos de carbono, fenil-alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono; significa fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono; significa heterociclilo o heterociclilo-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, con 5 o 6 miembros, saturado o insaturado, con, respectivamente, 1 hasta 4 heteroátomos combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre

(especialmente furilo, tienilo, piridinilo, furfurilo, tenilo o piridinilmetilo), pudiendo estar substituido el heterociclo respectivamente por halógeno; significa tetrahidronaftilo o indanilo.

Preferentemente,

R^{14} y R^{15} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; significan cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; significan heterociclilo o heterociclil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, con 5 o 6 miembros, saturados o insaturados, con, respectivamente, 1 hasta 4 heteroátomos combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre (especialmente furilo, tienilo, tetrahidrofurilo, furfurilo, tenilo, tetrahidrofurilmetilo, tiazolilo), pudiendo estar substituido el heterociclo respectivamente por halógeno o por alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

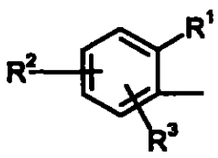
Preferentemente,

R^{14} y R^{15} significan, además, conjuntamente, alqueniloxi con 1 a 4 átomos de

carbono-alquileno con 1 a 4 átomos de carbono o alquilentio con 1 a 4 átomos de carbono-alquileno con 1 a 4 átomos de carbono.

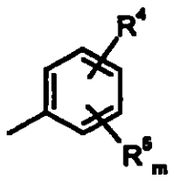
De forma especialmente preferente,

Ar^1 significa el resto



De forma especialmente preferente,

Ar^2 significa el resto



De forma especialmente preferente,

m significa 0, 1 o 2.

De forma especialmente preferente,

R^1 significa flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, o significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^4 significa cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes,

que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E.

De forma especialmente preferente,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, $-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano).

De forma especialmente preferente,

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno.

De forma especialmente preferente,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos respectivamente en caso dado de una hasta tres veces, por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo con 5 a 10 miembros, que contiene 1 o 2 anillos aromáticos, con 1 a 4 heteroátomos, combinados desde 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, desde 0 hasta 2 átomos de oxígeno y desde 0 hasta 2 átomos de azufre, substituidos, en caso dado, de una hasta tres veces, por restos de la lista W^2 (especialmente tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo,

oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo).

De forma especialmente preferente,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1.

De forma especialmente preferente,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$.

De forma especialmente preferente,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)aminosulfonilo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono; alquileno con 1 a 6 átomos de carbono o alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro; alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 6

átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

De forma especialmente preferente,

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, $-OSO_2CF_3$, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-(R^6)=N-O(R^6)$.

De forma especialmente preferente,

n significa 0, 1, 2 o 3.

De forma especialmente preferente,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre (especialmente dihidrodioxazina, oxazolina, tiazolina, imidazolina, tetrazol).

De forma especialmente preferente,

Q significa $-CO_2R^{13}$ o $-CONR^{14}R^{15}$.

De forma especialmente preferente,

o significa 0, 1 o 2.

De forma especialmente preferente,

R^6 significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o significa metilo o etilo substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, o conjuntamente significan alquileno con 4 a 5 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro, bencilo o fenilo.

De forma especialmente preferente,

R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^{11} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenilo.

De forma especialmente preferente,

R^{12} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^{13} significa hidrógeno; significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido una o dos veces, de forma igual o de formas diferentes, por ciano, por nitro, por metoxi, por metoxicarbonilo o por 2-pirrolidinona; significa aminocarbonil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que puede estar

substituido en el grupo amino, de forma igual o de formas diferentes, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por fenilo o por halógenofenilo; significa alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, fenil-alquenilo con 2 a 5 átomos de carbono; significa fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una a tres veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por metilo, por metoxi o por trifluórmetoxi; significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces por metilo; significa furilo, tienilo, piridinilo, furfurilo, tenilo o piridinilmetilo, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el heterociclo por cloro; significan tetrahidronaftilo o indanilo.

De forma especialmente preferente,

R^{14} significa hidrógeno.

De forma especialmente preferente,

R^{15} significa halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono; significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por metilo, por metoxi, por trifluórmetilo o por trifluórmetoxi; significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por metilo, por trifluórmetilo o por trifluórmetoxi; significa furilo, tienilo, tetrahidrofurilo, furfurilo, tenilo, tetrahidrofurilmetilo,

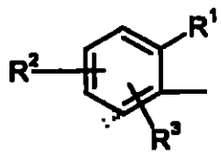
tiazolilo o tiazolilo substituido por alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

R^{14} y R^{15} significan además, conjuntamente, morfolino o tiomorfolino.

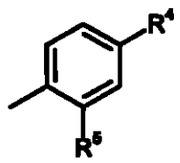
De forma muy especialmente preferente,

Ar^1 significa el resto



De forma muy especialmente preferente,

Ar^2 significa el resto



De forma muy especialmente preferente,

R^1 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R^4 significa cloro, bromo o significa uno de los agrupamientos siguientes

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E.

De forma muy especialmente preferente.

R^5 significa flúor, cloro, bromo, hidroxi, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, triflúormetilo, diflúormetoxi, triflúormetoxi, triflúormetiltio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$ o $-SO_2CF_3$.

De forma muy especialmente preferente.

R^5 significa además hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente.

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH-(E o Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

De forma muy especialmente preferente.

A significa fenilo substituido en caso dado una o dos veces, por restos de la lista W^1, o significa tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo substituidos respectivamente en caso dado una o dos veces por restos de la lista 2.

De forma muy especialmente preferente.

B significa p-fenileno monosubstituido en caso dado por restos de la lista W^1.

De forma muy especialmente preferente.

Z significa oxígeno, azufre o $-SO_2-$.

De forma muy especialmente preferente.

D significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, -

CH_2CF_2H, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

<u>De forma muy especialmente preferente,</u>

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E o Z), -C≡C-, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

<u>De forma muy especialmente preferente,</u>

E significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

<u>De forma muy especialmente preferente,</u>

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi, triflúormetoxi, diflúormetoxi, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$ $-SOCHF_2$ $-SOCF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

<u>De forma muy especialmente preferente,</u>

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc.-butilo, triflúormetilo, triflúormetoxi, diflúormetoxi, triflúormetiltio, $-OSO_2CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

<u>De forma muy especialmente preferente,</u>

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, $-CO_2$-triflúoretilo, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-propilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo), -CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo),-CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, $-PO(OMe)_2$, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo, $-PO(OEt)_2$, $-PO(OPh)_2$, dihidrodioxazinilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, tetrazolilo.

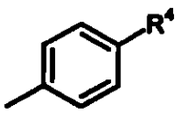
<u>De forma muy especialmente preferente,</u>

Q significa además $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2H$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, 2-metoxicarbonil-propiloxicarbonilo, 3-(2-oxo-1-pirrolidinil)-propiloxicarbonilo, N-4-flúorfenil-N-isopropil-amino-2-oxo-etiloxicarbonilo, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH$-Ph, 2-clorobenciloxicarbonilo, 3-clorobenciloxicarbonilo, 4-clorobenciloxicarbonilo, 1-feniletiloxicarbonilo, 3-fenilpropiloxicarbonilo, 2-fenoxietiloxicarbonilo, 4-metilciclohexiloxicarbonilo, ciclohexilmetiloxicarbonilo, 1-ciclohexiletiloxicarbonilo, 3-furfuriloxicarbonilo, 2-tieniloxicarbonilo, 3-tieniloxicarbonilo, 2-piridinilmetiloxicarbonilo, 3-piridinilmetiloxicarbonilo, 6-cloro-3-piridinilmetiloxicarbonilo, 1-tetrahidronaftiloxicarbonilo, 1-indaniloxicarbonilo, $-CON(H)CH_2CF_3$, metoxietilaminocarbonilo, 4-triflúormetoxifenil-aminocarbonilo, bencil-aminocarbonilo, 2-clorobencil-aminocarbonilo, 3-clorobencil-aminocarbonilo, 4-clorobencil-aminocarbonilo, 3-metilbencil-

aminocarbonilo, 4-metilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diclorobencil-aminocarbonilo, 2-metoxibencil-aminocarbonilo, 2,3-dimetoxibencil-aminocarbonilo, 3,5-dimetilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diflúorbencil-aminocarbonilo, 4-triflúormetilciclohexil-aminocarbonilo, ciclohexilmetil-aminocarbonilo, 2-tienil-aminocarbonilo, 2-tetrahidrofurilmetil-aminocarbonilo, 2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo o significa morfolinocarbonilo.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente

Ar^2 significa el resto



Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

R^1 significa flúor o cloro.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, cloro o flúor.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente

R^4 significa –B-Z-D.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

B significa p-fenileno.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

Z significa oxígeno o azufre.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

D significa $-CF_3$.

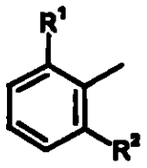
Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo,

$-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo) –CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo.

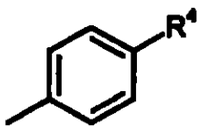
Señaladamente,

Ar^1 significa el resto



Señaladamente,

Ar^2 significa el resto



Señaladamente,

R^1 significa flúor o cloro.

Señaladamente,

R^2 significa hidrógeno, cloro o flúor.

Señaladamente,

R^4 significa -B-Z-D.

Señaladamente,

B significa p-fenileno.

Señaladamente,

Z significa oxígeno o azufre.

Señaladamente,

D significa $-CF_3$.

Señaladamente,

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo,$-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo) –CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo.

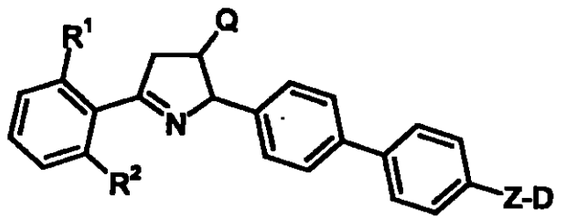
Señaladamente,

Q significa además $-CO_2H$, $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, 2-metoxicarbonil-propiloxicarbonilo, 3-(2-oxo-1-pirrolidinil)-propiloxicarbonilo, N-4-flúorfenil-N-isopropil-amino-2-oxo-etiloxicarbonilo, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH$-Ph, 2-clorobenciloxicarbonilo, 3-clorobenciloxicarbonilo, 4-clorobenciloxicarbonilo, 1-feniletiloxicarbonilo, 3-fenilpropiloxicarbonilo, 2-fenoxietiloxicarbonilo, 4-metilciclohexiloxicarbonilo, ciclohexilmetiloxicarbonilo, 1-ciclohexiletiloxicarbonilo, 3-furfuriloxicarbonilo, 2-tieniloxicarbonilo, 3-tieniloxicarbonilo, 2-piridinilmetiloxicarbonilo, 3-piridinilmetiloxicarbonilo, 6-cloro-3-piridinilmetiloxicarbonilo, 1-tetrahidronaftiloxicarbonilo, 1-indaniloxicarbonilo, $-CON(H)CH_2CF_3$, metoxietilaminocarbonilo, 4-triflúormetoxifenil-aminocarbonilo, bencil-aminocarbonilo, 2-clorobencil-aminocarbonilo, 3-

clorobencil-aminocarbonilo, 4-clorobencil-aminocarbonilo, 3-metilbencil-aminocarbonilo, 4-metilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diclorobencil-aminocarbonilo, 2-metoxibencil-aminocarbonilo, 2,3-dimetoxibencil-aminocarbonilo, 3,5-dimetilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diflúorbencil-aminocarbonilo, 4-triflúormetilciclohexil-aminocarbonilo, ciclohexilmetil-aminocarbonilo, 2-tienil-aminocarbonilo, 2-tetrahidrofurilmetil-aminocarbonilo, 2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo o significa morfolinocarbonilo.

Son especialmente preferentes también los compuestos de la fórmula general

(I-c)

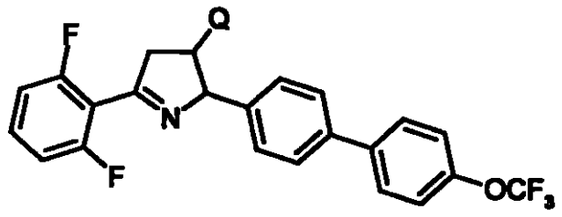


(I-c)

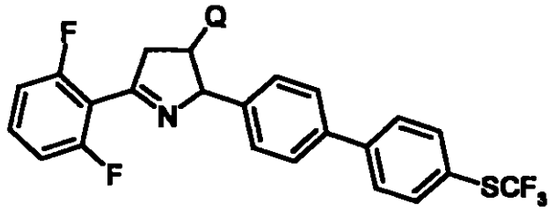
en la que

R^1, R^2, Z, D y Q tienen los significados anteriormente indicados.

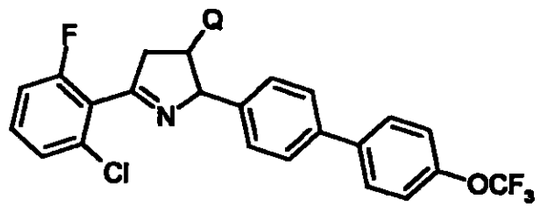
Son especialmente preferentes también los compuestos de las fórmulas generales (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) y (I-i)



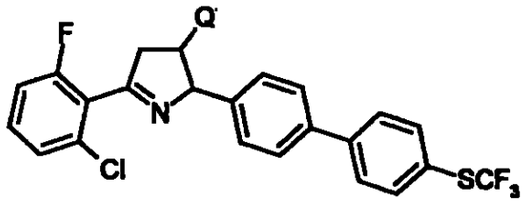
(I-d)



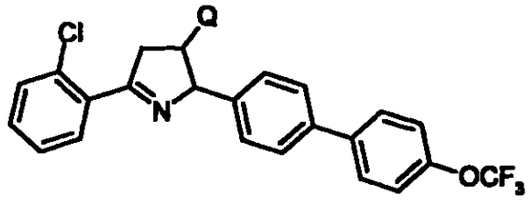
(I-e)



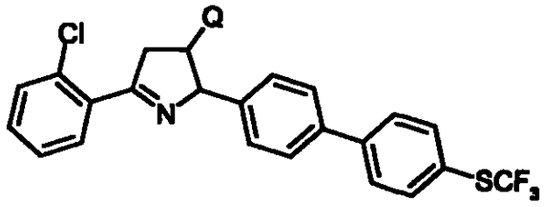
(I-f)



(I-g)



(I-h)



(I-i)

en las que

Q significa $-CO_2R^9$, $-CONHR^8$ o $-CONR^7R^8$,

teniendo R^7, R^8 y R^9 los significados anteriormente indicados.

Son especialmente preferentes también los compuestos de las fórmulas generales (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) y (I-i)

en las que

Q significa CO_2R^{13} o $-CONR^{14}R^{15}$,

donde R^{13}, R^{14} y R^{15} tienen los significados anteriormente indicados.

Son especialmente preferentes también los compuestos de las fórmulas

generales (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) y (I-i)

en las que

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentan-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, $-CONHCH_3$, $-CONHCH_2CH_3$, -CONH-(n-propilo), -CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo.

Son especialmente preferentes también los compuestos de las fórmulas generales (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) y (I-i)

en las cuales

Q significa $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, $-CO_2H$, 2-metoxicarbonil-propil-oxicarbonilo, 3-(2-oxo-1-pirrolidinil-propiloxicarbonilo, N-4-flúorfenil-N-isopropil-amino-2-oxo-etiloxicarbonilo, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH$-Ph, 2-clorobenciloxicarbonilo, 3-clorobenciloxicarbonilo, 4-clorobenciloxicarbonilo, 1-feniletiloxicarboni-lo, 3-fenil-propiloxicarbonilo, 2-fenoxietiloxicarbonilo, 4-metilciclohexil-oxicarbonilo, ciclohexilmetiloxicarbonilo, 1-ciclohexiletiloxicarbonilo, 3-furfuriloxicarbonilo, 2-teniloxicarbonilo, 3-teniloxicarbonilo, 2-piridinil-metiloxicarbonilo, 3-piridinilmetiloxicarbonilo, 6-cloro-3-piridinilmetiloxi-carbonilo, 1-tetrahidronaftiloxicarbonilo, 1-indaniloxicarbonilo, $-CON(H)CH_2CF_3$, metoxietilaminocarbonilo, 4-triflúormetoxifenil-amino-carbonilo, bencil-aminocarbonilo, 2-clorobencil-aminocarbonilo, 3-cloro-

bencil-aminocarbonilo, 4-clorobencil-aminocarbonilo, 3-metilbencil-aminocarbonilo, 4-metilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diclorobencilaminocarbonilo, 2-metiloxibencil-aminocarbonilo, 2,3-dimetoxibencil-aminocarbonilo, 3,5-dimetilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diflúorbencil-aminocarbonilo, 4-triflúormetilciclohexil-aminocarbonilo, ciclohexilmetil-aminocarbonilo, 2-tenil-aminocarbonilo, 2-tetrahidrofurilmetil-aminocarbonilo, 2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo, o significa morfolinocarbonilo.

Otro grupo preferente está constituido por los compuestos de la fórmula (I), en los cuales

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre, y

Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} y R^{11} tienen los significados generales anteriormente indicados.

Otro grupo preferente está constituido por los compuestos de la fórmula (I), en los cuales

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre, y

Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} y R^{11} tienen los significados preferentes anteriormente indicados.

Otro grupo preferente está constituido por los compuestos de la fórmula (I), en los cuales

Q significa $-CO_2R^9$, - COR^{10}, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con

5 hasta 7 miembros saturado o insaturado, con 2 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre, (especialmente dihidrodioxacina, oxazolina, tiazolina, imidazolina, tetrazol) y

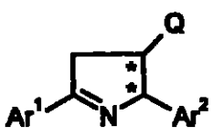
Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} y R^{11} tienen los significados especialmente preferentes anteriormente indicados.

Otro grupo preferente está constituido por los compuestos de la fórmula (I), en los cuales

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, -CO_2-n-propilo, -CO_2-isopropilo, -CO_2-n-butilo, -CO_2-isobutilo, -CO_2-sec.-butilo, -CO_2-terc.-butilo, -CO_2-n-pentilo, -CO_2-neopentilo, -CO_2-sec.-isoamilo, -CO_2-pentano-3-ilo, -CO_2-ciclopentilo, -CO_2-n-hexilo, -CO_2-ciclohexilo, -CO_2-triflúoretilo, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-propilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo), -CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, $-PO(OMe)_2$, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo, $-PO(OEt)_2$, $-PO(OPh)_2$, dihidrodioxazinilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, tetrazolilo y

Ar^1, Ar^2, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10} y R^{11} tienen los significados muy especialmente preferentes anteriormente indicados.

La fórmula general (I) tiene dos centros de asimetría, marcados en este caso por medio de *



(I)

Son preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los cuales los substituyentes Q y Ar^2 se encuentran en posición cis sobre los dos centros quirales.

En las definiciones anteriormente indicadas, oxilalquileno o bien tioalquileno significan –O-alquil- o bien –S-alquil-, verificándose el enlace por ejemplo sobre Ar^2 a través del átomo de oxígeno o bien del átomo de azufre y estando enlazados sobre el resto alquilo en caso dado otros substituyentes tales como, por ejemplo, A en –X-A. Alquilenoxi o bien alquilentio significan –alquilo-O- o bien –alquilo-S-, verificándose el enlace por ejemplo sobre Ar^2 respectivamente a través del resto alquilo y estando enlazados con el átomo de oxígeno o bien de azufre, en caso dado, otros substituyentes tal como, por ejemplo, A en –X-A. Oxialquilenoxi significa –O-alquilo-O.

En la presente descripción heterociclo significa un hidrocarburo cíclico saturado o insaturado, en el cual están intercambiados uno o varios átomos de carbono por uno o varios heteroátomos. En este caso los heteroátomos significan, preferentemente, O, S, N, P, especialmente significan O, S y N.

Son preferentes, especialmente preferentes o muy especialmente preferentes aquellos compuestos que portan los substituyentes citados de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente.

Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados, tales como alquilo o alquenilo, incluso en combinación con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, pueden ser respectivamente, en tanto en cuanto sea posible, de cadena lineal o de cadena ramificada.

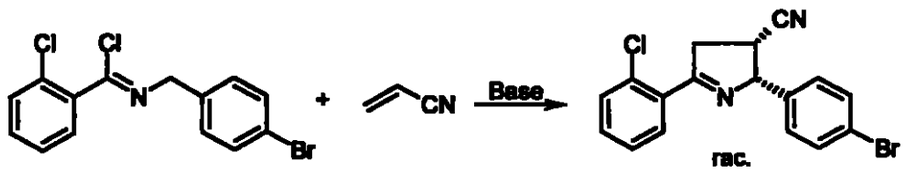
Los restos substituidos en caso dado pueden estar substituidos una o varias veces, pudiendo ser iguales o diferentes los substituyentes en el caso de una polisubstitución.

Varios restos con el mismo índice, tal como por ejemplo m restos R^5, con m>1, pueden ser iguales o diferentes.

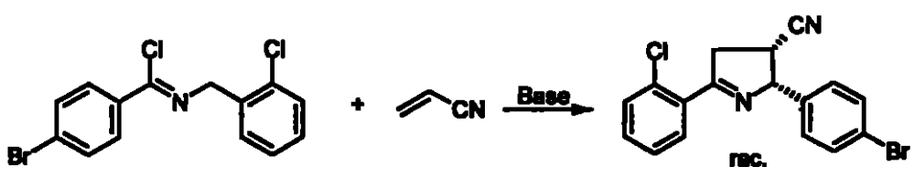
Los restos substituidos por halógeno, tal como por ejemplo halógenoalquilo, están mono o polihalogenados. En el caso de una polihalogenación, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. En este caso halógeno significa flúor, cloro, bromo y yodo, especialmente significa flúor, cloro y bromo.

Las definiciones de los restos o bien las explicaciones indicadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes, pueden combinarse sin embargo arbitrariamente entre sí, es decir entre los intervalos y los intervalos preferentes respectivos. Estas son válidas para los productos finales así como, de manera correspondiente, para los productos de partida y para los productos intermedios.

Si se emplean, el cloruro de N-(4-bromobencil)-2-clorofenil-carboximidoilo y el acrilonitrilo como productos de partida podrá representarse el desarrollo del procedimiento (A-1) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

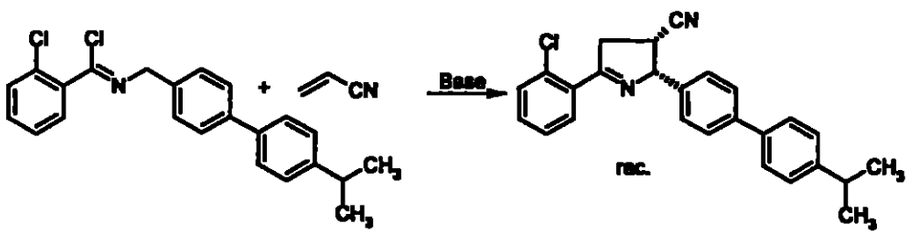


Si se emplean el cloruro de N-(2-clorobencil)-4-bromofenil-carboximidoilo y el acrilonitrilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (A-2) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

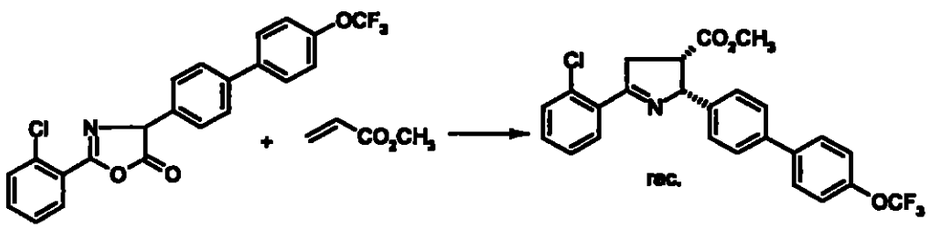


Si se emplean el cloruro de 2-cloro-N-[(4'-isopropil-1,1'-bifenil-4-

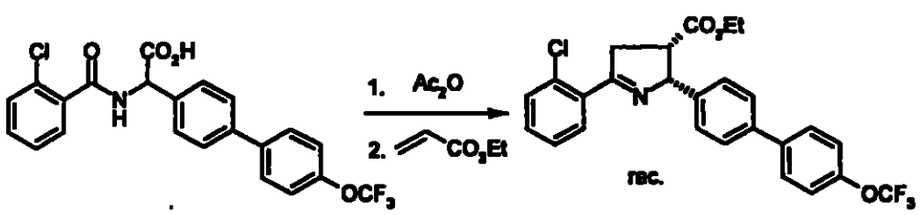
il)metil]benzocarboximidoilo y acrilonitrilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (A-1) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



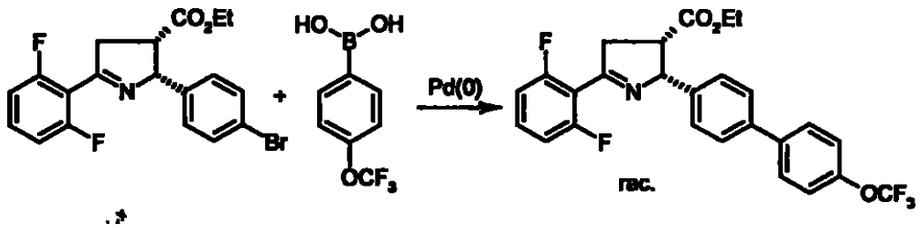
Si se emplean, la 2-(2'-clorobencil)-4-[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil]-oxazolidin-5-ona y el acrilato de metilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (B) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Si se emplean la N-(2-clorobenzoil)-2-[(4'-triflúormetoxi)bifenil]glicina y el anhidrido del ácido acético y el acrilato de etilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (C) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

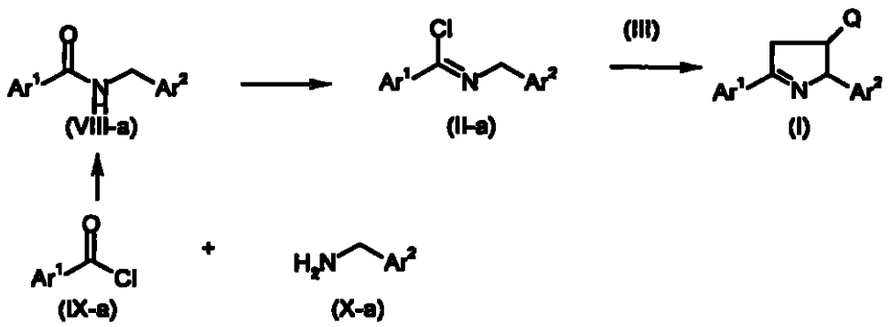


Si se emplean el 2-(4-bromofenil)-5-(2,6-diflúorfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrolo-3-carboxilato de etilo y el ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (D) por medio del esquema de fórmulas siguiente

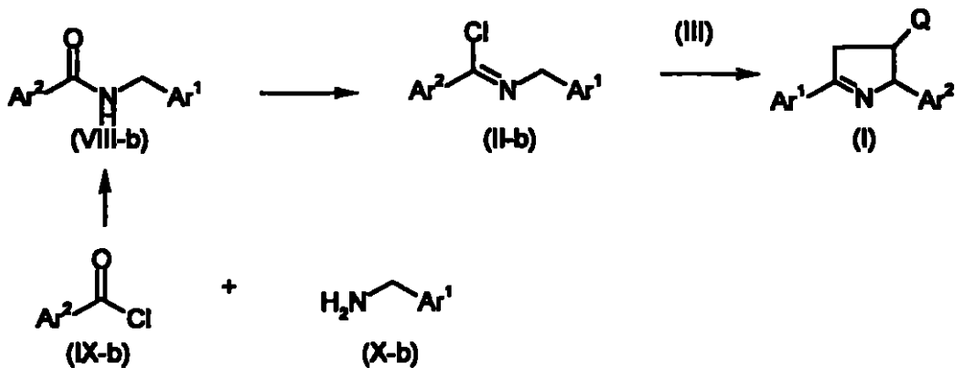


Explicaciones de los procedimientos y de los productos intermedios:

Procedimiento (A-1).



Procedimiento (A-2).



Los iminocloruros, necesarios como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la invención, están definidos en general

por medio de las fórmulas (II-a) y (IIb). En estas fórmulas Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc., aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc., en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los iminocloruros de las fórmulas (II-a) y (II-b), necesarios como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la invención, pueden prepararse por reacción de amidas de las fórmulas (VIII-a) y (VIII-b) con un reactivo de cloración (por ejemplo $SOCl_2$) en presencia de un diluyente. (Para otros métodos véase la publicación "The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond", en Patai, Interscience, New York, 12070, páginas 597-662).

Las amidas, necesarias como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la invención, están definidas en general por medio de las fórmulas (VIII-a) y (VIII-b). En estas fórmulas Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc. con relación a la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

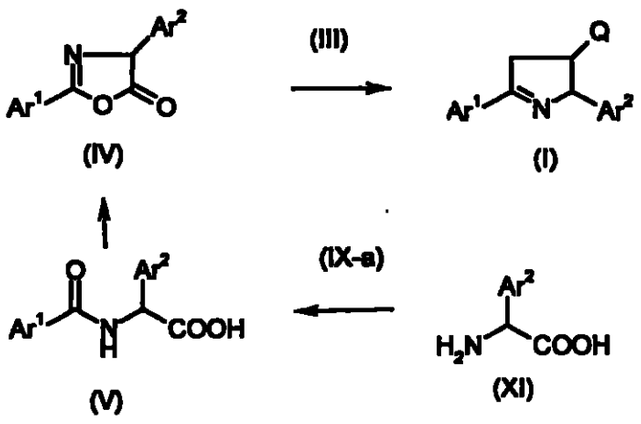
Las amidas de las fórmulas (VIII-a) y (VIII-b) pueden prepararse por ejemplo mediante reacción de cloruros de acilo de las fórmulas (IX-a) y (IX-b) con bencilaminas de las fórmulas (X-a) y (X-b) en presencia de una base (por ejemplo Et_3N o NaOH) y en presencia de un diluyente.

Los cloruros de acilo y las bencilaminas necesarios como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la invención, están definidas en general por medio de las fórmulas (IX-a) y (IX-b) o bien por medio de las fórmulas (X-a) y (X-b). En estas fórmulas Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy

especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, como especialmente preferentes, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los cloruros de acilo de las fórmulas (IX-a) y (IX-b) son conocidos en general. Las bencilaminas de las fórmulas (X-a) y (X-b) son parcialmente conocidas, pero pueden prepararse a partir de los nitrilos o bien de los aldehidos correspondientes según métodos conocidos (reducción o bien aminación reductora) (véase por ejemplo la publicación Vogel's Textbook Of Practical Organic Chemistry, Fifth Edition 1989, John Wiley and Sons, New York, autor: Vogel, Arthur, Israel; revisado por Furniss, Hannaford, Smith, and Tatchell, ISBN 0-582-46236-3).

Procedimiento (B).



Las oxazolidinonas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (B) según la invención, están definidas en general por medio de la formula (IV). En esta fórmula Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc., aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

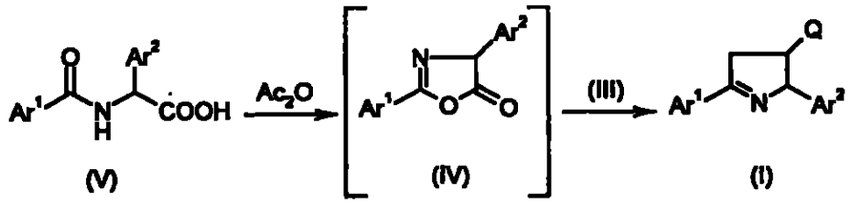
Las oxazolidinonas de la fórmula (IV), necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (B) según la invención pueden prepararse de

manea análoga a la de los ejemplos conocidos por la literatura, a partir de los N-benzoil-aminoácidos de la fórmula (V). Las oxazolidinonas de la fórmula (IV) se hacen reaccionar a continuación con dipolarofilos de la fórmula (III) (véanse por ejemplo la publicación Chem. Ber. 1970, 103, 2368-2387, y la literatura allí citada).

Los N-benzoil-aminoácidos, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (B) según la invención, están definidos en general por medio de la fórmula (V). En esta fórmula Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los compuestos de la fórmula (V) pueden obtenerse a partir de derivados de aminoácidos de la fórmula (XI) mediante reacción de cloruros de acilo de la fórmula (IX-a) en presencia de una base y de un diluyente. Los aminoácidos de la fórmula (XI) pueden obtenerse, en parte, en el comercio y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos. Véase por ejemplo la publicación Tetrahedron 1994, 50, 1539-1650 y la literatura allí citada).

Procedimiento (C)



(V) (IV) (I)

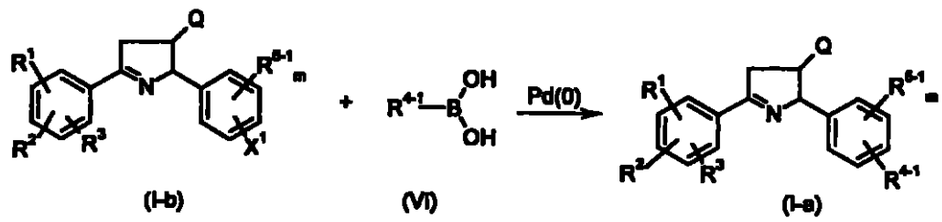
Los N-benzoil-aminoácidos de la fórmula (V) pueden hacerse reaccionar también según una reacción tandem para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. En este caso se preparan *in situ* las oxazolidinonas de la fórmula (IV) a partir de compuestos de la fórmula (V) y de anhidrido del ácido acético (véase por ejemplo la publicación Chem. Ber. 1970, 103, 2368-2387) y a continuación se hacen reaccionar según el procedimiento (B) con dipolarofilos de la

fórmula (III).

Los dipolarofilos, necesarios como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1), (A-2) y (C) según la invención, están definidos en general por medio de la fórmula (III). En esta fórmula Q tiene preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los compuestos de la fórmula (III) (Q = éster, nitrilo, cetona, amida, éster del ácido fosfórico, sulfona,) con conocidos en general o pueden obtenerse en el comercio.

Procedimiento (D).



(I-b) (VI) (I-a)

En el caso en que Ar^2 signifique en el producto activo de la fórmula (I) según la invención un bifenilo, en caso dado substituido, pueden prepararse compuestos de la fórmula (I-a) por copulación de los compuestos de la fórmula (I-b) con ácidos borónicos de la fórmula (VI) en presencia de un catalizador de paladio y en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

En los compuestos de las fórmulas (I-a) o bien (I-b) , R^1, R^2, R^3 y m tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. aquellos significados que ya han sido citados para estos restos de manera preferente, de manera especialmente preferente, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Preferentemente,

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)-sililo, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo.

De forma especialmente preferente,

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$.

De forma muy especialmente preferente,

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, metilo, etilo, metoxi, etoxi, triflúormetilo, diflúormetoxi, triflúormetoxi, $-OSO_2NMe_2$ o $-SO_2CF_3$.

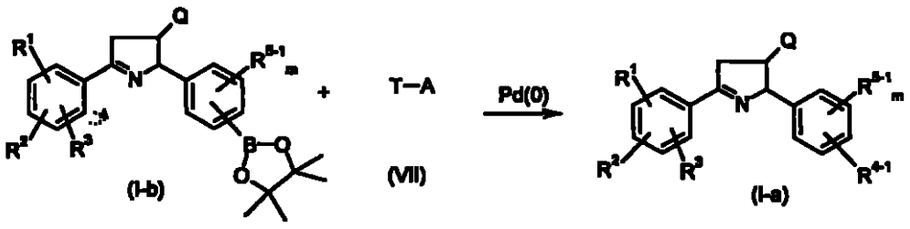
En los compuestos de la fórmula (I-b), X^1 significa preferentemente cloro, bromo o yodo, de forma especialmente preferente significa cloro o bromo, de forma muy especialmente preferente significa bromo.

En los compuestos de las fórmulas (I-a) y (VI), R^{4-1} significa A o –B-Z-D. En este caso A, B, Z y D tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc., aquellos significados que ya han sido citados para estos restos de manera preferente, de manera especialmente preferente, etc., en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los compuestos de la fórmula (I-b) se preparan por medio de los procedimientos A, B o C. Los ácidos borónicos de la fórmula (VI) son parcialmente conocidos, pero sin embargo pueden prepararse también a partir de (bromo)aromatos mediante clitiación o bien intercambio Br-Li (Mg) y a continuación

reacción con compuestos de trisalcoxiboro (véase por ejemplo la publicación Tetrahedron Lett. 1993, 34, 8237-8240).

Además pueden prepararse los compuestos de la fórmula (Ia) a partir de compuestos de las fórmula (I-b) [X^1 = 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,33,2-dioxoborolano] y (hetero)ciclos de la fórmula (VII) de manera análoga a la de los métodos conocidos por la literatura (J. Org. Chem. 1995, 60, 7508 Tetrahedron Lett. 1997, 38, 3841).



En los (hetero)ciclos de la fórmula (VII), T significa preferentemente cloro, bromo o yodo, de forma especialmente preferente significa cloro o bromo, de forma muy especialmente preferente significa cloro. A tiene preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. los significados que ya han sido indicados para este resto de manera preferente, de manera especialmente preferente etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Los compuestos de la fórmula (VII) son conocidos o pueden prepararse según procedimientos conocidos.

En la realización del procedimiento (D) según la invención se emplea, en general, un catalizador de paladio, que puede utilizarse, a su vez, con o sin adición de otros ligandos. Preferentemente se emplean a modo de catalizadores $PdCl_2$(dppf) [dppf = 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno], $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$, $PdCl_2(CH_3CN)_2$, $Pd_2(dba)_3$ [dba = dibencilidenacetona] o $Pd(OAc)_2$, de forma especialmente preferente $PdCl_2$(dppf) o $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$ o $Pd(OAc)_2$, de forma muy especialmente preferente $PdCl_2$(dppf) o $Pd(PPh_3)_4$. Como ligandos entran en consideración triarilfosfinas, trialquilfosfinas o arsinas. Preferentemente se emplean

dppf, PPh_3, $P(t\text{-}Bu)_3$, Pcy_3 o $AsPh_3$, de forma especialmente preferente dppf.

En la realización de los procedimientos según la invención (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) se obtienen compuestos de las fórmulas (I) o bien (I-a), en las cuales Q significa $-CO_2H$, mediante saponificación por ejemplo de los ésteres de metilo correspondientes según procedimientos conocidos (véase la publicación T.W. Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd edition, p. 232-234).

Como agentes aceptores de ácido entran en consideración, en la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D), según la invención, respectivamente todas las bases inorgánicas y orgánicas usuales para este tipo de reacciones. De manera preferente pueden emplearse hidróxidos de metales alcalinotérreos, o hidróxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de calcio, hidróxido de potasio así como también hidróxido de amonio, carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU). Sin embargo es posible trabajar también sin agente aceptor de ácido adicional, o emplear el aminocomponente en un exceso tal que actúe simultáneamente a modo de agente aceptor de ácido.

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos usuales inertes. Preferentemente pueden emplearse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina;

clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diiso-propiléter, metil-t-butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propioni-trilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfósforo-triamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido o sulfolano tal como sulfolano.

En la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) según la invención las temperaturas de la reacción pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 140°C, preferentemente entre 10°C y 120°C.

En la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) según la invención se trabaja, en general, respectivamente, bajo presión atmosférica. No obstante es posible también trabajar respectivamente bajo presión mas elevada o a presión mas reducida.

En la realización del procedimiento (A-1) o (A-2) según la invención se emplean, sobre 1 mol de iminocloruro de las fórmulas (II-a) o (II-b), en general, 2 moles de dipolarofilo de la fórmula (III) así como desde 1 hasta 3 moles de agente aceptor de ácido. No obstante es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se extrae, se lava, se seca y el residuo se libera de impurezas eventualmente presentes todavía en caso dado según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

En la realización del procedimiento (B) según la invención se emplean, sobre 1 mol de oxazolinona de la fórmula (IV), en general 2 moles de dipolarofilo de la fórmula (III). No obstante es posible también emplear los componentes de la

reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se extrae, se lava, se seca y el residuo se libera en caso dado de las impurezas eventualmente presentes todavía según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

En la realización del procedimiento (C) según la invención se emplean, sobre 1 mol de ácido carboxílico de la fórmula (V), en general 2 moles de dipolarofilo de la fórmula (III), así como de 1 a 3 moles de anhidrido del ácido acético. No obstante es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se extrae, se lava, se seca y el residuo se libera en caso dado de las impurezas eventualmente presentes todavía en caso dado según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

En la realización del procedimiento (D) según la invención se emplean, sobre 1 mol del compuesto de la fórmula (I), en general 1 mol de dipolarofilo de la fórmula (III) o también un exceso del mismo, así como de 1 hasta 5 moles de agente aceptor de ácido y 1/20 moles de catalizador. No obstante es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se distribuye entre agua y metil-terc.-butiléter, la fase orgánica se seca sobre sulfato de sodio y el residuo se libera en caso dado de las impurezas eventualmente presentes todavía según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

Los productos activos son adecuados para la lucha contra las pestes animales, preferentemente contra insectos, arácnidos y nematodos, que se presentan en agricultura, en la salud de los animales, en selvicultura, para la protección de productos almacenados y de materiales así como en el sector de la higiene. Son activos frente a

especies normalmente sensibles y resistentes así como contra todos o algunos de los estadios del desarrollo. A las pestes anteriormente citadas pertenecen:

Del orden de los isópodos por ejemplo, Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, Blaniulus guttulatus.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, Geophilus carpophagus, Scutigera spp..

Del orden de los sinfilos, por ejemplo, Scutigerella immaculata.

Del orden de los tisánuros, por ejemplo, Lepisma saccharina.

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, Onychiurus armatus.

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus spp., Schistocerca gregaria.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blatella germanica,

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, Forficula auricularia.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, Reticulitermes spp..

Del orden de los ftirapteros, por ejemplo Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp., Trichodectes spp., Damalinia spp..

Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci, Thrips palmi, Fankliniella accidentalis..

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp..

Del orden de los homópteros, por ejemplo, Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Aphis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix cincticeps,

Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodephax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp..

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella xylostella, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Mamestra brassicae, Panolis flammea, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana, Cnaphalocerus spp., Oulema oryzae.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus..

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp..

Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomya spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys

spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

Del orden de los sifonópteros, por ejemplo, Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

Del orden de los arácnidos, por ejemplo, Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophys ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hylamma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

A los nematodos parasitantes de las plantas pertenecen, por ejemplo, Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

Los compuestos según la invención, de la fórmula (I), se caracterizan, especialmente, por un excelente efecto contra orugas, larvas de escarabajos, arañuelas, piojos de las hojas y moscas minadoras.

Los productos según la invención, de la fórmula (I), se caracterizan, especialmente, de una manera muy especial, por un excelente efecto contra larvas del escarabajo de la hoja del rábano rusticano (Phaedon cochleariae), contra las orugas de la polilla noctuela (Spodoptera frugiperda), contra larvas de la cigarra verde del arroz (Nephotettix cinticeps), contra los piojos de la hoja del duraznero (Myzus persicae) y contra todos los estadios de la arañuela roja común (Tetranychus urticae).

Los compuestos según la invención pueden emplearse en caso dado, en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación, también como herbicidas y microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos y bactericidas.

Pueden emplearse en caso dado también como productos intermedios o como productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo de forma directa o por acción sobre el medio ambiente, el biotopo o el recinto de almacenamiento según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

Los productos activos según la invención pueden transformarse en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos inyectables, suspensiones, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como microencapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo mediante mezclado de los productos activos con extendedores, es decir, con disolventes líquidos, es decir disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

Cuando se emplea agua como extendedor, se pueden utilizar disolventes orgánicos, por ejemplo, como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración preferentemente: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalinas, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o las parafinas, por ejemplo las fracciones de petróleo, los alcoholes tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, o los disolventes fuertemente polares, tales como la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración:
por ejemplo sales de amonio y harinas minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatoméas y los minerales sintéticos molturados, tal como ácido silícico altamente dispersado, el óxido de aluminio y silicatos; como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo los minerales naturales quebrados y fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita, así como los granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y granulados de material orgánico, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco;
como emulsionantes y/o espumantes entran en consideración: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como los ésteres polioxietilenados de los ácidos grasos, los éteres polioxietilenados de los alcoholes grasos, por ejemplo, el

alquilarilpoliglicoléter, los alquilsulfonatos, los alquilsulfatos, los arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina;

como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, las lejías sulfíticas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulares o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálicos así como nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, en general, entre 0,1 y 95 % en peso, preferentemente entre 0,5 y 90 % de producto activo.

Los productos activos según la invención pueden presentarse en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezcla con otros productos activos, tales como insecticidas, cebos, esterilizantes, acaricidas, nematicidas, fungicidas, productos reguladores del crecimiento o herbicidas. A los insecticidas pertenecen por ejemplo ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, ésteres del ácido carbónico, hidrocarburos clorados, fenilureas, productos preparados por medio de microorganismos y similares.

Como componentes de mezcla entran en consideración, por ejemplo, los compuestos siguientes:

Fungicidas:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-potasio, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Bonodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutilo, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticdiin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, polisulfuro de calcio, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazin, Carboxin, Carvon, Chinomethionat(Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozycalon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etriadiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentihidroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusalfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminio, Fosetyl-sodio, Ftalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Fumametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumercyclos,

Guazatin,

Hexachlorobenceno, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealesilat, Iminoctadinetriacetato, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-metilo, preparaciones de cobre, tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, Oxina de cobre y mezcla de Boerdeaux,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanyipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfoxax,

Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

dimetilditiocarbamato de níquel, Nitrothal-isopropilo, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolilnicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazole, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-sodio, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozcen (PCNB),

Azufre y preparaciones de azufre,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Tthiophanate-metilo, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-metilo, Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutanil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram así como

Dagger G, OK-8705, OK-8801,

α-(1,1-dimetiletil)-β-(2-fenoxietil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

α-(2,4-diclorofenil)-β-flúor-b-propil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

α-(2,4-diclorofenil)-β-metoxi-a-metil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

α-(5-metil-1,3-dioxan-5-il)-β-[[4-(triflúormetil)-fenil]-metilen]-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

(5RS,6RS)-6-hidroxi-2,2,7,7-tetrametil-5-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-3-octanona,

(E)-α-(metoxiimino)-N-metil-2-fenoxi-fenilacetamida,

carbamidato de {2-metil-1-[[[1-(4-metilfenil)-etil]-amino]-carbonil]-propil}-1-isopropilo,

1-(2,4-diclorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-etanon-O-(fenilmetil)-oxima,

1-(2-metil-1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona,

1-(3,5-diclorofenil)-3-(2-propenil)-2,5-pirrolidindiona,

1-[(diyodometil)-sulfonil]-4-metil-benceno,

1-[[2-(2,4-diclorofenil)-1,3-dioxolan-2-il]-metil]-1H-imidazol,

1-[[2-(4-clorofenil)-3-feniloxiranil]-metil]-1H-1,2,4-triazol,

1-[1-[2-[(2,4-diclorofenil)-metoxi]-fenil]-etenil]-1H-imidazol,

1-metil-5-nonil-2-(fenilmetil)-3-pirrolidinol,

2',6'-dibromo-2-metil-4'-triflúormetoxi-4'-triflúor-metil-1,3-tiazol-5-carboxanilida,

2,2-dicloro-N-[1-(4-clorofenil)-etil]-1-etil-3-metil-ciclo-propanocarboxamida,

2,6-dicloro-5-(metiltio)-4-pirimidinil-tiocianato,

2,6-dicloro-N-(4-triflúormetilbencil)-benzamida,

2,6-dicloro-N-[[4-(triflúormetil)-fenil]-metil]-benzamida,

2-(2,3,3-triyodo-2-propenil)-2H-tetrazol,

2-[(1-metiletil)-sulfonil]-5-(triclorometil)-1,3,4-tiadiazol,

2-[[6-deoxi-4-O-(4-O-metil-β-D-glicopiranosil)-a-D-glucopi-ranosil]-amino]-4-metoxi-1H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-5-carbonitrilo,

2-aminobutano,

2-bromo-2-(bromometil)-pentandinitrilo,

2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida,

2-cloro-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(isotiocianatometil)-acetamida,

2-fenilfenol(OPP),

3,4-dicloro-1-[4-(diflúormetoxi)-fenil]-1H-pirrol-2,5-diona,

3,5-dicloro-N-[cian[(1-metil-2-propinil)-oxi]-metil]-benzamida,

3-(1,1-dimetilpropil)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitrilo,

3-[2-(4-clorofenil)-5-etoxi-3-isoxazolidinil]-piridina,

4-cloro-2-cian-N,N-dimetil-5-(4-metilfenil)-1H-imidazol-1-sulfonamida,

4-metil-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-ona,

8-(1,1-dimetiletil)-N-etil-N-propil-1,4-dioxaspiro[4,5]decan-2-metanamina,

8-hidroxiquinolinsulfato,

2-[(fenilamino)-carbonil]-hidrazida del ácido 9H-xanten-9-carboxílico,

bis-(1-metiletil)-3-metil-4-[(3-metilbenzoil)-oxi]-2,5-tio-fendicarboxilato,

cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol,

hidrocloruro de cis-4-[3-[4-(1,1-dimetilpropil)-fenil-2-metilpropil]-2,6-dimetil-morfolina,

etil-[(4-clorofenil)-azo]-cianoacetato,

bicarbonato de potasio,

Methantetrathiol-sal sódica,

metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imida-zol-5-carboxilato,

metil-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(5-isoxazolilcarbonil)-DL-alaninato,

metil-N-(cloroacetil)-N-(2,6-dimetilfenil)-DL-alaninato,

N-(2,3-dicloro-4-hidroxifenil)-1-metil-ciclohexancarboxamida,

N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-fura-nil)-acetamida,

N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-tienil)-acetamida,

N-(2-cloro-4-nitrofenil)-4-metil-3-nitro-bencenosulfonamida,

N-(4-ciclohexilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-pirimidinamina,

N-(4-hexilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-pirimidinamina,

N-(5-cloro-2-metilfenil)-2-metoxi-N-(2-oxo-3-oxazolidinil)-acetamida,

N-(6-metoxi)-3-piridinil)-ciclopropancarboxamida,

N-[2,2,2-tricloro-1-[(cloroacetil)-amino]-etil]-benzamida,

N-[3-cloro-4,5-bis-(2-propiniloxi)-fenil]-N'-metoxi-metan-imidamida,

N-formil-N-hidroxi-DL-alanina, sal sódica

O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforamidotioato,

O-metil-S-fenil-fenilpropilfosforamidotioato,

S-metil-1,2,3-benzotiadiazol-7-carbotioato,

spiro[2H]-1-benzopiran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-ona,

4-[(3,4-dimetoxifenil)-3-(4-fluorfenil)-acriloil]-morfolina.

Bactericidas:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin, Octhilinon, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas/Acaricidas/Nematicidas:

Abamectin, Acephat, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, bacillus thuringiensis, Baculovirus, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxin, Butylpiridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-metilo, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodio, Dofenapyn,

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopfthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Ethofenprox, Etoxazole, Etrimphos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxido, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim,

Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granulosevirus,

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

Imidacloprid, Indoxacarb, Isazophos, Isofenphos, Isoxathion, Ivemectin,

Poliedrovirus nucleares,

Lamda-cyhalothrin, Lufenuron,

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl, Methoxyfenizide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron,

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M,

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalon, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyrachlophos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxifen,

Quinalphos.

Ribavirin,

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Theta-cypermetrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hidrógeno oxalato, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin,

Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii,

YI 5302,

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos,

(1R-cis)-[5-(fenilmetil)-3-furanil]-metil-3-[(dihidro-2-oxo-3(2H)-furaniliden)-metil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato

(3-fenoxifenil)-metil-2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato

1-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]tetrahidro-3,5-dimetil-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imina

2-(2-cloro-6-fluorfenil)-4-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]-4,5-dihidro-oxazol

2-(acetiloxi)-3-dodecil-1,4-naftalindiona

2-cloro-N-[[[4-(1-feniletoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida

2-cloro-N-[[[4-(2,2-dicloro-1,1-difluoretoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida

3-metilfenil-propilcarbamato

4-[4-(4-etoxifenil)-4-metilpentil]-1-fluor-2-fenoxi-benceno

4-cloro-2-(1,1-dimetiletil)-5-[[2-(2,6-dimetil-4-fenoxifenoxi)etil]tio]-3(2H)-piridazinona

4-cloro-2-(2-cloro-2-metilpropil)-5-[(6-yodo-3-piridinil)metoxi]-3(2H)-piridazinona

4-cloro-5-[(6-cloro-3-piridinil)metoxi]-2-(3,4-diclorofenil)-3(2H)-piridazinona

Bacillus thuringiensis cepa EG-2348

[2-benzoil-1-(1,1-dimetil)-hidrazida del ácido benzoico

butanoato de 2,2-dimetil-3-(2,4-diclorofenil)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo

[3-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2-tiazolidiniliden]-cianamida

dihidro-2-(nitrometilen)-2H-1,3-tiazina-3(4H)-carboxaldehido

etil-[2-[[1,6-dihidro-6-oxo-1-(fenilmetil)-4-piridazinil]oxi]etil]-carbamato

N-(3,4,4-trifluor-1-oxo-3-butenil)-glicina

N-(4-clorofenil)-3-[4-(difluormetoxi)fenil]-4,5-dihidro-4-fenil-1H-pirazol-1-

carboxamida

N-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]-N'-metil-N"-nitroguanida

N-metil-N'-(1-metil -2-propenil)-1,2-hidrazindicarbotioamida

N-metil-N'-2-propenil-1,2-hidrazindicarbotioamida

O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforoamidotioato,

N-cianometil-4-trifluormetil-nicotinamida,

3,5-dicloro-1-(3,3-dicloro-2-propeniloxi)-4-[3-(5-trifluormetilpiridin-2-iloxi)-propoxi]-benceno.

También es posible una mezcla con otros productos activos conocidos, tales como herbicidas o con abonos y reguladores del crecimiento.

Los productos activos según la invención pueden presentarse además, cuando se utilizan como insecticidas, en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con sinérgicos. Los sinérgicos son los compuestos mediante los cuales se aumenta el efecto de los productos activos, sin que el sinérgico agregado tenga que ser activo en si mismo.

El contenido en producto activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el comercio puede variar dentro de amplios límites. La concentración de producto activo de las formas de aplicación puede encontrarse entre 0,0000001 hasta 95 % en peso de producto activo preferentemente entre 0,0001 y 1 % en peso.

La aplicación se lleva a cabo de una manera adaptada a las formas de aplicación.

En el empleo contra las pestes de la higiene y de los productos almacenados se caracterizan los productos activos por un efecto residual excelente sobre madera y arcilla así como por la buena estabilidad a los álcalis sobre soportes encalados.

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan plantas y variedades de plantas así como sus partes de origen silvestre o que se obtienen por

métodos de cultivo biológicos convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos. En otra forma preferente de realización se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas, que hayan sido obtenidas según métodos de ingeniería genética en caso dado en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. La expresión "partes" o bien "partes de plantas" o "componentes de plantas" ha sido anteriormente explicada

Según la invención se trataran de forma especialmente preferente plantas de las variedades de plantas usuales en el comercio o que se encuentra en utilización. Se entenderán por variedades vegetales aquellas plantas con determinadas propiedades ("características"), que hayan sido obtenidas tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagenesis o mediante técnicas de DNA recombinantes. Estas pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

Según los tipos de plantas o bien las variedades de las plantas, de su localización y de las condiciones de crecimiento (terreno, clima, periodo de vegetación, alimentación) pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobreaditivos ("sinérgicos"). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un reforzamiento del efecto de los, productos empleables según la invención, mejore crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas elevadas o bajas, mayor tolerancia contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados, que van mas allá del efecto esperable propiamente dicho.

A las plantas o bien variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) a ser tratadas según la invención, pertenecen todas las plantas, que han adquirido material genético mediante modificación por ingeniería genética, que

proporcionan a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("características"). Ejemplos de tales propiedades son, un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados. Otros ejemplos, especialmente señalables para tales propiedades son la mayor resistencia de las plantas frente a las pestes animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citaran las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza así como plantaciones de frutales (con los frutos manzana, pera, cítricos y uva), debiéndose señalar especialmente maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades ("características") se señalarán especialmente la mayor resistencia de las plantas frente a los insectos por medio de las toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan en las plantas por el material genético procedente de Bacillus Thuringiensis (por ejemplo por medio de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como por sus combinaciones), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") se señalarán además especialmente la mayor defensa de las plantas contra hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemin, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de manera correspondiente. Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotrricin (por ejemplo gen

"PAT"). Los genes que proporcionan las respectivas propiedades ("características") deseadas pueden estar presentes también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt" pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan bajo las marcas registradas YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes de los herbicidas pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja, que se comercializan bajo las marcas registradas Roundup Ready® (tolerancia contra Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra Phosphinothricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y STS® (tolerancia contra sulfonilureas por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (cultivadas convencionalmente con relación a la tolerancia a los herbicidas) pueden citarse también las variedades comercializadas para la denominación Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente estas manifestaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o bien que se comercialicen o se desarrollen en el futuro con estas propiedades genéticas ("características").

Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la invención con los compuestos de la fórmula general I o bien de las mezclas de los productos activos según la invención. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en el caso de los productos activos o bien de las mezclas, son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Debe señalarse de manera especial el tratamiento de las plantas con los compuestos o bien con las mezclas indicadas especialmente en el presente texto.

Los productos activos según la invención no solamente son activos contra las pestes de las plantas, de la higiene y de los productos almacenados, sino también en el

sector de la medicina veterinaria contra parásitos de los animales (ectoparásitos) tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros migratorios, moscas (chupadoras y picadoras), larvas parasitantes de moscas, piojos, liendres del cabello, liendres de las plumas y pulgas. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los anopluros, por ejemplo Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Del orden de los malofagidos y de los sub-ordenes amblicerinos así como isqunocerinos, por ejemplo Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

Del orden de los dípteros y de los sub-órdenes nematocerinos así como braquicerinos, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomya spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomya spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypodema spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Del orden de los sifonapteridos, por ejemplo Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Del orden de los heteropteridos, por ejemplo Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Del orden de los blataridos, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blatella germanica, Supella spp..

De las sub-clase de los ácaros (Acarida) y del orden de los meta- así como mesoestigmatos, por ejemplo Argas spp., Ornithodorus spp., Otabius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma

spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

Del orden de los actinedidos (Prostigmata) y acaridídos (Astigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psoresgates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

De manera ejemplificativa muestran una actividad excelente contra los estadios de desarrollo de garrapatas tal como, por ejemplo, Amblyomma hebraeum, contra moscas parasitantes tal como, por ejemplo, contra Lucilia cuprina.

Los productos activos según la invención, de la fórmula (I), son adecuados también para la lucha contra los artrópodos, que atacan a los animales útiles en agricultura tales como, por ejemplo, vacas, corderos, cabras, caballos, chanchos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, demás animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros de salón, peces de acuario así como a los denominados animales de ensayo, tales como, por ejemplo, hámster, conejillos de Indias, ratas y ratones. Mediante la lucha contra estos artrópodos se evitaran casos de fallecimiento y reducciones de la productividad (en leche, carne, lana, pieles, huevos, miel, etc), de manera que, mediante el empleo de los productos activos según la invención, es posible un mantenimiento de los animales mas económico y mas sencillo.

La aplicación de los productos activos según la invención se lleva a cabo en el sector de la veterinaria de forma conocida mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, tabletas, cápsulas, bebidas, grageas, granulados, pastas, bolis, por medio del procedimiento a través de la comida "feed-through", de supositorios, mediante administración parenteral, tal como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular,

subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantatos, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dermal en forma, por ejemplo de inmersión o de baño (Dippen), pulverizado (Spray), regado superficial (Pour-on y Spot-on), de lavado, de empolvado así como con ayuda de cuerpos moldeados que contengan el producto activo tales como collarines, marcas para las orejas, marcas para el rabo, bandas para las extremidades, cabestros, dispositivos de marcado, etc.

Cuando se emplean para ganado doméstico, aves, animales domésticos etc. pueden emplearse los productos activos según la invención como formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, agentes capaces de extenderse), que contengan los productos activos según la invención en cantidades de 1 a 80 % en peso, directamente o tras dilución de 100 hasta 10.000 veces o pueden emplearse a modo de baño químico.

Además se ha encontrado que los productos activos según la invención muestran un elevado efecto insecticida contra insectos, que destruyen los materiales industriales.

De manera ejemplificativa y preferente - sin embargo sin carácter limitativo - pueden citarse los insectos siguientes:

Escarabajos, tales como

Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpine, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis; Xyleborus spec., Tryptodendron spec., Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec., Dinoderus minutos.

Himenópteros, tales como

Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.

Termitas, tales como

Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes

flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus.

Tisanuros, tal como Lepisma saccarina.

Por materiales industriales se entenderán en el contexto presente materiales no-vivos, tales como, preferentemente, materiales sintéticos, pegamentos, colas, papel y cartón, cuero, madera y productos de elaboración de la madera y pinturas.

De una manera muy especial, los materiales a ser protegidos contra el ataque de los insectos están constituidos por madera y productos de elaboración de la madera.

Por madera y productos de elaboración de la madera, que pueden ser protegidos por medio de los agentes según la invención o de las mezclas que los contengan, deberá entenderse, por ejemplo:

madera para la construcción, vigas de madera, traviesas para ferrocarril, piezas para puentes, costillas para barcas, vehículos de madera, cajas, paletas, contenedores, postes telefónicos, revestimientos de madera, ventanas y puertas de madera, contrachapado de madera, placas de contrachapado, trabajos de carpintería o productos de madera, que encuentran aplicación, de una manera muy general, en el hogar o en la industria de la construcción.

Los productos activos según la invención pueden emplearse como tales, en forma de concentrados o de formulaciones usuales en general tales como polvos, granulados, soluciones, suspensiones, emulsiones o pastas.

Las citadas formulaciones puede prepararse en forma en si conocida, por ejemplo por mezclado de los productos activos según la invención con al menos un disolvente o bien diluyente, emulsionante, dispersantes y/o aglutinante o agente de fijación, repelente del agua, en caso dado secantes y estabilizantes contra los UV y, en caso dado, colorantes y pigmentos así como otros agentes auxiliares de elaboración.

Los agentes o concentrados insecticidas a ser empleados para la protección de la madera y de los materiales de madera, contienen el producto activo según la invención

en una concentración de 0,0001 hasta 95 % en peso, especialmente de 0,001 hasta 60 % en peso.

Las cantidades de los agentes o bien de los concentrados empleados dependen del tipo y del origen de los insectos y del medio. Las cantidades de aplicación óptimas pueden determinarse respectivamente por medio de series de ensayos previamente a la aplicación. En general sin embargo es suficiente con emplear de 0,0001 hasta 20 % en peso, preferentemente de 0,001 hasta 10 % en peso del producto activo, referido al material a ser protegido.

Como disolvente y/o diluyente sirve un disolvente o una mezcla de disolventes órgano-químicos y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos, oleaginosos o tipo oleaginoso, difícilmente volátiles y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos polares y/o agua y, en caso dado un emulsionante y/o humectante.

Como disolventes órgano-químicos se emplearán, preferentemente, disolventes oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente situado por encima de 45°C. A modo de tales disolventes difícilmente volátiles, insolubles en agua, oleaginosos o de tipo oleaginoso, se emplearán aceites minerales correspondientes o sus fracciones aromáticas o mezclas de disolventes que contengan aceites minerales, preferentemente bencina para ensayos, petróleo y/o alquilbenceno.

Ventajosamente se emplearán aceites minerales con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, bencina para ensayos con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, aceite para husillos con un intervalo de ebullición de 250 hasta 350°C, petróleo o bien hidrocarburos aromáticos con un intervalo de ebullición de 160 hasta 280°C, aceite de terpentina y similares.

En una forma de realización preferente se emplearán hidrocarburos alifáticos líquidos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 210°C o mezcla de elevado punto

de ebullición de hidrocarburos aromáticos y alifáticos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 220°C y/o aceite para husillos y/o monocloronaftalina, preferentemente α-monocloronaftalina.

Los disolventes orgánicos, difícilmente volátiles, oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y con un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, pueden substituirse parcialmente por disolventes órgano-químicos ligeros o de volatilidad media, con la condición de que la mezcla de disolventes presente un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, y que la mezcla insecticida-fungicida sea soluble o emulsionable en esta mezcla de disolventes.

Según una forma de realización preferente se substituirá una parte del disolvente o de la mezcla de disolventes órgano-químicos o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos alifáticos, polares. Preferentemente se emplearán disolventes órgano-químicos alifáticos que contengan grupos hidroxilo y/o éster y/o éter, tales como, por ejemplo, glicoléter, ésteres o similares.

Como aglutinantes órgano-químicos se emplearán en el ámbito de la presente invención las resinas sintéticas y/o los aceites secantes de fraguado, en sí conocidos, diluibles con agua y/o solubles o dispersables o bien emulsionables en los disolventes órgano-químicos empleados, especialmente aglutinantes constituidos por o que contengan resina acrílica, una resina vinílica, por ejemplo acetato de polivinilo, resina de poliéster, resina de policondensación o de poliadición, resina de poliuretano, resina alquídica o bien resina alquídica modificada, resina fenólica, resina hidrocarbonada tal como resina de indeno-cumarona, resina de silicona, aceites secantes vegetales y/o secantes y/o aglutinantes secantes físicos a base de una resina natural y/o sintética.

La resina sintética, empleada como aglutinante, puede emplearse en forma de una emulsión, dispersión o solución. Como aglutinantes pueden emplearse también

betún o substancias bituminosas hasta un 10 % en peso. De manera complementaria pueden emplearse colorantes, pigmentos agentes repelentes del agua, correctores del olor e inhibidores o agentes protectores contra la corrosión en si conocidos, y similares.

Es preferente emplear en el medio o en el concentrado, según la invención, como aglutinante órgano-químico al menos una resina alquídica o bien una resina alquídica modificada y/o un aceite vegetal secante. Preferentemente se emplearán según la invención resinas alquídicas con un contenido en aceite mayor que el 45 % en peso, preferentemente del 50 hasta el 68 % en peso.

El aglutinante citado puede substituirse parcial o totalmente por un agente(mezcla) de fijación o por una plastificante(mezcla). Estos aditivos deben evitar una volatilización de los productos activos así como una cristalización o bien una precipitación. Preferentemente substituyen a un 0,01 hasta un 30 % del aglutinante (referido al 100 % del aglutinante empleado).

Los plastificantes son de la clase química de los ésteres del ácido ftálico tales como ftalato de dibutilo, de dioctilo o de bencilbutilo, ésteres del ácido fosfórico, tal como el fosfato de tributilo, ésteres del ácido adípico, tal como el adipato de di-(2-etilhexilo), estearatos tales como estearato de butilo o estearato de amilo, oleatos tal como oleato de butilo, éteres de glicerina o glicoléteres de elevado peso molecular, ésteres de glicerina así como ésteres del ácido p-toluenosulfónico.

Los agentes de fijación están basados químicamente en polivinilal-quiléteres tal como el polivinilmetiléter o en cetonas tales como benzofenona, etilen-benzofenona.

Como disolvente o bien diluyente entra en consideración especialmente el agua, en caso dado en mezcla con uno o varios de los disolventes o bien diluyentes, emulsionante y dispersantes órgano-químicos anteriormente citados.

Se consigue una protección especialmente efectiva de la madera mediante los procedimientos de impregnación a escala industrial, por ejemplo procedimientos al vacío, al vacío doble o a presión.

Los agentes listos para su aplicación pueden contener en caso dado otros insecticidas y, en caso dado uno o varios fungicidas.

Como componentes adicionales de la mezcla entran en consideración preferentemente los insecticidas y fungicidas citados en la WO 94/29 268. Los compuestos citados en este documento constituyen, expresamente, parte integrante de la presente solicitud.

Como componentes de mezcla muy especialmente preferentes entran en consideración insecticidas, tales como Chlorpyriphos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron y Triflumuron, así como fungicidas tales como Epoxiconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolylfluanid, 3-yodo-2-propinil-butilcarbamato, N-octil-isotiazolin-3-ona y 4,5-di-cloro-N-octilisotiazolin-3-ona.

Al mismo tiempo pueden emplearse los productos activos según la invención para la protección contra la proliferación de organismos sobre objetos, especialmente sobre los cuerpos de buques, tamices, redes, construcciones, instalaciones portuarias e instalaciones de señalización, que entran en contacto con agua de mar o con agua salubre.

La proliferación de organismos debida a Oligochaeten sesiles, tales como tubicideos calcáreos así como debido a los bivalvos y especies del grupo de los lepadomorfos (bellotas de mar), tal como diversos tipos de Lepas y Scalpellum o debido a tipos del grupo de los balanomorfos (percebes), tales como especies de Balanus, o Pollicipes, aumentan la resistencia al rozamiento de los barcos y conduce, como consecuencia de un mayor consumo de energía y además debido a las frecuentes estancias en dique seco, a un claro aumento de los costes de explotación.

Además de la proliferación de organismos debida a las algas, por ejemplo

Ectocarpus sp. y Ceramium sp., tiene un significado especial en particular la proliferación de organismos debida a grupos sesiles de entomostráceos, que se agrupan bajo el nombre de Cirripedia (crustáceos cirrípedos).

Se ha encontrado ahora, sorprendentemente, que los productos activos según la invención presentan un efecto antiincrustante (antiproliferación de organismos) excelente

Mediante el empleo de los productos activos según la invención puede desistirse al empleo de metales pesados tales como por ejemplo en los sulfuros de bis(trialquilestaño), laurato de tri-*n*-butilestaño, cloruro de tri-*n*-butilestaño, óxido cuproso (I), cloruro de trietilestaño, tri-*n*-butil-(2-fenil-4-clorofenoxi)-estaño, óxido de tributilestaño, disulfuro de molibdeno, óxido de antimonio, butil-titanato polímero, cloruro de fenil-(bispiridin)-bismuto, fluoruro de tri-*n*-butilestaño, etilenbistiocarbamato de manganeso, dimetilditiocarbamato de cinc, etilenbistiocarbamato de cinc, sal de cinc del 2-piridintiol-1-óxido, etilen-bistiocarbamato de bisdimetilditiocarbamoilcinc, etilen-bisditiocarbamato cuproso (I), tiocianato de cobre, naftenato de cobre y halogenuros de tributilestaño o puede reducirse decisivamente la concentración de estos compuestos.

Las pinturas antiincrustantes listas para su aplicación contienen, en caso dado, además, otros productos activos, preferentemente alguicidas, fungicidas, herbicidas, molusquicidas o bien con otros productos activos antiincrustantes.

Como componentes de la combinación para los agentes antiincrustantes según la invención son adecuados, preferentemente:

Alguicidas tales como

2-tec.-butilamino-4-ciclopropilamino-6-metiltio-1,3,5-triazina, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine y Terbutryn;

Fungicidas tales como

S,S-dióxido de la ciclohexilamida del ácido benzo[b]-tiofencarboxílico, Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-yodo-2-propinil-butilcarbamato, Tolylfluanid y azoles tales como

Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propioconazole y Tebuconazole;

Molusquicidas tales como

Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb y Trimethacarb;

o agentes antiincrustantes tradicionales tales como

4,5-dicloro-2-octil-4-isotiazolin-3-ona, diyodometilparatrilsulfona, 2-(N,N-dimetiltiocarbamoiltio)-5-nitrotiazilo, sales de potasio, de cobre, de sodio y de cinc del 2-piridintiol-1-óxido, piridin-trifenilborano, tetrabutildiestannoxano, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, 2,4,5,6-tetraclorisoftalonitrilo, disulfuro de tetrametiltiouram y 2,4,6-triclorofenil-maleinimida.

Los agentes antiincrustantes empleados contienen los productos activos según la invención en una concentración de 0,001 hasta 50 % en peso, especialmente de 0,01 hasta 20 % en peso.

Los agentes antiincrustantes según la invención contienen además usualmente los componentes frecuentes, pero sin limitarse a los mismos, tales como por ejemplo los que se han descrito en Ungerer, Chem. Ind. **1985**, 37, 730-732 y Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, **1973**.

Las pinturas antiincrustantes contienen, además de los productos activos alguicidas, fungicidas, molusquicidas e insecticidas según la invención, especialmente aglutinantes.

Ejemplos de aglutinantes reconocidos son cloruro de polivinilo en un sistema disolvente, caucho clorado en un sistema disolvente, resinas acrílicas en un sistema disolvente especialmente en un sistema acuoso, sistemas de copolímeros de cloruro de vinilo/acetato de vinilo en forma de dispersiones acuosas o en forma de sistemas

en disolventes orgánicos, cauchos de butadieno/estireno/acrilonitrilo, aceites desecantes tales como aceite de linaza, ésteres resínicos o ésteres resínicos modificados en combinación con alquitranes o betunes, asfalto así como epoxicompuestos, pequeñas cantidades de clorocaucho, polipropileno clorado y resinas vinílicas.

En caso dado las pinturas contienen también pigmentos inorgánicos, pigmentos orgánicos o colorantes, que preferentemente sean insolubles en el agua marina. Además las pinturas pueden contener materiales tales como colofonio para posibilitar una liberación controlada de los productos activos. Las pinturas pueden contener además plastificantes, agentes modificantes que influyan sobre las propiedades reológicas así como otros componentes tradicionales. También en sistemas antiincrustantes de auto-pulido puede incorporarse los compuestos según la invención o las mezclas anteriormente citadas.

Los productos activos según la invención son adecuados para combatir las pestes animales, especialmente los insectos, arácnidos y ácaros, que se presentan en los recintos cerrados, tales como, por ejemplo, viviendas, instalaciones fabriles, oficinas, cabinas de vehículos automóviles y similares. Estas pueden emplearse para combatir estas pestes en productos insecticidas para el hogar. Estas son activas contra tipos sensibles y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo. A estas pestes pertenecen:

Del orden de los escorpionideos, por ejemplo, Buthus occitanus.

Del orden de los ácaros, por ejemplo, Argas persicus, Argas reflexus, Bryobia ssp., Dermanysus gallinae, Glyciphagus domesticus, Ornithodorus moubat, Rhipicephalus sanguineus, Trombicula alfreddugesi, Neutrombicula autumnalis, Dermatophagoides pteronissimus, Dermatophagoides forinae.

Del orden de los araneos, por ejemplo Avicullariidae, Araneidae.

Del orden de los opiliones, por ejemplo Pseudoscorpiones chelifer,

Pseudoscorpiuones cheiridium, Opiliones phalangium.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Del orden de los diplopodos, por ejemplo, Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp..

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, Geophilus spp..

Del orden de los cigentomos, por ejemplo, Ctenolepisma spp., Lepisma sacharina, Lepismodes inquilinus.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo Blatta orientalies, Blatella germanica, Blatella asahinai, Leucophaea maderae, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta australasiae, Periplaneta americana, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Supella longipalpa.

Del orden de los saltatorios, por ejemplo, Acheta domesticus.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, Forficula auricularia.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, Kalotermes spp., Reticulitermes spp.

Del orden de los psocoptéros, por ejemplo, Lepinatus spp., Liposcelis spp.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, Anthrenus spp., Attagenus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae, Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles spp., Calliphora erythrocephala, Chysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Drosophila spp., Fannia canicularis, Musca domestica, Phlebotomus spp, Sarcophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Achoria grisella, Galleria mollonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.

Del orden de los anopluros, por ejemplo Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Phthirus pubis.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodinus prolixus, Triatoma infestans.

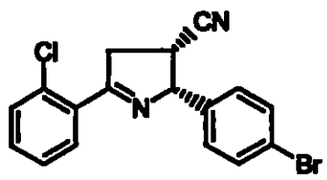
La aplicación en el sector de los insecticidas domésticos se lleva a cabo sola o en combinación con otros productos activos adecuados tales como ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento o productos activos de otras clases de insecticidas conocidos,

La aplicación se lleva a cabo en aerosoles, agentes para pulverización sin presión, por ejemplo esprays por bombeo y por pulverizado, dispositivos automáticos de nebulizado, nebulizadores, generadores de espuma, geles, productos para evaporadores con plaquetas para los evaporadores de celulosa o de material sintético, evaporadores de líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados mediante ventilador, sistemas evaporadores sin consumo de energía o bien pasivos, papeles contra las polillas, bolsitas contra las polillas y geles contra las polillas, en forma de granulados o de polvo, en cebos esparcibles o en estaciones para cebos.

La obtención y el empleo de los productos según la invención se desprenden de los ejemplos siguientes.

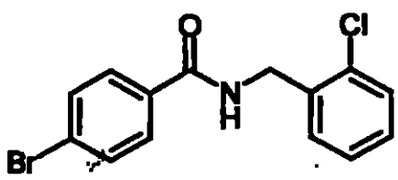
Ejemplos de obtención.

Ejemplo 1.



rac.

Síntesis Primera etapa:

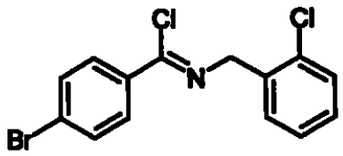


(VIII-b-1)

Se añade, gota a gota, a una mezcla constituida por 100,5 g (0,50 moles) de ácido 4-bromobenzoico, 12 ml de dimetilformamida y 1.200 ml de diclorometano, bajo agitación, a una solución de 63,5 g (0,50 moles) de cloruro de oxalilo en 50 ml de diclorometano. Al cabo de 4 horas de agitación y una vez concluido el desprendimiento gaseoso (HCl, CO, CO_2) se refrigera bajo argon a –60°C y se añade, gota a gota, en el transcurso de 10 minutos, una mezcla constituida por 70,8 g (0,50 moles) de 2-clorobencilamina y 161,0 g (1,25 moles) de N,N-diisopropil-etilamina. Tras agitación durante la noche se lava la solución amarilla, formada de este modo, sucesivamente, tres veces con 250 ml cada vez de ácido clorhídrico 2N, una vez con 300 ml de agua y una vez con 30 ml de solución saturada de cloruro de sodio. Tras secado de la fase orgánica sobre sulfato de sodio y concentración por evaporación total se obtiene un residuo que se agita con 200 ml de diclorometano a temperatura ambiente y a continuación se separa mediante filtración por succión. El residuo, obtenido de este modo, se recoge en 200 ml de metil-terc.-butiléter, se calienta brevemente a ebullición, se deja refrigerar y nuevamente se separa mediante filtración por succión.

Se obtienen 108 g (83 % de la teoría) de la 4-bromo-N-(2-clorobencil)-benzamida con un punto de fusión de 133°C.

Síntesis segunda etapa:



(II-b-1)

Se calienta a reflujo durante 2 horas una mezcla constituida por 106, (0,34 moles) del compuesto (VIII-b-1) y 200 ml de cloruro de tionilo. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente, se elimina el cloruro de tionilo en exceso bajo presión reducida. El aceite amarillo obtenido de este modo, se cristaliza tras un corto reposo a temperatura ambiente.

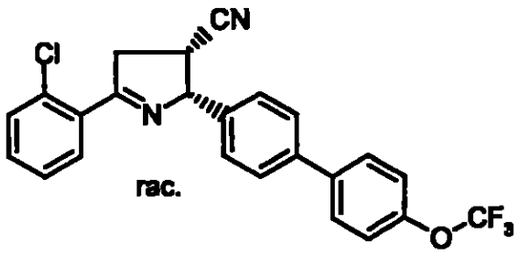
Se obtienen 112,5 g (97 % de l teoría) del cloruro de 4-bromo-N-(2-clorobencil)fenilcarboximidoilo con un punto de fusión de 58 hasta 61°C.

Síntesis tercera etapa:

Se deja reposar durante 7 días con exclusión de la luz y el aire, a temperatura ambiente, una mezcla constituida por 55,9 g (63 mmoles) del compuesto (II-b-1), 17,3 g (327 mmoles) de acrilonitrilo y 33,0 g (327 mmoles) de trietilamina en 300 ml de diclorometano. A continuación se lava con tres veces 100 ml de ácido clorhídrico 2N, una vez con 100 ml de agua y una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida y el residuo se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con clorometano/ciclohexano.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-bromofenil)-5-(2-clorofenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 110°C.

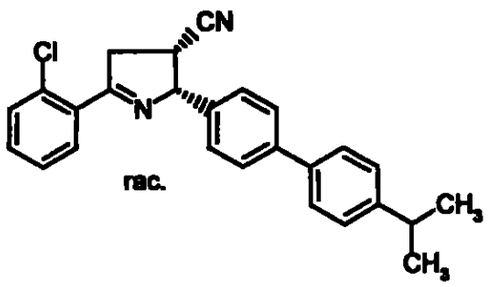
Ejemplo 2.



Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituidapor 0,997 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-1), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución de carbonato de sodio al 20 %. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y en 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cristalización en diclorometano/metil-terc.-butiléter proporciona un producto sólido blanco.

Se obtienen 320 mg (26 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-clorofenil)-2-[4'-triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 132°C.

Ejemplo 3.

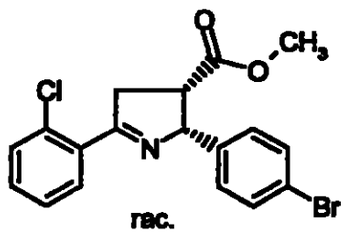


Se calienta durante 40 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 0,803 g (2,23 mmoles) del compuesto (I-b-1), 0,732 g (4,46 mmoles) del ácido 4-

isopropil-fenil-borónico, 0,130 g (0,12 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 15 ml de 1,2-dimetoxietano y 3,7 ml de solución de carbonato de sodio al 20 %. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cromatografía del residuo, obtenido de este modo, sobre gel de sílice con ciclohexano/acetato de etilo como Eluyentes, proporcionan el producto deseado.

Se obtienen 230 mg (26 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-clorofenil)-2-[4'-(isopropil)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 127-128°C.

Ejemplo 4.



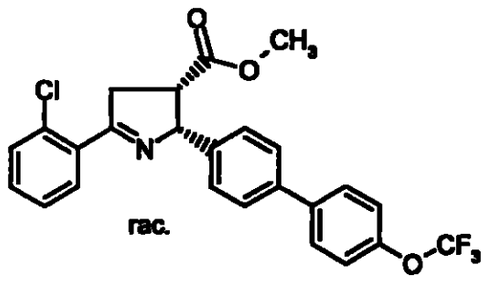
rac.

Se deja reposar durante 7 días, con exclusión de la luz y del aire, a temperatura ambiente, una mezcla constituida por 55,9 g (163 mmoles) del compuesto (II-b-1), 28,1 g (327 mmoles) de acrilato de metilo y 33,0 g (327 mmoles) de trietilamina en 300 ml de diclorometano. A continuación se lava tres veces con 100 ml cada vez de ácido clorhídrico 2N, una vez con 100 ml de agua y una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida y el residuo se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con diclorometano/ci-clohexano.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S)-2-(4-bromofenil)-5-(2-clorofenil)-3,4-

dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo con un punto de fusión de 134°C.

Ejemplo 5.

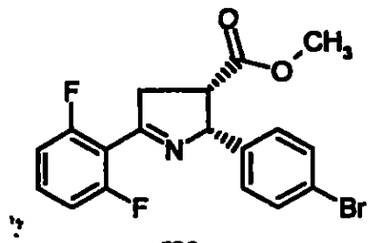


Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 1,09 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-2), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución de carbonato de sodio al 20 %. Tras refrigeración a temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Se secan las fases orgánicas reunidas sobre sulfato de sodio y se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida. El residuo se cromatografía sobre gel de sílicie con ciclohexano/acetato de etilo a modo de Eluyentes.

Se obtienen 620 mg (47 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S))-5-(2-clorofenil)-2—[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo en forma de aceite amarillento.

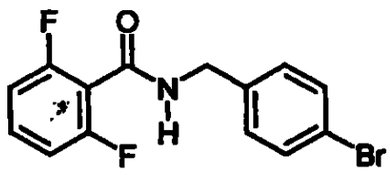
logP (pH 2,3)= 5,05.

Ejemplo 6.



rac.

Síntesis primera etapa:

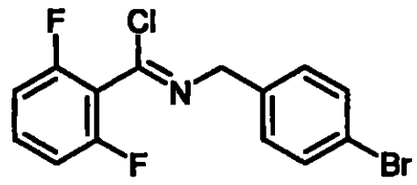


(VIII-a-1)

Se añade, gota a gota, a una solución de 73,3 g (4,64 mmoles) del ácido 2,6-diflúorbenzoico en 1.000 ml de diclorometano y 2 ml de dimetilformamida, una solución de 64,8 g (510 mmoles) de cloruro de oxalilo en 20 ml de diclorometano, a 20°C (1 hora, la temperatura interna cae hasta 15°C sin corriente de argon). Tras el final del fuerte desprendimiento gaseoso (CO_2, CO, HCl) se calienta a 35°C y se continua agitando durante 5 minutos. A continuación se añaden 103,2 g (464 mmoles) de hidrocloruro de 4-bromobencilamina y se añaden, gota a gota, una solución de 140,5 g (1391 mmoles) de trietilamina en 100 ml de diclorometano a 0°C a la solución del cloruro de acilo. Una vez concluida la reacción se añaden 200 ml de diclorometano. A continuación se sacuden dos veces con 500 ml cada vez de HCl 2N, dos veces con 250 ml cada vez de NaOH 2N, a continuación se lava hasta neutralidad y se extrae una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras el secado sobre sulfato de sodio se filtra y el filtrado se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida. El compuesto deseado se separa por cristalización en diclorometano/n-hexano.

Se obtienen 125,7 g (83 % de la teoría) de la N-(4-bromobencil)-2,6-diflúorbenzamida con un punto de fusión de 142°C.

Síntesis segunda etapa:



(II-a-1)

Se calientan 25 g (76,7 mmoles) del compuesto (VIII-a-1) en 60 ml de cloruro de tionilo durante 2 horas a reflujo. A continuación se concentra completamente por evaporación a presión reducida.

El residuo, obtenido de este modo, se emplea, sin purificación adicional, para las reacciones subsiguientes.

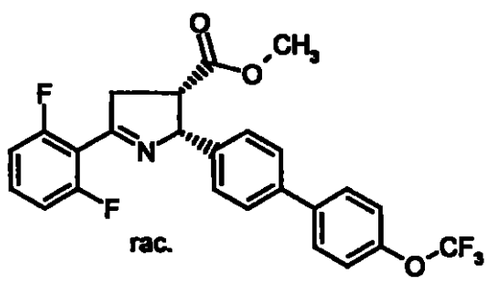
Síntesis tercera etapa:

Se deja reposar durante 14 días, con exclusión de la luz y del aire, una mezcla de 25,4 g (73,7 mmoles) del compuesto (II-a-1), 25,3 g de acrilato de metilo (294 mmoles) y 29,8 g (295 mmoles) de trietilamina.

Para la elaboración se recoge en 500 ml de diclorometano y se extrae la fase orgánica tres veces con 500 ml, cada vez, de ácido clorhídrico 2N. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra por evaporación bajo presión reducida y el residuo, obtenido de este modo, se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con diclorometano/metanol a modo de eluyente.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-bromofenil)-5-(2,6-diflúorfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo con un punto de fusión de 133°C.

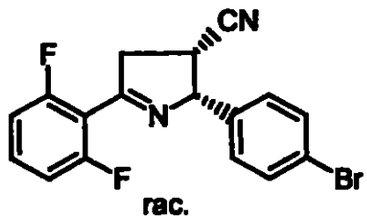
Ejemplo 7.



Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 1,10 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-3), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución de carbonato de sodio al 20 %. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cristalización en diclorometano/metil-terc.-butiléter proporciona un producto sólido blanco.

Se obtienen 480 mg (39 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-diflúorfenil)-2-[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo con un punto de fusión de 125°C.

Ejemplo 8.

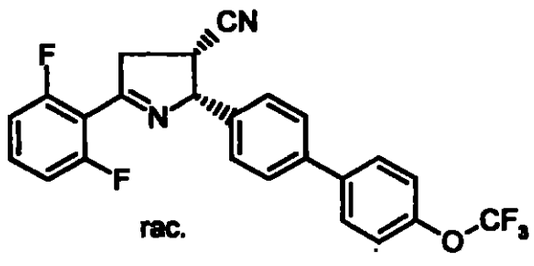


Se deja reposar durante 7 días, con exclusión de la luz y del aire, a temperatura ambiente, una mezcla constituida por 25,4 g (76,6 mmoles) del compuesto (II-a-1), 16,2 g (303 mmoles) de acrilonitrilo y 30,7 g (303 mmoles) de

trietilamina en 300 ml de diclorometano. A continuación se lava tres veces con 100 ml, cada vez, de ácido clorhídrico 2N, una vez con 100 ml de agua y una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida y el residuo se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con diclorometano/ciclohexano como eluyentes.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-bromofenil)-5-(2,6-diflúorfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 159°C.

Ejemplo 9.

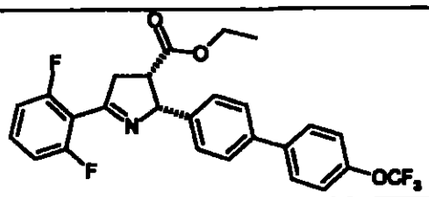
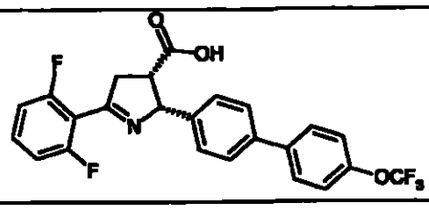
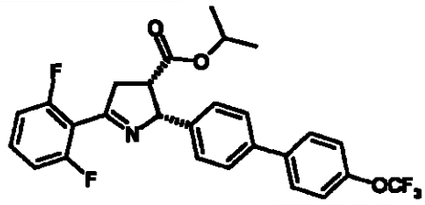


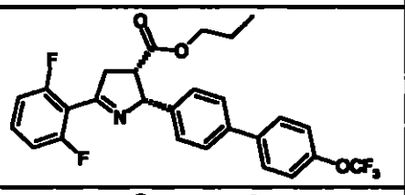
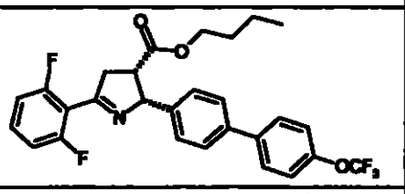
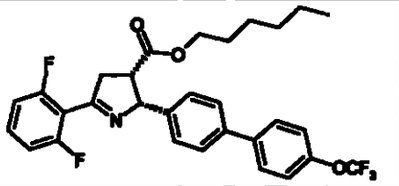
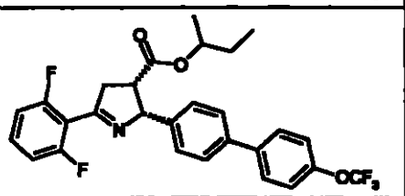
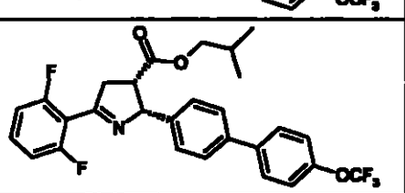
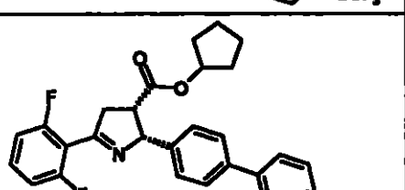
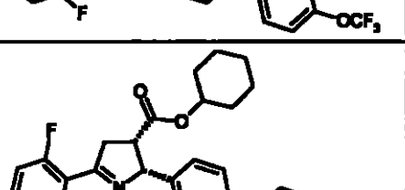
Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 1,00 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-4), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución al 20 % de carbonato de sodio. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Se secan las fases orgánicas reunidas sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cristalización en diclorometano/metil-terc.-butiléter, proporciona un producto sólido amarillo claro.

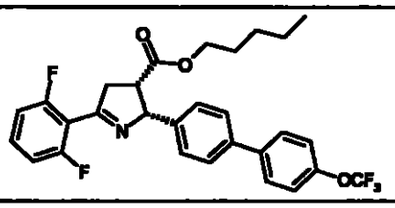
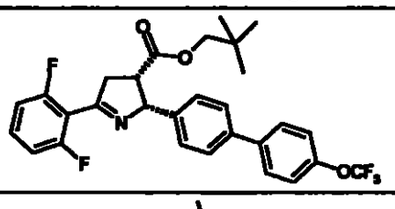
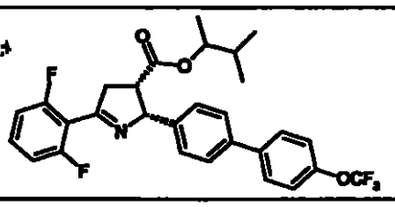
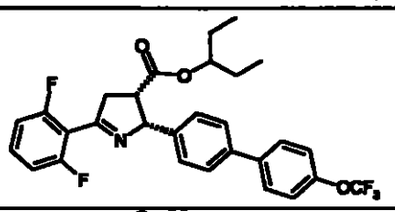
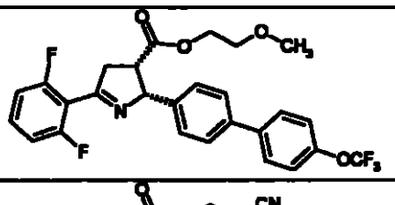
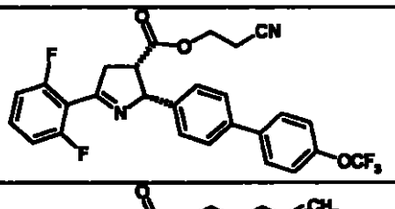
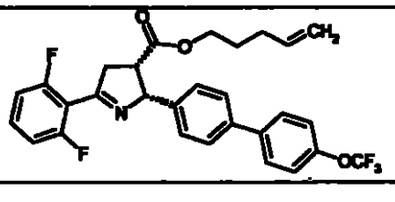
Se obtienen 520 mg (42 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-diflúorfenil)-2-[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbo-

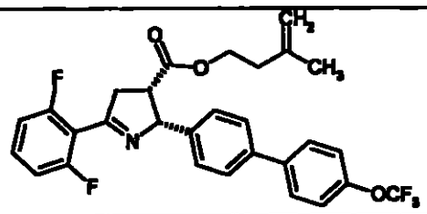
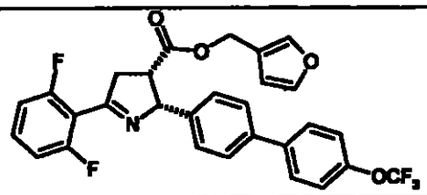
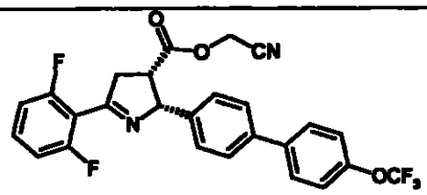
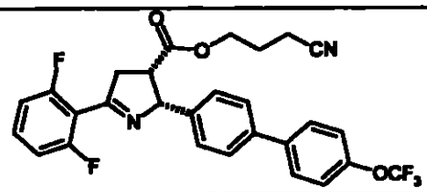
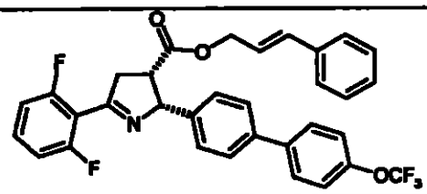
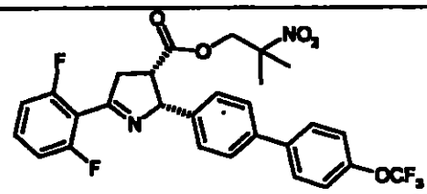
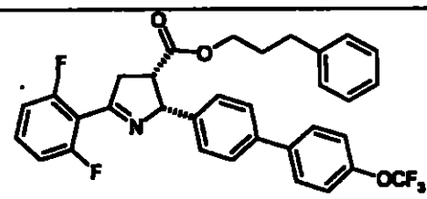
nitrilo con un punto de fusión de :145°C.

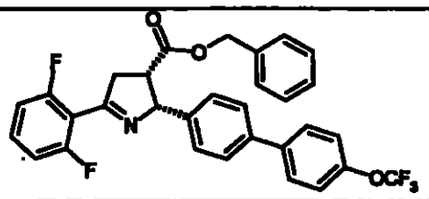
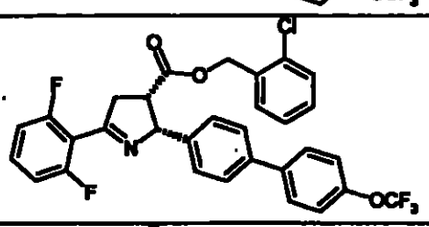
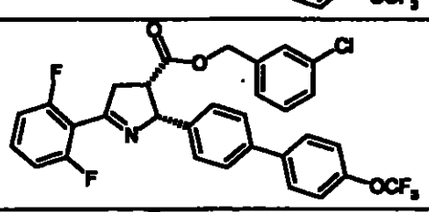
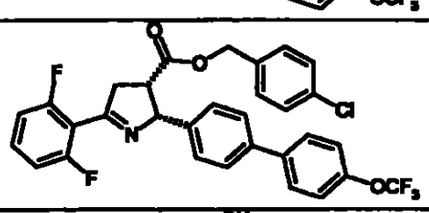
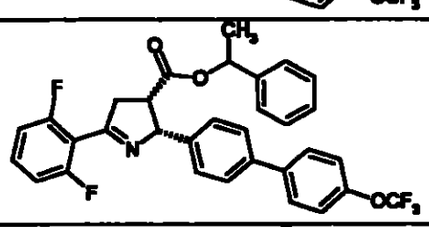
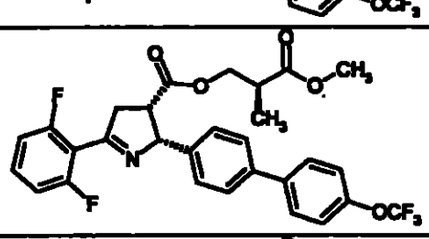
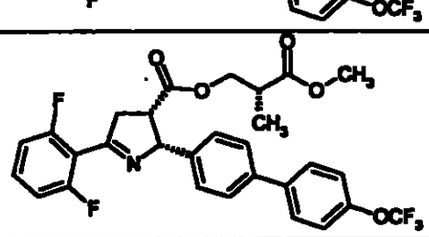
Los compuestos indicados en las tablas siguientes pueden prepararse según uno de los procedimientos según la invención anteriormente descritos.

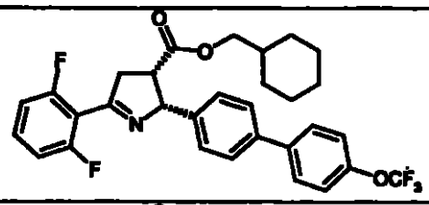
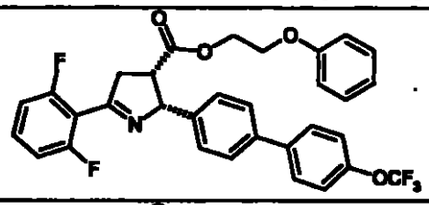
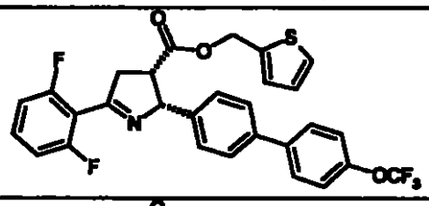
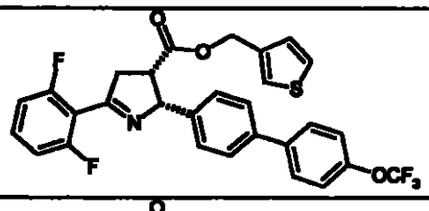
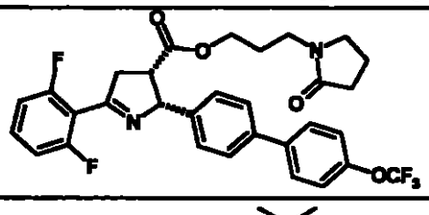
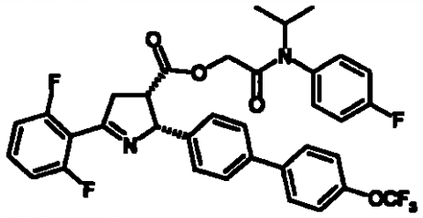
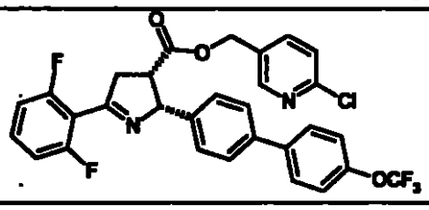
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
10		4.73[a)]	
11		3.35[a)]	
12		5,05[a)]	

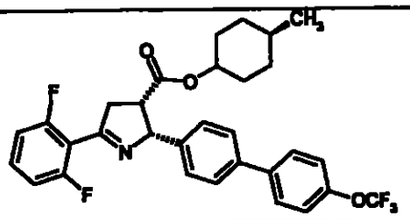
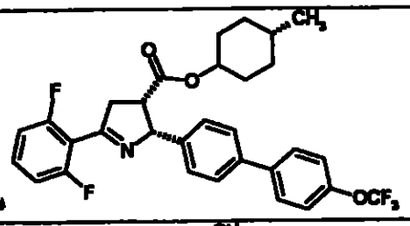
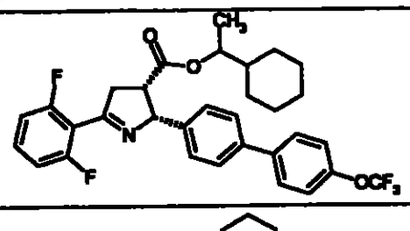
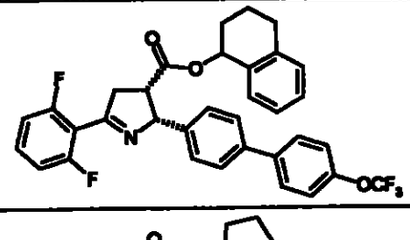
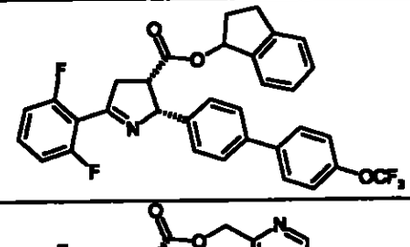
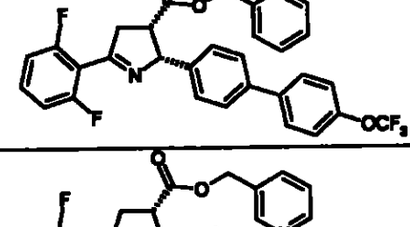
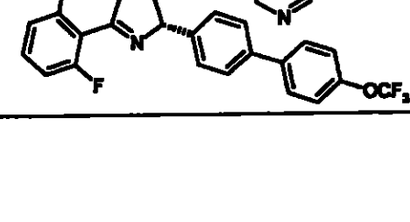
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
13			
14		5,41[a)] 5,49[b)]	
15		6,11[a)] 6,18[b)]	
16		5,40[a)] 5,48[b)]	
17		5,38[a)] 5,47[b)]	
18		5,47[a)] 5,54[b)]	
19		5,85[a)] 5,91[b)]	

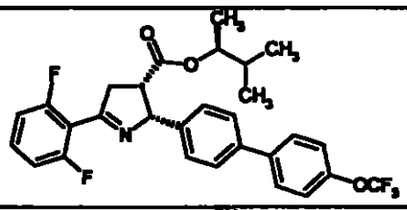
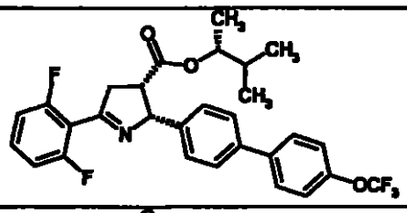
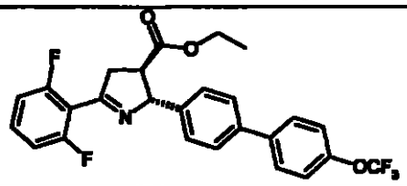
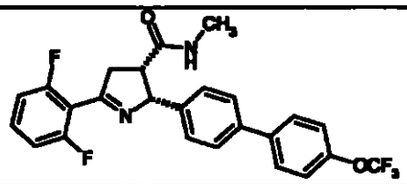
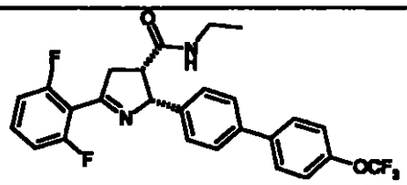
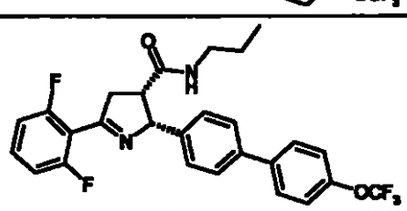
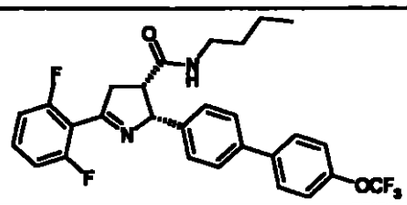
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
20		5,84[a)]	
21		5,78[a)]	
22		5,71[a)]	
23		5,78[a)]	
24		4,37[a)]	
25		4,08[a)]	
26		5,48[a)]	

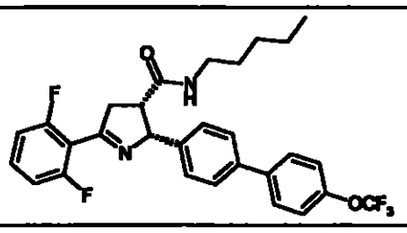
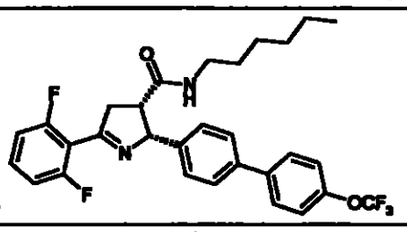
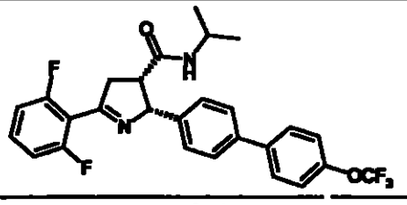
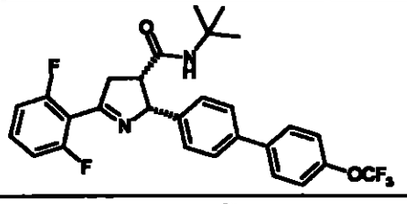
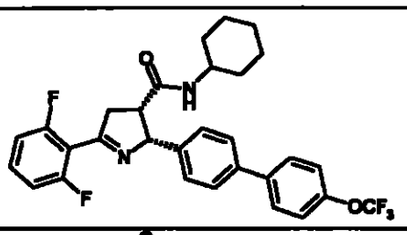
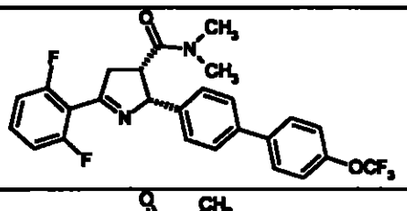
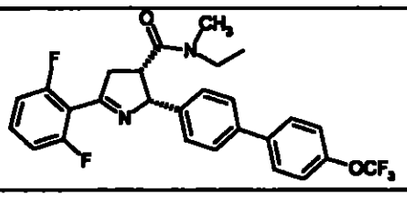
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
27		5,48[a)]	
28		4,87[a)]	
29		4,23[a)]	
30		4,18[a)]	
31		5,55[a)]	
32		4,77[a)]	
33		5,78[a)]	

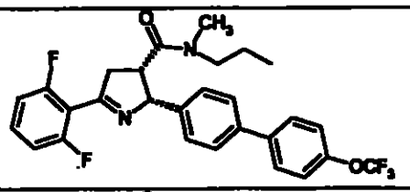
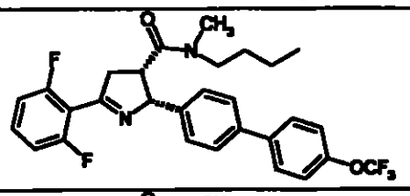
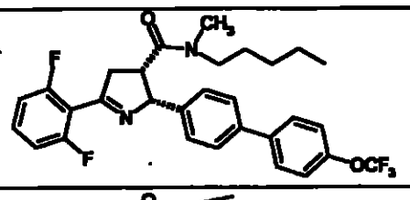
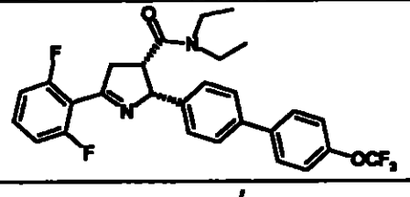
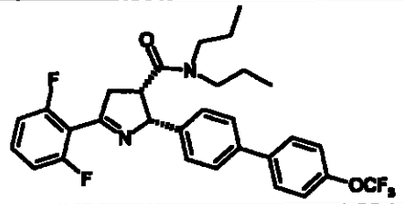
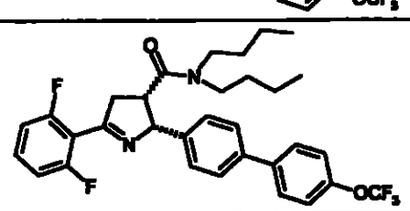
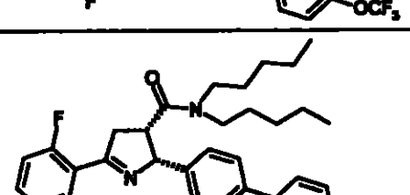
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
34		5,31[a)]	
35		5,65[a)]	
36		5,58[a)]	
37			
38		5,54[a)]	
39		4,67[a)]	
40		4,67[a)]	

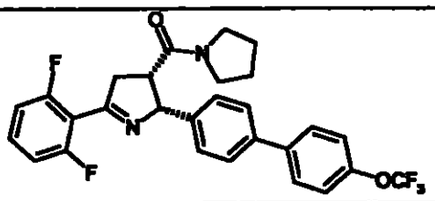
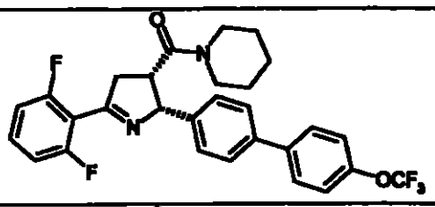
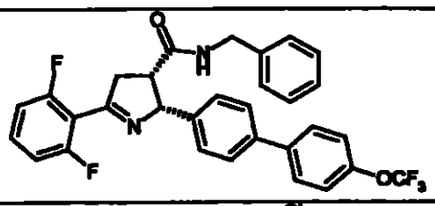
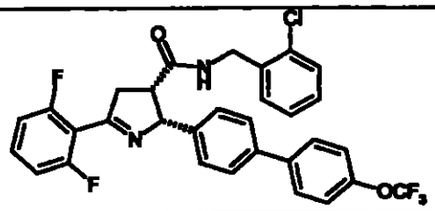
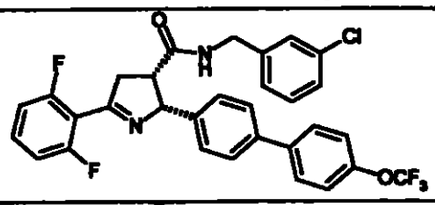
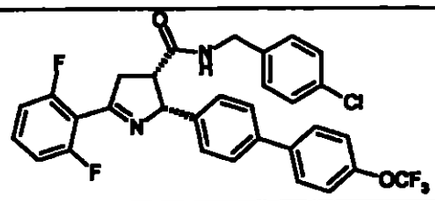
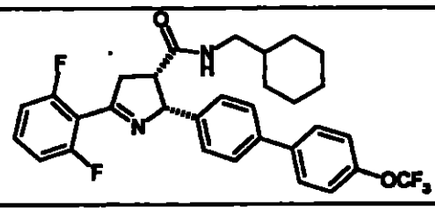
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
41		6,28[a)]	
42		5,21[a)]	
43		5,19[a)]	
44		5,14[a)]	
45		3,72[a)]	
46		4,98[a)]	
47		4,82[a)]	

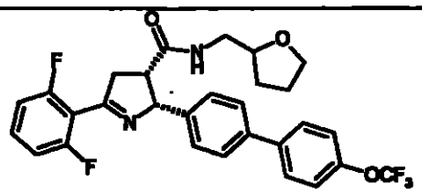
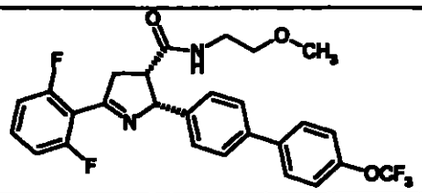
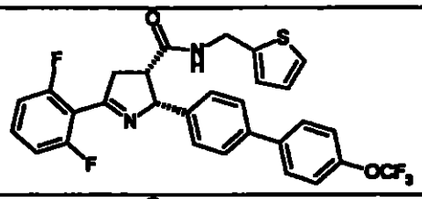
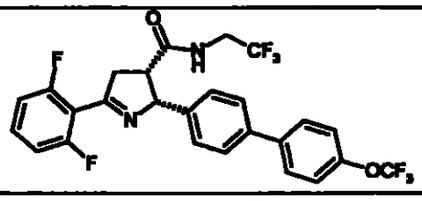
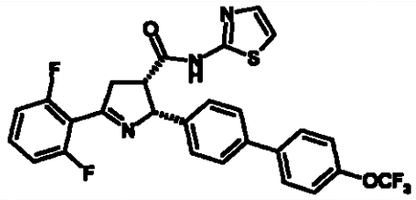
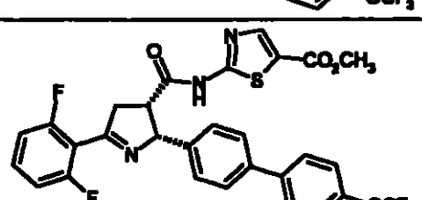
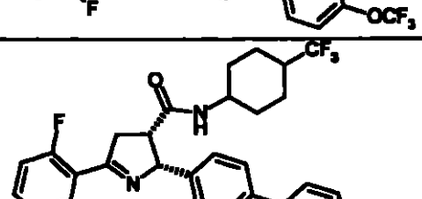
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
48		6,22[a)]	
49		6,28[a)]	
50		6,54[a)]	
51		5,97[a)]	
52		5,71[a)]	
53		4,13[a)]	
54		3,59[a)]	

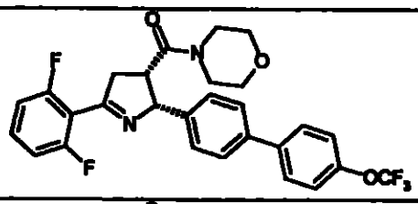
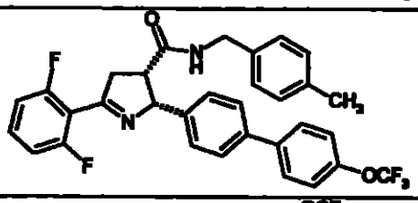
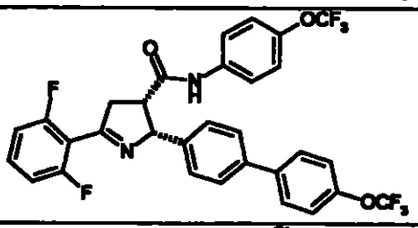
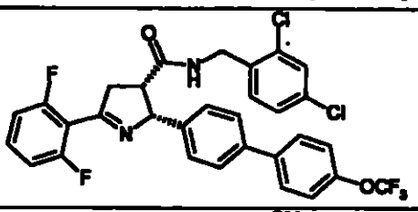
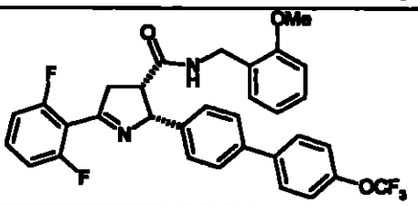
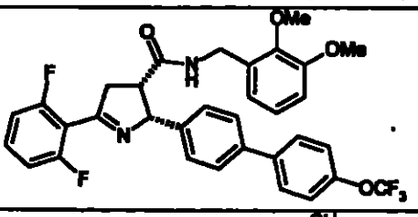
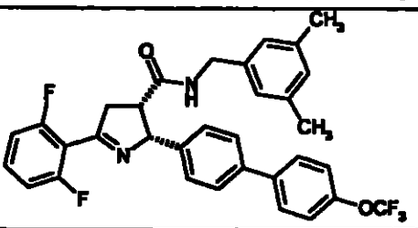
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
55		5,74[a)] 5,77[b)]	
56		5,65[a)] 5,68[b)]	
57			
58		3,26[a)]	
59		3,49[a)]	
60		3,78[a)]	
61		4,03[a)]	

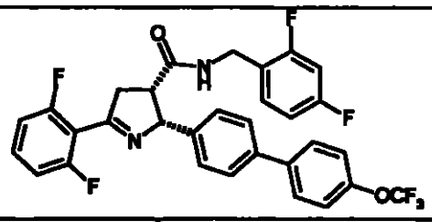
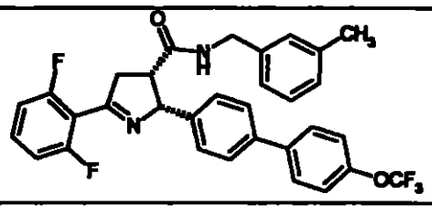
Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
62		4,37a)	
63		4,67a)	
64		3,74a)	
65		4,23a)	
66		4,37a)	
67		3,61a)	
68		3,90a)	

Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
69		4,23[a)]	
70		4,56[a)]	
71		4,92[a)]	
72		4,18[a)]	
73		4,92[a)]	
74		5,65[a)]	
75		6,43[a)]	

Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
76		3,82[a)]	
77		4,32[a)]	
78		3,94[a)]	
79		4,46[a)]	
80		4,46[a)]	
81		4,41[a)]	
82		4,67[a)]	

Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
83		3,49[a)]	
84		3,33[a)]	
85		4,03[a)]	
86		3,94[a)]	
87		3,78[a)]	
88		3,94[a)]	
89		4,46[a)]	

Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
90		3,49[a)]	
91		4,37[a)]	
92		4,87[a)]	
93		4,87[a)]	
94		4,18[a)]	
95		4,03[a)]	
96		4,72[a)]	

Nr.	Estructura	LogP	Fp/°C
97		4,23[a)]	
98		4,41[a)]	

La determinación de los valores logP indicados en las tablas procedentes y en los ejemplos de obtención se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18). Temperatura: 43°C.

La determinación se efectuó en el intervalo ácido a pH 2,3 con ácido fosfórico acuoso y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo (marcado en las tablas con [a)]).

La determinación se efectuó en el intervalo neutro a pH 7,5 con solución acuosa tampón de fosfato 0,01 molar y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo (marcado en las tablas con [b)]).

El calibrado se llevó a cabo con alcano-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores lambda-máximos se determinaron por medio de los espectros de UV con 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A

Ensayo con Liriomyza

Disolvente: 3 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

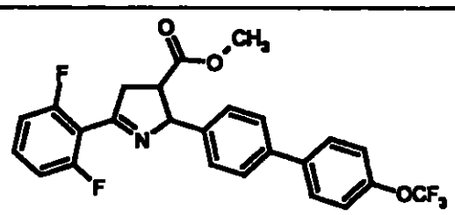
Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

Se sumergen plantas de judías (Phaseolus vulgaris), que están atacadas por huevos y estadios de desarrollo de tisanopteros (Liriomyza trifolii), en una preparación del producto activo de la concentración deseada.

Al cabo del tiempo deseado se determina el efecto en %. En este caso 100 % significa que se han destruido todos los tisanopteros; 0 % significa que no se ha destruido ningún tisanóptero.

Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla A: Ensayo con Liriomyza

Producto activo	**Concentración en producto activo en ppm**	**Grado de destrucción en % al cabo de 7 días**
	1.000	100

Ejemplo B

Ensayo con Meloidogyne

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

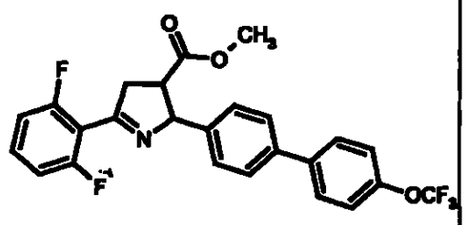
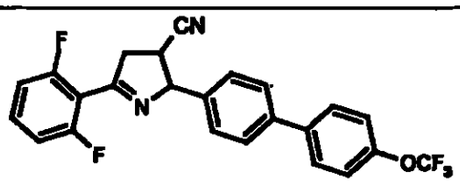
Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

Se rellenan recipientes con arena, solución del producto activo, suspensión de huevos-larvas de Meloidogyne incognita y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantucas se desarrollan. Se desarrollan vesículas sobre las raíces.

Al cabo del tiempo deseado se determina en % el efecto nematicida por medio de la formación de vesículas. En este caso 100 % significa que no se formaron vesículas; 0 % significa que el número de vesículas en las plantas tratadas corresponde al de los controles no tratados.

Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla B: Ensayo con Meloidogyne

Producto activo	**Concentración en producto activo en ppm**	**Grado de destrucción en % al cabo de 14 días**
	20	100
	20	90

Ejemplo C

Ensayo con larvas de Phaedon

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

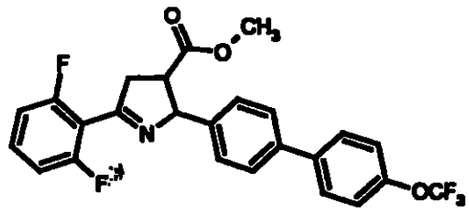
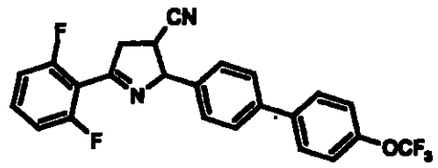
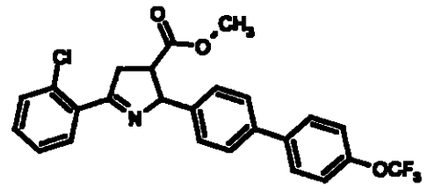
Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

Se tratan hojas de col (Brassica oleracea) por inmersión en la preparación de producto activo de la concentración deseada y se cubren con larvas del escarabajo de la hoja de rábano picante (Phaedon cochleariae), mientras las hojas estén aún húmedas.

Al cabo del tiempo deseado se determina la destrucción en %. En este caso 100 % significa que todas las larvas del escarabajo fueron destruidas, 0 % significa que no fue destruida ninguna larva del escarabajo.

Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla C: Ensayo con larvas de Phaedon

Producto activo	Concentración en producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7 días
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Ejemplo D

Ensayo con Spodoptera frugiperda

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

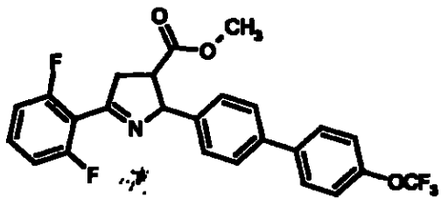
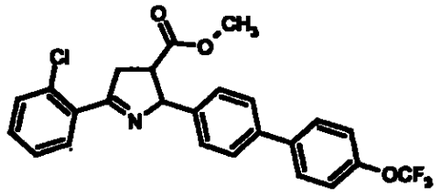
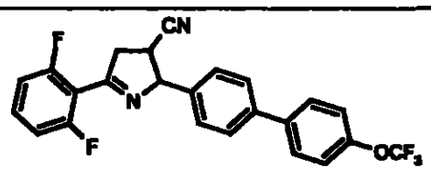
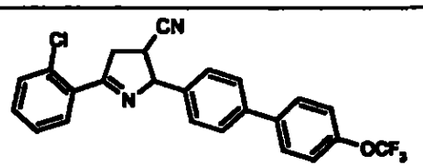
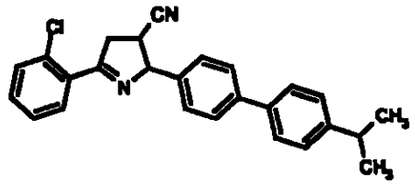
Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

Se tratan hojas de col (Brassica oleracea) mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada y se cubren con orugas del gusano invasor (Spodoptera frugiperda), en tanto en cuanto las hojas estén aún húmedas.

Al cabo del tiempo deseado se determina el efecto en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla D: Ensayo con Spodoptera frugiperda

Producto activo	Concentración en producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7 días
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Ejemplo E.

Ensayo con de Diabrotica balteata (larvas en el terreno)

Ensayo de concentración límite/insectos del terreno. Tratamiento de plantas transgénicas.

Disolvente: 7 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Se riega sobre el terreno la preparación del producto activo. En este caso prácticamente no juega ningún papel la concentración del producto activo en la preparación, siendo únicamente decisiva la cantidad de producto activo por unidad de volumen de terreno, que se indica en ppm (mg/l). Se rellenan con el terreno tiestos de 0,25 litros y se dejan reposar a 20°C.

Inmediatamente después de la carga se disponen, en cada tiesto, 5 granos de maíz pregerminados de la variedad YIELD GUARD (marca registrada de Monsanto Comp., USA). Al cabo de 2 días se disponen los insectos de ensayo correspondientes en los terrenos tratados. Al cabo de otros 7 días se determina el grado de actividad del producto activo por conteo de las plantas de maíz desarrolladas (1 planta = 20 % de actividad).

Ejemplo F.

Ensayo con Heliothis virescens (tratamiento de plantas transgénicas).

Disolvente: 7 Partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad indicada de disolvente y con la

cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Se tratan brotes de soja (Glycine max) de la variedad Roundup Ready (marca registrada de Monsanto Comp. USA) mediante inmersión, en la preparación de producto activo de la concentración deseada y se cubren con orugas del capullo del tabaco Heliothis virescens, mientras que las hojas estén aún húmedas.

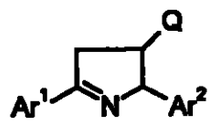
Al cabo del tiempo deseado se determina la destrucción de los insectos en %.En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

Se hace constar que , con relación a esta fecha, el mejor método conocido por la solicitante para llevar a la práctica la citada invención, es el que resulta claro de la presente descripción de la invención.

Habiéndose descrito la invención como antecede se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES

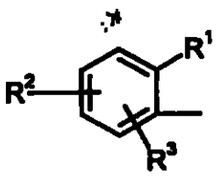
1.- Δ^1-Pirrolinas de la fórmula (I)



(I)

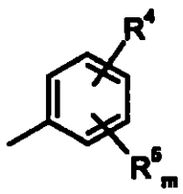
en la que

Ar^1 significa el resto



y

Ar^2 significa el resto



en los que

m significa 0, 1, 2, 3 o 4,

R^1 significa halógeno, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^4 significa halógeno o uno de los agrupamientos siguientes

(m) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalquilsulfoniloxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2-NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, halógenoalquilaminosulfonilo, bisalcoxiborano, $-B(OH)_2$,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_o$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo, o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en caso dado una o varias veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo, substituido en caso dado una o varias veces por restos de la lista W^2, con 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, con uno o varios heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo, halógenoalquenilo, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, halógenoalquileno, halógenoalquenileno,

E significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo, halógenoalquenileno, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

W^1 significa ciano, halógeno, ciano, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi,

halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, pentafluórtio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi, halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

Q significa además $-CO_2R^{13}$ o $-CONR^{14}R^{15}$,

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa hidrógeno, alquilo o halógenoalquilo,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, o conjuntamente significan alquileno,

R^9 significa hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, aralquilo, fenilo,

R^{10} significa alquilo, halógenoalquilo, aralquilo,

R^{11} significa alquilo, arilo,

R^{12} significa alquilo, halógenoalquilo, aralquilo o arilo,

R^{13} significa hidrógeno; significa alquilo substituido una o varias veces; significa aminocarbonilalquilo substituido en caso dado; significa alquenilo, fenilalquenilo; significa fenilalquilo o fenoxialquilo substituidos respectivamente en caso dado; significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo substituidos respectivamente en caso dado; significa heterociclilo o heterociclilalquilo, saturados o insaturados, con, respectivamente 1 hasta 4

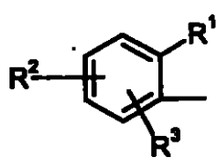
heteroátomos combinados de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre; significa tetrahidronaftilo o indanilo,

R^{14} y R^{15} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógenoalquilo, alcoxialquilo, significan fenilo o fenilalquilo substituidos respectivamente en caso dado; significan cicloalquilo o cicloalquilalquilo substituidos respectivamente en caso dado; significan heterociclilo o heterociclilalquilo substituidos respectivamente en caso dado, respectivamente saturados o insaturados con, respectivamente, 1 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

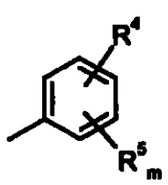
R^{14} y R^{15} significan, además, conjuntamente, alquilenoxialquileno o alquilentioalquileno.

2.- Compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



m significa 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^2 y R^3 significan, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro,

alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$,$-NR^7R^8$,

R^4 significa flúor, cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes, que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(m) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, tri(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)-sililo, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$,

$-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo, bis(alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono)borano, $-B(OH)_2$,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_o$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en caso dado una a cuatro veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo

con 5 a 10 miembros, que contiene uno o dos anillos aromáticos, substituido en caso dado de una a cuatro veces por restos de la lista W^2, con 1 a 4 heteroátomos, combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre (especialmente tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, tiazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo),

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquileno con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo

con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo,

W^1 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, pentaflúortio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

Q significa $-CO_2R^{13}$ o $-CONR^{14}R^{15}$,

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono,

halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o conjuntamente significan alquileno,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo, fenilo,

R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo,

R^{11} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, fenilo,

R^{12} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo o fenilo,

R^{13} significa hidrógeno; significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido de una a tres veces, de forma igual o de formas diferentes por ciano, por nitro, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono o por 2-pirrolidinona; significa aminocarbonil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, que puede estar substituido sobre el grupo amino, de forma igual o de formas diferentes, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por fenilo o por halógenofenilo; significa alquenilo con 2 a 8 átomos de carbono, fenil-alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono; significa fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono; significa heterociclilo o heterociclilo-alquilo con 1 a 4

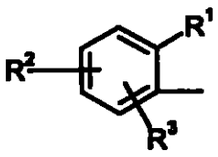
átomos de carbono, con 5 o 6 miembros, saturado o insaturado, con, respectivamente, 1 hasta 4 heteroátomos combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre (especialmente furilo, tienilo, piridinilo, furfurilo, tenilo o piridinilmetilo), pudiendo estar substituido el heterociclo respectivamente por halógeno; significa tetrahidronaftilo o indanilo,

R^{14} y R^{15} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; significan cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono; significan heterociclilo o heterociclil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, con 5 o 6 miembros, saturados o insaturados, con, respectivamente, 1 hasta 4 heteroátomos combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre (especialmente furilo, tienilo, tetrahidrofurilo, furfurilo, tenilo, tetrahidrofurilmetilo, tiazolilo), pudiendo estar substituido el heterociclo respectivamente por halógeno o por alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

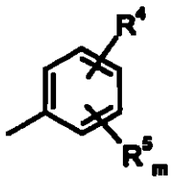
R^{14} y R^{15} significan, además, conjuntamente, alqueniloxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquileno con 1 a 4 átomos de carbono o alquilentio con 1 a 4 átomos de carbono-alquileno con 1 a 4 átomos de carbono.

3.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



m significa 0, 1 o 2,

R^1 significa flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, o significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro,

R^4 significa cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes, que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(m) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, $-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano),

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos respectivamente en caso dado de una hasta tres veces, por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo con 5 a 10 miembros, que contiene 1 o 2 anillos aromáticos, con 1 a 4 heteroátomos, combinados desde 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, desde 0 hasta 2 átomos de oxígeno y desde 0 hasta 2 átomos de azufre, substituidos, en caso dado, de una hasta tres veces, por restos de la lista W^2 (especialmente tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo),

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6

átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)aminosulfonilo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono; alquileno con 1 a 6 átomos de carbono o alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro; alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro,

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos,

respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, $-OSO_2CF_3$, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2 o 3,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre (especialmente dihidrodioxazina, oxazolina, tiazolina, imidazolina, tetrazol),

Q significa $-CO_2R^{13}$ o $-CONR^{14}R^{15}$,

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o significa metilo o etilo substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, o conjuntamente significan alquileno con 4 a 5 átomos de carbono,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro, bencilo o fenilo,

R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro,

R^{11} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenilo,

R^{12} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro,

R^{13} significa hidrógeno; significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido una o dos veces, de forma igual o de formas diferentes, por ciano, por nitro,

por metoxi, por metoxicarbonilo o por 2-pirrolidinona; significa aminocarbonil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que puede estar substituido en el grupo amino, de forma igual o de formas diferentes, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, por fenilo o por halógenofenilo; significa alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, fenil-alquenilo con 2 a 5 átomos de carbono; significa fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o fenoxi-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una a tres veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por metilo, por metoxi o por trifluórmetoxi; significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces por metilo; significa furilo, tienilo, piridinilo, furfurilo, tenilo o piridinilmetilo, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el heterociclo por cloro; significan tetrahidronaftilo o indanilo,

R^{14} significa hidrógeno,

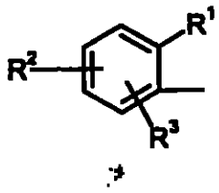
R^{15} significa halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono; significa fenilo o fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de fenilo de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por metilo, por metoxi, por triflúormetilo o por triflúormetoxi; significa cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, que pueden estar substituidos, respectivamente, en el anillo de cicloalquilo de una hasta tres veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por metilo, por triflúormetilo o por triflúormetoxi; significa furilo, tienilo, tetrahidrofurilo, furfurilo, tenilo, tetrahidrofurilmetilo,

tiazolilo o tiazolilo substituido por alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

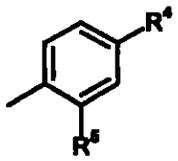
R^{14} y R^{15} significan además, conjuntamente, morfolino o tiomorfolino.

4.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



R^1 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi,

R^4 significa cloro, bromo o significa uno de los agrupamientos siguientes

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, hidroxi, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, triflúormetilo, diflúormetoxi, triflúormetoxi, triflúormetiltio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$ o $-SO_2CF_3$,

R^5 significa además hidrógeno,

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$,

$-CH=CH-$(E o Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$,

A significa fenilo substituido en caso dado una o dos veces, por restos de la lista W^1, o significa tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo substituidos respectivamente en caso dado una o dos veces por restos de la lista 2,

B significa p-fenileno monosubstituido en caso dado por restos de la lista W^1.

Z significa oxígeno, azufre o $-SO_2-$,

D significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$,

$-SO_2NMe_2$,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$,

$-CH=CH-$ (E o Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$,

E significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$,

$-SO_2NMe_2$,

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi, triflúormetoxi, diflúormetoxi, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$ $-SOCHF_2$, $-SOCF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe,

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc.-butilo, triflúormetilo, triflúormetoxi, diflúormetoxi, triflúormetiltio,- OSO_2CF_3,

$-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe,

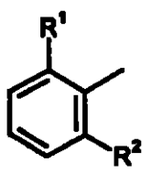
Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, $-CO_2$-triflúoretilo, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-propilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo), -CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, $-PO(OMe)_2$, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo, $-PO(OEt)_2$, $-PO(OPh)_2$, dihidrodioxazinilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, tetrazolilo,

Q significa además $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2H$,

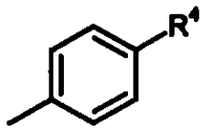
$-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, 2-metoxicarbonil-propiloxicarbonilo, 3-(2-oxo-1-pirrolidinil)-propiloxicarbonilo, N-4-flúorfenil-N-isopropil-amino-2-oxo-etiloxicarbonilo, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH-Ph$, 2-clorobenciloxicarbonilo, 3-clorobenciloxicarbonilo, 4-clorobenciloxicarbonilo, 1-feniletiloxicarbonilo, 3-fenilpropiloxicarbonilo, 2-fenoxietiloxicarbonilo, 4-metilciclohexiloxicarbonilo, ciclohexilmetiloxicarbonilo, 1-ciclohexiletiloxicarbonilo, 3-furfuriloxicarbonilo, 2-tieniloxicarbonilo, 3-tieniloxicarbonilo, 2-piridinilmetiloxicarbonilo, 3-piridinilmetiloxicarbonilo, 6-cloro-3-piridinilmetiloxicarbonilo, 1-tetrahidronaftiloxicarbonilo, 1-indaniloxicarbonilo, $-CON(H)CH_2CF_3$, metoxietilaminocarbonilo, 4-triflúormetoxifenil-aminocarbonilo, bencil-aminocarbonilo, 2-clorobencil-aminocarbonilo, 3-clorobencil-aminocarbonilo, 4-clorobencil-aminocarbonilo, 3-metilbencil-aminocarbonilo, 4-metilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diclorobencil-aminocarbonilo, 2-metoxibencil-aminocarbonilo, 2,3-dimetoxibencil-aminocarbonilo, 3,5-dimetilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diflúorbencil-aminocarbonilo, 4-triflúormetilciclohexil-aminocarbonilo, ciclohexilmetil-aminocarbonilo, 2-tienil-aminocarbonilo, 2-tetrahidrofurilmetil-aminocarbonilo, 2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo o significa morfolinocarbonilo.

5.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



R^1 significa flúor o cloro,

R^2 significa hidrógeno, cloro o flúor,

R^4 significa -B-Z-D,

B significa p-fenileno,

Z significa oxígeno o azufre,

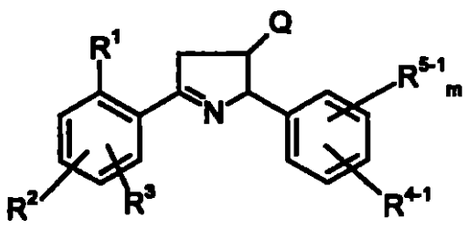
D significa $-CF_3$,

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo), –CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo,

Q significa además $-CO_2H$, $-CO_2CH_2CN$, $-CO_2(CH_2)_2CN$, $-CO_2(CH_2)_3CN$, $-CO_2CH_2C(CH_3)_2NO_2$, $-CO_2(CH_2)_2OCH_3$, 2-metoxicarbonil-propiloxicarbonilo, 3-(2-oxo-1-pirrolidinil)-propiloxicarbonilo, N-4-flúorfenil-N-isopropil-amino-2-oxo-etiloxicarbonilo, $-CO_2(CH_2)_3CH=CH_2$, $-CO_2(CH_2)_2C(CH_3)=CH_2$, $-CO_2CH_2CH=CH$-Ph, 2-clorobenciloxicarbonilo, 3-clorobenciloxicarbonilo, 4-clorobenciloxicarbonilo, 1-feniletiloxicarbonilo, 3-fenilpropiloxicarbonilo, 2-fenoxietiloxicarbonilo, 4-metilciclohexiloxicarbonilo, ciclohexilmetiloxicarbonilo, 1-ciclohexiletiloxicarbonilo, 3-furfuriloxicarbonilo, 2-tieniloxicarbonilo, 3-tieniloxicarbonilo, 2-piridinil-

metiloxicarbonilo, 3-piridinilmetiloxicarbonilo, 6-cloro-3-piridinilmetiloxicarbonilo, 1-tetrahidronaftiloxicarbonilo, 1-indaniloxicarbonilo, -CON(H)CH_2CF_3, metoxietilaminocarbonilo, 4-triflúormetoxifenil-aminocarbonilo, bencil-aminocarbonilo, 2-clorobencil-aminocarbonilo, 3-clorobencil-aminocarbonilo, 4-clorobencil-aminocarbonilo, 3-metilbencil-aminocarbonilo, 4-metilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diclorobencil-aminocarbonilo, 2-metoxibencil-aminocarbonilo, 2,3-dimetoxibencil-aminocarbonilo, 3,5-dimetilbencil-aminocarbonilo, 2,4-diflúorbencil-aminocarbonilo, 4-triflúormetilciclohexil-aminocarbonilo, ciclohexilmetil-aminocarbonilo, 2-tienil-aminocarbonilo, 2-tetrahidrofurilmetil-aminocarbonilo, 2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo, 5-metoxicarbonil-2-tiazolil-aminocarbonilo o significa morfolinocarbonilo.

6.- Δ^1-Pirrolinas de la fórmula (I-a)



(I-a)

en la que

R^1, R^2, R^3, Q y m tienen los significados indicados en una de las reivindicaciones 1 a 5,

R^{4-1} significa A o B-Z-D

donde

A, B, Z y D tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

y

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo,

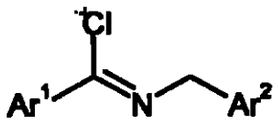
halógenoalcoxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, haloalquilaminosulfonilo,

donde

R^6, R^7, R^8 y o tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5.

7.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (I), según una de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque

A-1.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-a)



(II-a)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



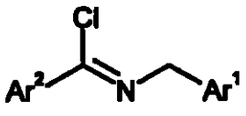
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados las reivindicaciones 1 a 5,

en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

A-2.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-b)



(II-b)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



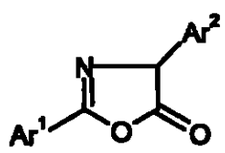
(III)

en la que

Ar^1, Ar^2, y Q tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

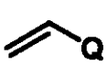
en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

B.) se hacen reaccionar oxazolinonas de la fórmula (IV)



(IV)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



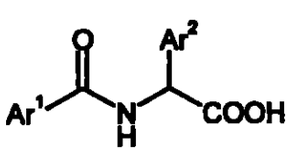
(III)

en la que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

en caso dado en presencia de un diluyente, o porque

C.) se hacen reaccionar ácidos carboxílicos de la fórmula (V)



(V)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



(III)

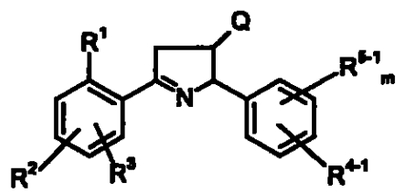
en la que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

en presencia de anhidrido acético y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

porque

D.) Se obtienen las Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I-a)



(I-a)

en la que

R^1, R^2, R^3, Q y m tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

R^{4-1} significas A o B-Z-D

donde

A, B, Z y D tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

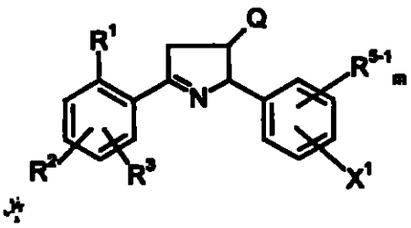
y

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, haloalquilaminosulfonilo,

donde

R^6, R^7, R^8 y o tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (I-b)



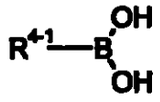
(I-b)

en la que

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q y m tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5 y

X^1 significa Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$

con ácidos borónicos de la fórmula (VI)



(VI)

en la que

R^{4-1} tiene el significado indicado en esta reivindicación,

en presencia de un catalizador, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido y en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque

se obtienen los compuestos de la fórmula (I-a), porque se hacen reaccionar, compuestos de la fórmula (I-b)

en la que

X^1 significa 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano),

con (hetero)ciclos de la fórmula (VII)

T—A (VII)

en la que A tiene el significado indicado en las reivindicaciones 1 a 5

y

T significa Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado en presencia de un diluyente.

8.- Agentes pesticidas, caracterizados porque tienen un contenido en al menos un compuesto de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 5, además de extendedores y/o productos tensioactivos.

9.- Compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 5, para la lucha contra las pestes.

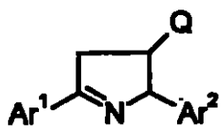
10.- Procedimiento para la lucha contra las pestes, caracterizado porque se dejan actuar los compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 5, sobre las pestes y/o sobre su medio ambiente.

11.- Procedimiento para la obtención de agentes pesticidas, caracterizado porque se mezclan compuestos de la fórmula (I), según una de las reivindicaciones 1 a 5, con extendedores y/o con productos tensioactivos.

12.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I), según una de las reivindicaciones 1 a 5, para la fabricación de agentes pesticidas.

RESUMEN

Nuevas Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I)



(I)

en la que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados en la descripción,

a varios procedimientos para la obtención de estos productos y a su empleo para la lucha contra las pestes.

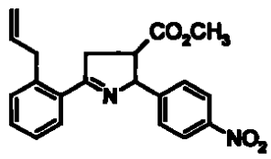
Le A 342772.co

TRADUCCION

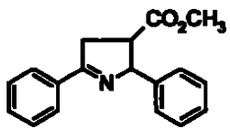
Δ^1-Pyrroline

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Δ^1-Pyrroline, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

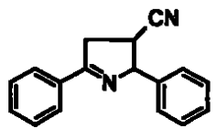
Bisher sind nur wenige 4-substituierte-2,5-bis-Aryl-Δ^1-Pyrroline bekannt geworden:



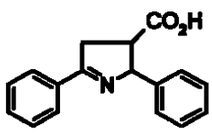
A. Padwa and A. Ku, J. Am. Chem. Soc. 1978, *100*, 2181



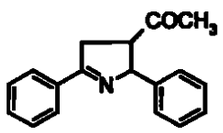
A. Padwa and J. Smolanoff, J. Am. Chem. Soc. 1971, *93*, 548



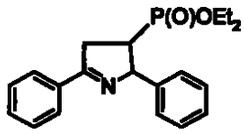
A. Padwa et al, J. Am. Chem. Soc. 1973, *95*, 1945



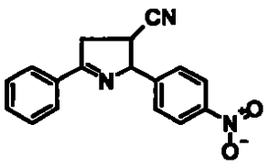
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1970, *103*, 2368



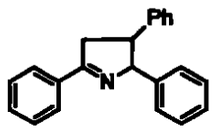
O. Tsuge *et al.*, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347



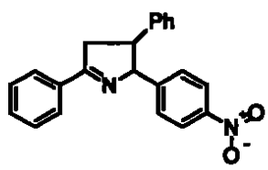
Gakis,N. *et al.*, Helv.Chim. Acta 1975, *58*, 748



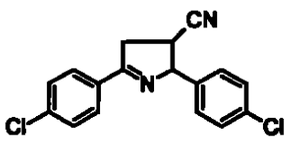
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1972, *105*, 1258



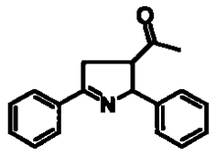
Padwa *et al.*, Tet. Lett. 1972, 4087



Huisgen *et al.*, Tet. Lett. 1986, 3603



A. R. Katritzky *et al.*, Synthesis 1991, *10*, 863



O. Tsuge, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347

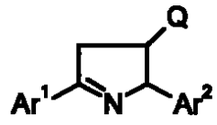
Über deren Eignung zur Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel ist nichts bekannt.

In WO 00/21958, WO 99/59968, WO 99/59967 und WO 98/22438 wurden andere Δ^1-Pyrroline und deren Eignung als Schädlingsbekämpfungsmittel beschrieben.

Die Wirkungshöhe und/oder Wirkungsdauer dieser vorbekannten Verbindungen ist jedoch, insbesondere gegen bestimmte Organismen und/oder bei niedrigen Anwendungskonzentrationen, nicht in allen Anwendungsgebieten völlig zufriedenstellend.

Wegen der vielfältigen Anforderungen an moderne Schädlingsbekämpfungsmittel, beispielsweise bezülgich Wirkhöhe, Wirkdauer, Wirkspektrum, Anwendungsspektrum, Toxizität, Kombination mit anderen Wirkstoffen, Kombination mit Formulierungshilfsmitteln oder die Synthese, und wegen des möglichen Auftretens von Resistenzen kann die Entwicklung solcher Stoffe jedoch nie als abgeschlossen betrachtet werden, und es besteht beständig ein hoher Bedarf an neuen Verbindungen, die zumindest in Teilaspekten Vorteile gegenüber den bekannten Verbindungen besitzen.

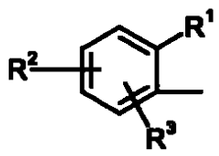
Es wurden nun neue Δ^1-Pyrroline der Formel (I)



(I)

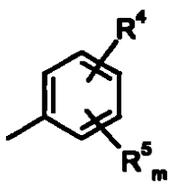
gefunden, in welcher

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in denen

m für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

R^1 für Halogen, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$ steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Alkoxyalkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$ stehen,

R^4 für Halogen oder eine der folgenden Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Halogen, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_nR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Halogenalkylaminosulfonyl, Bisalkoxyboran, $-B(OH)_2$, steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_n$, $-NR^6$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Cyclopropyl, Oxiranyl steht,

A für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit einem oder mehreren Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff, oder $-S(O)_n-$, steht,

D für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Halogenalkylen, Halogenalkenylen steht,

E für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Aralkyl, Phenyl steht,

R^{10} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl steht,

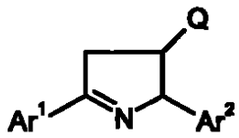
R^{11} für Alkyl, Aryl steht,

R^{12} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl oder Aryl steht.

Die Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere bzw. Regioisomere oder deren Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Sowohl die reinen Isomere als auch die Isomerengemische werden erfindungsgemäß beansprucht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man die neuen Verbindungen der Formel (I) nach einem der im folgenden beschriebenen Verfahren erhalten kann.

Δ^1-Pyrroline der Formel (I)



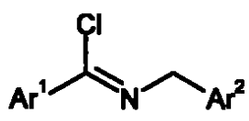
(I)

in welcher

Ar^1, Ar^2, und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

lassen sich herstellen,

A-1.) indem man Iminochloride der Formel (II-a)



(II-a)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



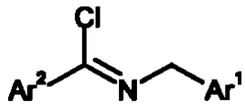
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

A-2.) indem man Iminochloride der Formel (II-b)



(II-b)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



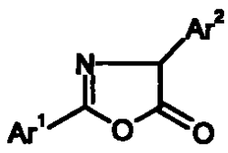
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

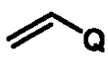
in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

B.) indem man Oxazolinone der Formel (IV)



(IV)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



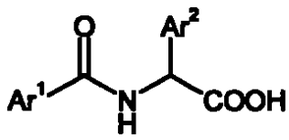
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2 und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

C.) indem man Carbonsäuren der Formel (V)



(V)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



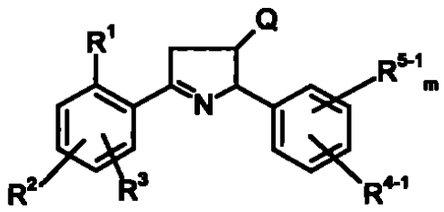
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2 und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart von Essigsäureanhydrid und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

D.) Δ^1-Pyrroline der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher

R^1, R^2, R^3, Q und m die oben angegebenen Bedeutungen haben,

R^{4-1} für A oder B-Z-D

steht, wobei

A, B, Z und D die oben angegebenen Bedeutungen haben

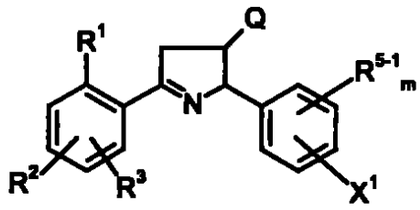
und

R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Haloalkylaminosulfonyl steht,

wobei

R^6, R^7, R^8 und o die oben angegebenen Bedeutungen haben,

lassen sich herstellen, indem man Verbindungen der Formel (I-b)



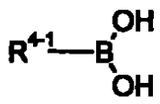
(I-b)

in welcher

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q und m die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X^1 für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht

mit Boronsäuren der Formel (VI)



(VI)

in welcher

R^{4-1} die oben angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder indem man Verbindungen der Formel (I-b)

in welcher

X^1 für 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan) steht

mit (Hetero)cyclen der Formel (VII)



(VII)

in welcher A die oben angegebene Bedeutung hat und

T für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sehr gute insektizide Eigenschaften besitzen und sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz zur Bekämpfung unerwünschter Schädlinge, wie Insekten, verwenden lassen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nachstehend erwähnten Formeln aufgeführten Reste werden im folgenden erläutert.

m steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3.

R^1 steht bevorzugt für Halogen, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_nR^6$, $-NR^7R^8$.

R^2 und R^3 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$.

R^4 steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindliche Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

R^5 steht bevorzugt für Halogen, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, Tri(C_1-C_6-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (C_1-C_6-Halogenalkyl)aminosulfonyl, Bis(C_1-C_6-alkoxy)boran, $-B(OH)_2$.

X steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_o$, $-NR^6$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropyl, Oxiranyl.

A steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen

(insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl).

B steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen.

Z steht bevorzugt für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff, oder $-S(O)_e-$.

D steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl.

Y steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen, C_1-C_6-Halogenalkylen, C_2-C_6-Halogenalkenylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen.

E steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl.

W^1 steht bevorzugt für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_eR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

W^2 steht bevorzugt für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_2-C_6-

Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^5)$.

n steht bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.

Q steht bevorzugt für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel.

o steht bevorzugt für 0, 1 oder 2.

R^6 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl.

R^7 und R^8 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen.

R^9 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Akyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl, Phenyl.

R^{10} steht bevorzugt für C_1-C_6-Akyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl.

R^{11} steht bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, Phenyl.

R^{12} steht bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl oder Phenyl.

m steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

R^1 steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy.

R^2 und R^3 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy.

R^4 steht besonders bevorzugt für Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

R^5 steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy, $-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_eR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan).

X steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropyl, Oxiranyl.

A steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen

(insbesondere Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl, Chinolinyl oder Isochinolinyl).

B steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen.

Z steht besonders bevorzugt für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff, oder $-S(O)_o-$.

D steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_4-Alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_4-Alkylsulfonyl.

Y steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen; jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkylen oder C_2-C_6-Alkenylen; C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen.

E steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_6-Alkylsulfonyl.

W^1 steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_4-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

W^2 steht besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, $-OSO_2CF_3$, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

n steht besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3.

Q steht besonders bevorzugt für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel (insbesondere Dihydrodioxacin, Oxazolin, Thiazolin, Imidazolin, Tetrazol).

o steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

R^6 steht besonders bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl oder jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl.

R^7 und R^8 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für C_1-C_6-Akyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, oder gemeinsam für C_4-C_5-Alkylen.

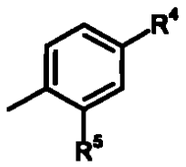
R^9 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, Benzyl, Phenyl.

R^{10} steht besonders bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl.

R^{11} steht besonders bevorzugt für C_1-C_4-Alkyl, Phenyl.

R^{12} steht besonders bevorzugt für C_1-C_4-Alkyl oder für durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl.

Ar^2 steht ganz besonders bevorzugt für den Rest



R^1 steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec.-Butoxy, tert.-Butoxy.

R^2 und R^3 stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec.-Butoxy, tert.-Butoxy.

R^4 steht ganz besonders bevorzugt für Chlor, Brom oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

R^5 steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Difluor-

methoxy, Trifluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$, oder $-SO_2CF_3$.

X steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

A steht ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl.

B steht ganz besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen.

Z steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder $-SO_2-$.

D steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

Y steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E oder Z), -C≡C-, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

E steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Pro-

pargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

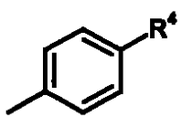
W^1 steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec.-Butoxy, tert.-Butoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$, $-SOCHF_2$, $-SOCF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

W^2 steht ganz besonders bevorzugt für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

Q steht ganz besonders bevorzugt für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec.-Butyl, $-CO_2$-tert.-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec.-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, $-CO_2$-Trifluorethyl, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-Propyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert.-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, $-PO(OMe)_2$, Pyrrolidino-

carbonyl, Piperidinocarbonyl, -$PO(OEt)_2$, -$PO(OPh)_2$, Dihydrodioxacinyl, Oxazolyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Tetrazolyl.

Ar^2 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für den Rest



R^1 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

R^2 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor oder Fluor.

R^4 steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für -B-Z-D.

B steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für p-Phenylen.

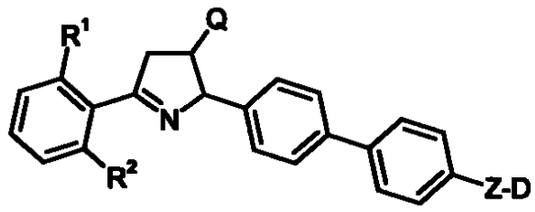
Z steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

D steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für $-CF_3$.

Q steht insbesondere ganz besonders bevorzugt für -CO_2CH_3, -$CO_2CH_2CH_3$, -CO_2-n-Propyl, -CO_2-Isopropyl, -CO_2-n-Butyl, -CO_2-Isobutyl, -CO_2-sec.-Butyl, -CO_2-tert.-Butyl, -CO_2-n-Pentyl, -CO_2-Neopentyl, -CO_2-sec.-Isoamyl, -CO_2-Pentan-3-yl, -CO_2-Cyclopentyl, -CO_2-n-Hexyl, -CO_2-Cyclohexyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert.-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl),

-CONH(Cyclohexyl), -CONMe$_2$, -CONEt$_2$, -CON(n-Propyl)$_2$, -CON(Isopropyl)$_2$, -CON(n-Butyl)$_2$, -CON(n-Pentyl)$_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formel (I-c)

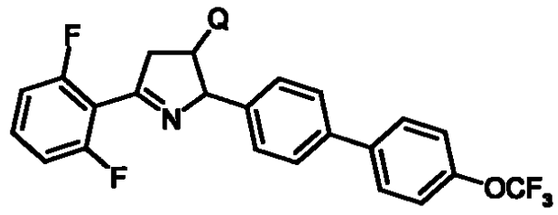


(I-c)

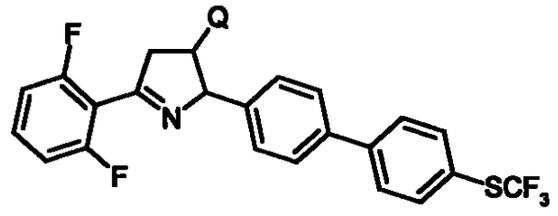
in welcher

R^1, R^2, Z, D und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben.

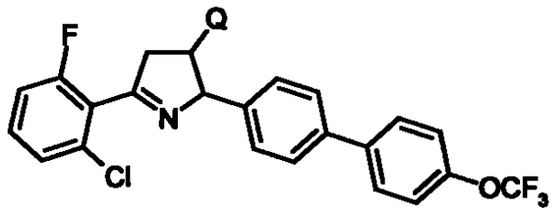
Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)



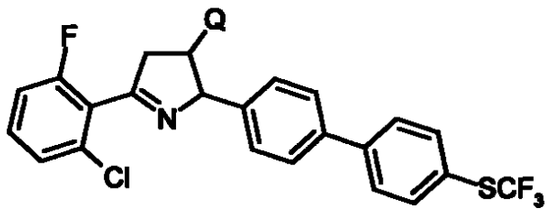
(I-d)



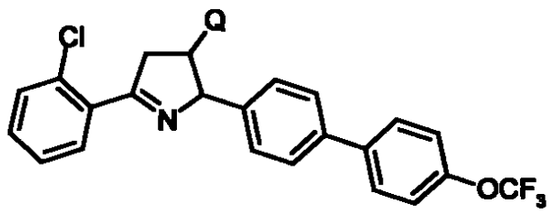
(I-e)



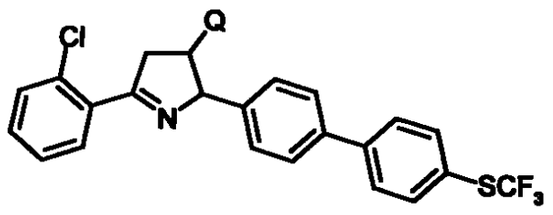
(I-f)



(I-g)



(I-h)



(I-i)

in denen

Q für $-CO_2R^9$, $-CONHR^8$ oder $-CONR^7R^8$ steht,

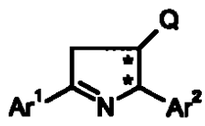
wobei R^7, R^8 und R^9 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere bevorzugt sind auch Verbindungen der allgemeinen Formeln (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) und (I-i)

in welchen

Q für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec.-Butyl, $-CO_2$-tert.-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec.-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, $-CONHCH_3$, $-CONHCH_2CH_3$, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert.-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl steht.

Die allgemeine Formel (I) besitzt zwei, hier durch * gekennzeichnete, Asymmetriezentren.



(I)

Bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel (I), in denen die Substituenten Q und Ar^2 an den beiden chiralen Zentren cis-ständig sind.

In den oben genannten Definitionen stehen Oxyalkylen bzw. Thioalkylen für -O-Alkyl- bzw. -S-Alkyl-, wobei die Bindung z.B. an Ar^2 über das Sauerstoff- bzw. Schwefelatom erfolgt und am Alkylrest gegebenenfalls weitere Substituenten wie z.B. A in –X-A gebunden sind. Alkylenoxy bzw. Alkylenthio stehen für -Alkyl-O- bzw. -Alkyl-S-, wobei die Bindung z.B. an Ar^2 jeweils über den Alkylrest erfolgt und am Sauerstoff- bzw. Schwefelatom gegebenenfalls weitere Substituenten wie z.B. A in –X-A gebunden sind. Oxyalkylenoxy steht für -O-Alkyl-O.

Heterocyclyl steht in der vorliegenden Beschreibung für einen gesättigten oder ungesättigten cyclischen Kohlenwasserstoff in welchem einer oder mehrere Kohlenstoff-

atome durch ein oder mehrere Heteroatome ausgetauscht sind. Heteroatome steht dabei bevorzugt für O, S, N, P, insbesondere für O, S und N.

Bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen, welche die unter bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt genannten Substituenten tragen.

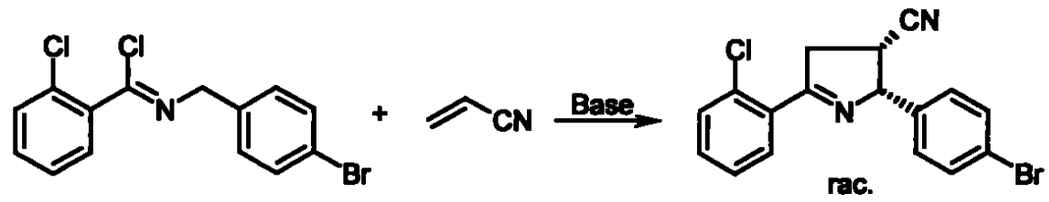
Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können. Mehrere Reste mit denselben Indizes wie beispielsweise m Reste R^5 für m >1, können gleich oder verschieden sein.

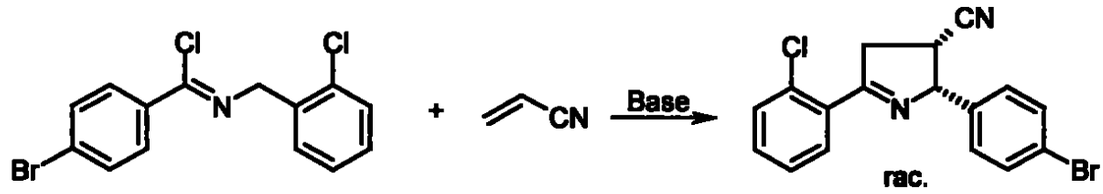
Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

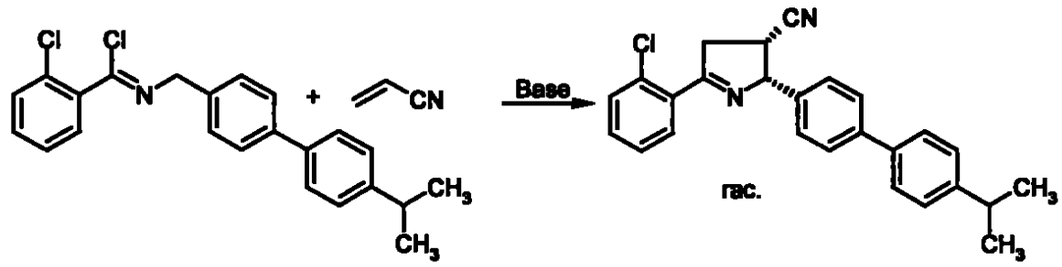
Verwendet man N-(4-Brombenzyl)-2-chlorphenyl-carboximidoyl-chlorid und Acrylsäurenitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



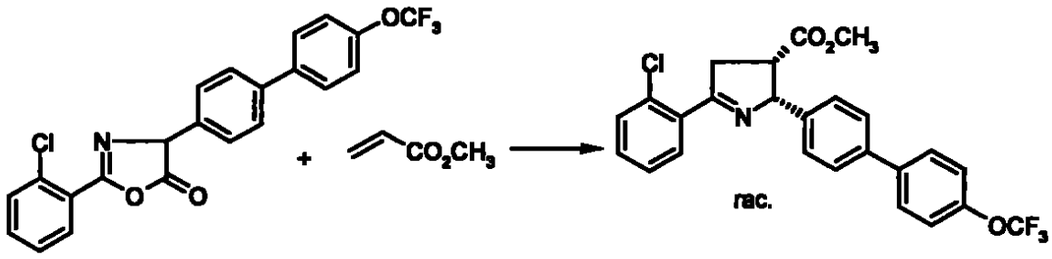
Verwendet man N-(2-chlorbenzyl)-4-bromphenyl-carboximidoyl-chlorid und Acrylsäurenitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-2) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



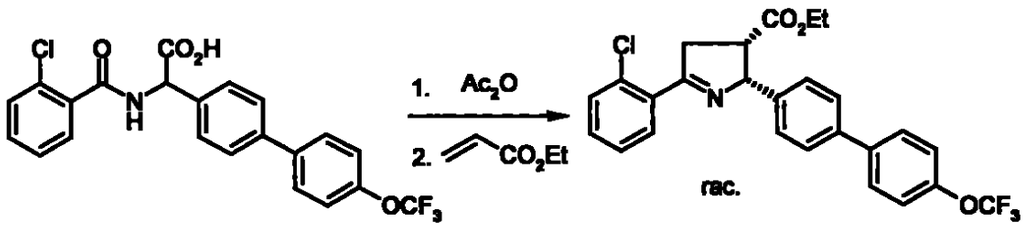
Verwendet man 2-Chlor-N-[(4'-isopropyl-1,1'-biphenyl-4-yl)methyl]benzolcarboximidoyl-chlorid und Acrylnitril als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



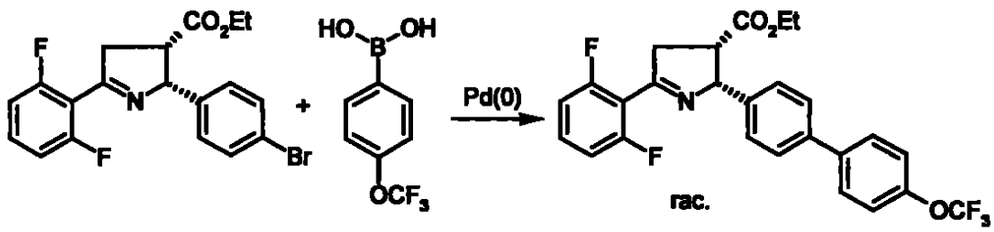
Verwendet man 2-(2'-Chlorbenzyl)-4-[4'-(trifluormethoxy)-1-1'-biphenyl]oxazolidin-5-on und Acrylsäuremethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Verwendet man N-(2-Chlorbenzoyl)-2-[(4'-trifluormethoxy)biphenyl]glycin und Essigsäureanhydrid und Acrylsäureethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

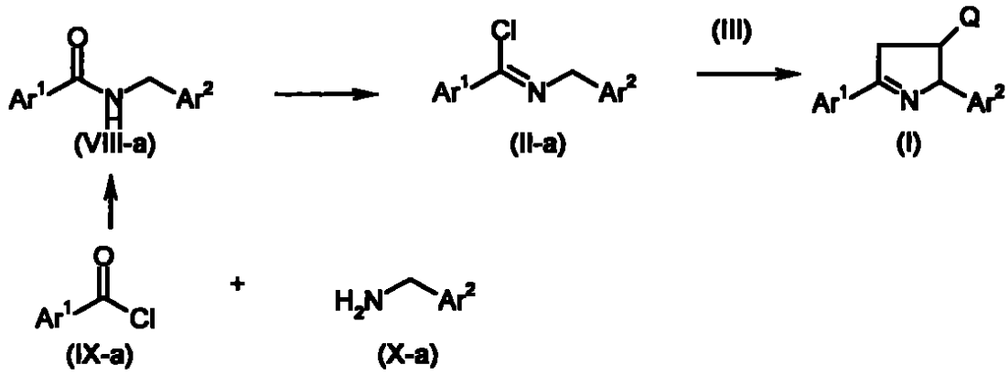


Verwendet man 2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrole-3-carbonsäureethylester und 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

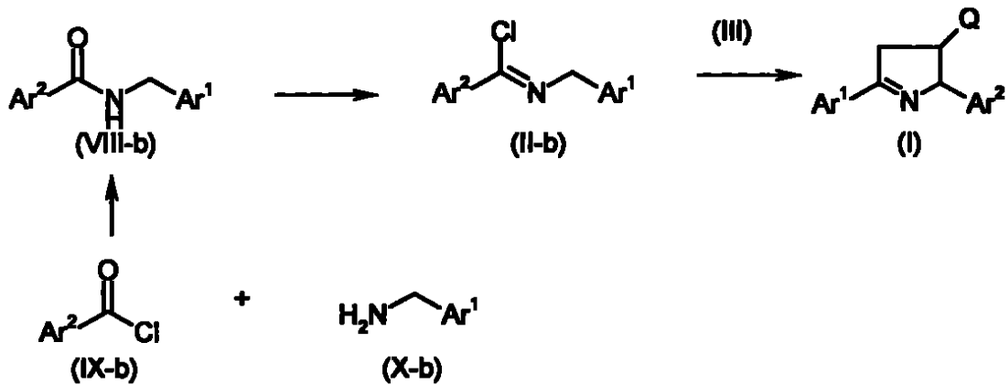


Erläuterungen der Verfahren und Zwischenprodukte:

Verfahren (A-1)



Verfahren (A-2)



Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Iminochloride sind durch die Formeln (II-a) und (II-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Die zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Iminochloride der Formeln (II-a) und (II-b) lassen sich herstellen, indem man Amide der Formeln (VIII-a) und (VIII-b) mit einem

Chlorierungsreagenz (z.B. $SOCl_2$) in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt. (Für weitere Methoden siehe „The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond", in Patai, Interscience, New York, 1970, S. 597-662).

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Amide sind durch die Formeln (VIII-a) und (VIII-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

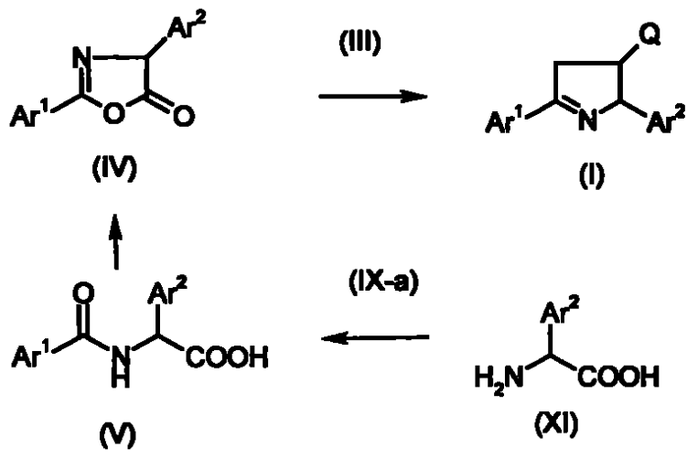
Amide der Formeln (VIII-a) und (VIII-b) lassen sich z.B. herstellen, indem man Säurechloride der Formeln (IX-a) und (IX-b) mit Benzylaminen der Formeln (X-a) und (X-b) in Gegenwart einer Base (z.B. Et_3N oder NaOH) und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1) und (A-2) als Ausgangsstoffe benötigten Säurechloride und Benzylamine sind durch die Formeln (IX-a) und (IX-b) bzw. durch die Formeln (X-a) und (X-b) allgemein definiert. In diesen Formeln stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Säurechloride der Formeln (IX-a) und (IX-b) sind allgemein bekannt. Benzylamine der Formeln (X-a) und (X-b) sind zum Teil bekannt, können aber aus den entsprechenden Nitrilen bzw. Aldehyden über bekannte Methoden (Reduktion bzw. reduktive Aminierung) hergestellt werden (s. z.B. Vogel's Textbook Of Practical Organic Chemistry, Fifth Edition 1989, John Wiley and Sons, New York, Author: Vogel, Arthur, Israel; Revised by Furniss, Hannaford, Smith, and Tatchell, ISBN 0-582-46236-3).

Verbindungen der Formel (III) (Q = Ester, Nitril, Keton, Amid, Phosphorester, Sulfon) sind allgemein bekannt bzw. kommerziell erhältlich.

Verfahren (B)



Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Oxazolidinone sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

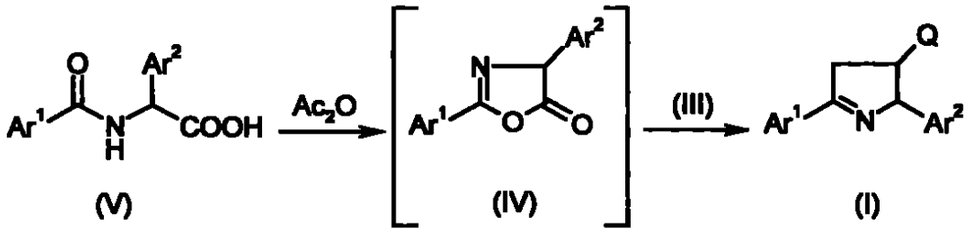
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens B als Ausgangsstoffe benötigten Oxazolidinone der Formel (IV) lassen sich analog zu den in der Literatur bekannten Beispielen aus N-Benzoyl-aminosäuren der Formel (V) herstellen. Oxazolidinone der Formel (IV) werden anschließend mit Dipolarophilen der Formel (III) umgesetzt (vgl. z.B. Chem. Ber. 1970, **103**, 2368-2387, und dort zitierte Literatur).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten N-Benzoyl-aminosäuren sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In

dieser Formel stehen Ar^1 und Ar^2 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (V) lassen sich aus Aminosäure-Derivaten der Formel (XI) durch Umsetzung mit Säurechloriden der Formel (IX-a) in Gegenwart eine Base und eines Verdünnungsmittels erhalten. Aminosäuren der Formel (XI) sind zum Teil kommerziell erhältlich und/oder können über bekannte Verfahren hergestellt werden (z.B. Tetrahedron 1994, 50, 1539-1650 und dort zitierte Literatur).

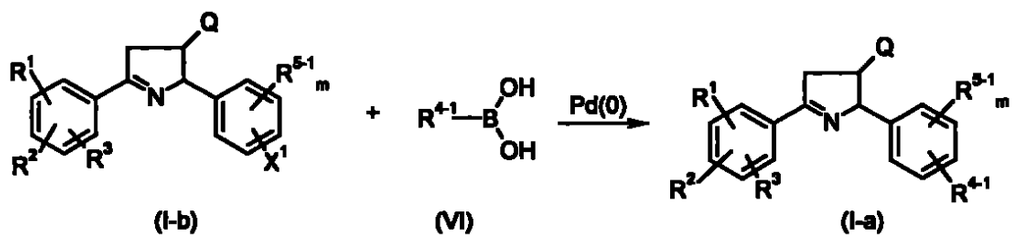
Verfahren (C)



(V) (IV) (I)

N-Benzoyl-aminosäuren der Formel (V) können zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch in einer Tandem-Reaktion umgesetzt werden. Hierzu werden die Oxazolidinone der Formel (IV) *in situ* aus Verbindungen der Formel (V) und Essigsäureanhydrid (vgl. z.B. Chem. Ber. 1970, 103, 2368-2387) hergestellt und anschließend gemäß Verfahren B mit Dipolarophilen der Formel (III) umgesetzt.

Verfahren (D)



(I-b) (VI) (I-a)

Für den Fall, dass Ar^2 im erfindungsgemäßen Wirkstoff der Formel (I) für ein gegebenenfalls substituiertes Biphenyl steht, lassen sich Verbindungen der Formel (I-a) herstellen, indem man Verbindungen der Formel (I-b) mit Arylboronsäuren der Formel (VI) in Gegenwart eines Palladium-Katalysators und in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittel kuppelt.

In Verbindungen der Formeln (I-a) bzw. (I-b) stehen R^1, R^2, R^3 und m bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

R^{5-1} steht bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, Tri(C_1-C_6-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_mR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (C_1-C_6-Halogenalkyl)aminosulfonyl.

R^{5-1} steht besonders bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_mR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$.

R^{5-1} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, $-OSO_2NMe_2$, oder $-SO_2CF_3$.

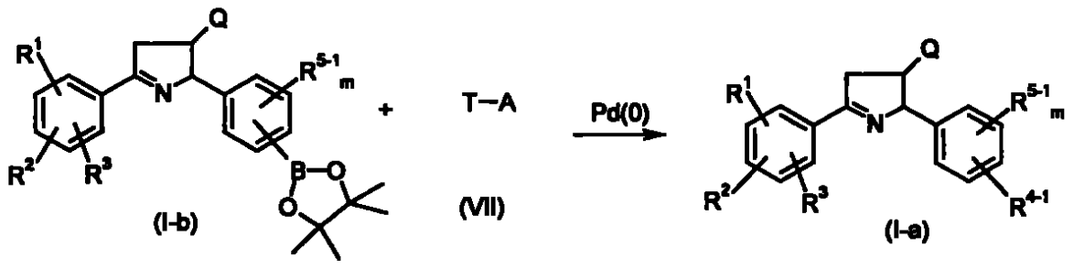
In Verbindungen der Formel (I-b) steht X^1 bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom, ganz besonders bevorzugt für Brom.

In Verbindungen der Formeln (I-a) und (VI) steht R^{4-1} für A oder -B-Z-D. A, B, Z und D stehen dabei bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Ver-

bindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (I-b) werden über Verfahren A, B oder C hergestellt. Boronsäuren der Formel (VI) sind z. Teil bekannt, können aber auch ausgehend vom (Brom)aromaten durch Lithiierung bzw. Br-Li (Mg)-austausch und anschließende Umsetzung mit Trisalkoxyborverbindungen hergestellt werden (vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 1993, **34**, 8237-8240).

Weiterhin können Verbindungen der Formel (I-a) ausgehend von Verbindungen der Formel (I-b) [X^1 = 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan] und (Hetero)cyclen der Formel (VII) analog Literatur bekannten Methoden (J.Org. Chem. 1995, **60**, 7508; Tetrahedron Lett. 1997, **38**, 3841.) hergestellt werden.



In den (Hetero)cyclen der Formel (VII) steht T bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom, ganz besonders bevorzugt für Chlor. A steht bevorzugt, besonders bevorzugt etc. für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Verbindungen der Formel (VII) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man im allgemeinen einen Palladium-Katalysator ein, der wiederum mit oder ohne Zusatz von weiteren Liganden verwendet werden kann. Vorzugsweise verwendet man als

Katalysator $PdCl_2(dppf)$ [dppf = 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocene], $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$, $PdCl_2(CH_3CN)_2$, $Pd_2(dba)_3$ [dba = Dibenzylidenaceton] oder $Pd(OAc)_2$, besonders bevorzugt $PdCl_2(dppf)$, $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$, oder $Pd(OAc)_2$, ganz besonders bevorzugt $PdCl_2(dppf)$ oder $Pd(PPh_3)_4$. Als Liganden kommen Triarylphosphine, Trialkylphosphine oder Arsine in Frage. Vorzugsweise verwendet man dppf, PPh_3, $P(t\text{-}Bu)_3$, Pcy_3 oder $AsPh_3$, besonders bevorzugt dppf.

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) erhält man Verbindungen der Formel (I) bzw. (I-a), in welchen Q für $-CO_2H$ steht, indem man z.B. die entsprechenden Methylester nach bekannten Verfahren verseift (vgl. T.W. Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd edition, S. 232-234).

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Es ist jedoch auch möglich, ohne zusätzliches Säurebindemittel zu arbeiten, oder die Aminkomponente in einem Überschuss einzusetzen, so dass sie gleichzeitig als Säurebindemittel fungiert.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether,

Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 140°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (A-1), (A-2), (B), (C) und (D) arbeitet man im allgemeinen jeweils unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A-1) oder (A-2) setzt man auf 1 Mol an Iminochlorid der Formeln (II-a) oder (II-b) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man auf 1 Mol an Oxazolinon der Formel (IV) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen

einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) setzt man auf 1 Mol an Carbonsäure der Formeln (V) im allgemeinen 2 Mol an Dipolarophil der Formel (III) sowie 1 bis 3 Mol an Essigsäureanhydrid ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch extrahiert, wäscht, trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man auf 1 Mol an Verbindungen der Formeln (I) im allgemeinen 1 Mol an Dipolarophil der Formel (III) oder auch einen Überschuss daran, sowie 1 bis 5 Mol an Säurebindemittel und 1/20 mol Katalysator ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch zwischen Wasser und Methyl-tert-butylether verteilt, die organische Phase über Natriumsulfat trocknet und den Rückstand gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Die Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal

sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spp..

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus spp., Schistocerca gregaria.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Reticulitermes spp..

Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp., Trichodectes spp., Damalinia spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci, Thrips palmi, Frankliniella accidentalis.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Aphis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pscudococcus spp., Psylla spp.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella xylostella, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp.,

Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Mamestra brassicae, Panolis flammea, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana, Cnaphalocerus spp., Oulema oryzae.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

Aus der Klasse der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp.,

Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch hervorragende Wirkung gegen Larven des Meerettichblattkäfers (Phaedon cochleariae), Raupen des Eulenfalters (Spodoptera frugiperda), Larven der Grünen Reiszikade (Nephotettix cincticeps), Pfirsichblattläuse (Myzus persicae) und alle Stadien der gemeinen Spinnmilbe (Tetranychus urticae) aus.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobizide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den

Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln;

als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate;

als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

Besonders günstige Mischpartner sind z.B. die folgenden:

Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox,

Guazatin,

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozen (PCNB),

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,

α-(1,1-Dimethylethyl)-ß-(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,α-(2,4-Dichlorphenyl)-ß-fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α-(2,4-Dichlorphenyl)-ß-methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

α-(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)-ß-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

(5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

(E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,

{2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-isopropylester

1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,

1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,

1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,

1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,

1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,

1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,

1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,

1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,

2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,

2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,

2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,

2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,

2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,

2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,

2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,

2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-ß-D-glycopyranosyl)-a-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,

2-Aminobutan,

2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,

2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,

2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,

2-Phenylphenol(OPP),

3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,

3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,

3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,

3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
8-Hydroxychinolinsulfat,
9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-hydrochlorid,
Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
Kaliumhydrogencarbonat,
Methantetrathiol-Natriumsalz,
Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,

Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Teclofta-
5 lam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,
10 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos,
15 Butocarboxim, Butylpyridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cycloprene,
20 Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopfthora spp.,
25 Eprinomectin, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron,
30 Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene, Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

Kernpolyederviren

Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

Quinalphos,

Ribavirin

Salithion, Sebufos, Selamectin, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermethrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanyliden)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropancarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekälkten Unterlagen aus.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp.,

Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Aus der Ordnung der Heteropterida z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Aus der Ordnung der Blattarida z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattela germanica, Supella spp..

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodorus spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

Beispielsweise zeigen sie eine hervorragende Wirksamkeit gegen alle larvalen Stadien der Fliege *Lucilia cuprina* und alle Entwicklungsstadien der Zecke *Amblyomma variegatum*.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.)

vermindert werden, so daß durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitonal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Außerdem wurde gefunden, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.

Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie

Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis, Xyleborus spec. Tryptodendron spec. Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. Dinoderus minutus.

Hautflügler wie
Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.

Termiten wie
Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus.
Borstenschwänze wie Lepisma saccharina.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.
Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft zu verstehen:

Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit mindestens einem Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Binde- oder Fixiermittels,

Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölartiges schwer flüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralölhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dgl. zum Einsatz.

In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindeöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise α-Monochlornaphthalin, verwendet.

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, daß das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und daß das Insektizid-Fungizid--Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches oder ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycolether, Ester oder dgl. zur Anwendung.

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes verwendet.

Das als Bindemittel verwendete Kunstharz kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dgl. eingesetzt werden.
Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällem vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.
Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der WO 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyriphos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid und Triflumuron,

sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolylfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken, Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Ledamorpha (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorpha (Seepocken), wie Balanus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise Ectocarpus sp. und Ceramium sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflußkrebse) zusammengefaßt werden, besondere Bedeutung zu.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis-(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-*n*-butylzinnlaurat, Tri-*n*-butylzinnchlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinnchlorid, Tri-*n*-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdändisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyltitanat, Phenyl-(bispyridin)-wismutchlorid, Tri-*n*-butylzinnfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zink-dimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamoylzinkethylenbisthiocarbamat, Zinkoxid, Kupfer(I)-ethylen-bisdithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphthenat und Tributylzinnhalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Verbindungen entscheidend reduziert werden.

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

Algizide wie
2-*tert.*-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

Fungizide wie
Benzo[*b*]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, Tolylfluanid und Azole wie
Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

Molluskizide wie
Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb;

oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie
4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Dimethylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutyldistannoxan, 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachloroisophthalonitril, Tetramethylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.

Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten desweiteren die üblichen Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* **1985**, *37*, 730-732 und Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, **1973** beschrieben.

Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.
Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittelsystem, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wäßrigen System, Vinylchlorid/Vinylacetat-Copolymersysteme in Form wäßriger Dispersionen oder in Form von organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke,

trocknende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination mit Teer oder Bitumina, Asphalt sowie Epoxyverbindungen, geringe Mengen Chlorkautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.

Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.

Die Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam. Zu diesen Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. Buthus occitanus.
Aus der Ordnung der Acarina z.B. Argas persicus, Argas reflexus, Bryobia ssp., Dermanyssus gallinae, Glyciphagus domesticus, Ornithodorus moubat, Rhipicephalus sanguineus, Trombicula alfreddugesi, Neutrombicula autumnalis, Dermatophagoides pteronissimus, Dermatophagoides forinae.
Aus der Ordnung der Araneae z.B. Avicullariidae, Araneidae.
Aus der Ordnung der Opiliones z.B. Pseudoscorpiones chelifer, Pseudoscorpiones cheiridium, Opiliones phalangium.
Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Porcellio scaber.
Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp..

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus spp..

Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. Blatta orientalies, Blattella germanica, Blattella asahinai, Leucophaea maderae, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta australasiae, Periplaneta americana, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Supella longipalpa.

Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. Acheta domesticus.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Kalotermes spp., Reticulitermes spp.

Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. Lepinatus spp., Liposcelis spp.

Aus der Ordnung der Coleptera z.B. Anthrenus spp., Attagenus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae, Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles spp., Calliphora erythrocephala, Chrysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Drosophila spp., Fannia canicularis, Musca domestica, Phlebotomus spp., Sarcophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Achroia grisella, Galleria mellonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Phthirus pubis.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodinus prolixus, Triatoma infestans.

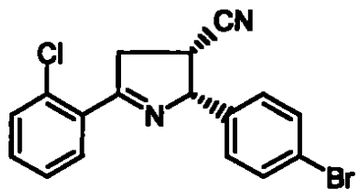
Die Anwendung im Bereich der Haushaltsinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern, Carbamaten, Pyrethroiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.

Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel- und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gehen aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele

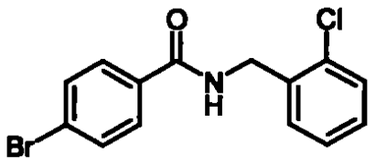
Beispiel 1



rac.

(I-b-1)

Synthese 1.Stufe:

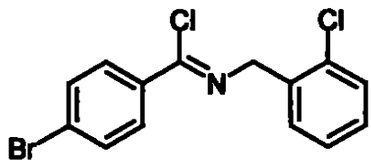


(VIII-b-1)

Zu einer Mischung bestehend aus 100.5 g (0.50 mol) 4-Brombenzoesäure, 1 ml Dimethylformamid und 1200 ml Dichlormethan wird unter Rühren eine Lösung von 63.5 g (0.50 mol) Oxalychlorid in 50 ml Dichlormethan zugetropft. Nach 4-stündigem Rühren und nach Beendigung der Gasentwicklung (HCl, CO, CO_2) kühlt man unter Argon auf –60°C und tropft innerhalb von 10 Minuten ein Gemisch aus 70.8 g (0.50 mol) 2-Chlorbenzylamin und 161.0 g (1.25 mol) N,N-Diisopropylethylamin hinzu. Nach Rühren über Nacht wird die so erhaltene gelbe Lösung nacheinander dreimal mit je 250 ml 2N Salzsäure, einmal mit 300 ml Wasser und einmal mit 300 ml gesättigter Natriumchlorid-Lösung gewaschen. Nach Trocknen der organischen Phase über Natriumsulfat und vollständigem Einengen erhält man einen Rückstand, der mit 200 ml Dichlormethan bei Raumtemperatur aufgerührt und anschließend abgesaugt wird. Den so erhaltenen Rückstand nimmt man in 200 ml Methyl-tert.-butylether auf, erhitzt kurz zum Sieden, lässt Abkühlen und saugt erneut ab.

Man erhält 108 g (83% der Theorie) 4-Brom-N-(2-chlorbenzyl)benzamid vom Schmelzpunkt 133°C.

Synthese 2. Stufe:



(II-b-1)

Eine Mischung aus 106.4 g (0.34 mol) der Verbindung (VIII-b-1) und 200 ml Thionylchlorid wird für 2 h zum Rückfluss erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur entfernt man das überschüssige Thionylchlorid unter vermindertem Druck. Das so erhaltene gelbe Öl kristallisiert nach kurzem Stehen bei Raumtemperatur.

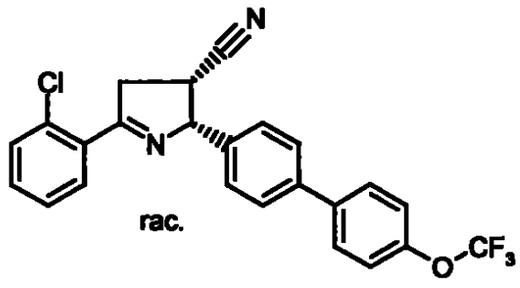
Man erhält 112.5 g (97 % der Theorie) 4-Brom-N-(2-chlorbenzyl)phenylcarboximidoyl-chlorid vom Schmelzpunkt 58 bis 61°C.

Synthese 3. Stufe:

Eine Mischung aus 55.9 g (163 mmol) der Verbindung (II-b-1), 17.3 g (327 mmol) Acrylsäurenitril und 33.0 g (327 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man mit dreimal 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2-chlorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrole-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 110°C.

Beispiel 2

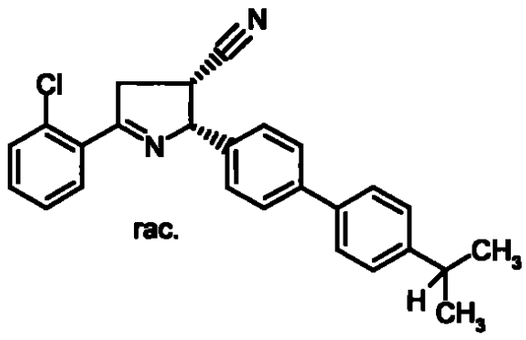


(I-a-1)

Eine Mischung aus 0.997 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-1), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2 Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert.-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert.-butylether ergibt einen weißen Feststoff.

Man erhält 320 mg (26% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 132°C.

Beispiel 3

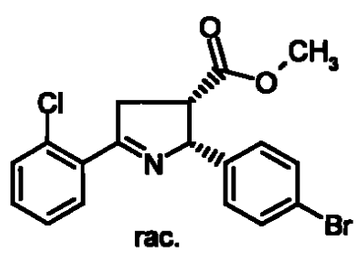


(I-a-2)

Eine Mischung aus 0.803 g (2.23 mmol) der Verbindung (I-b-1), 0.732 g (4.46 mmol) 4-Isopropyl-phenyl-boronsäure, 0.130 g (0.12 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 15 ml 1,2 Dimethoxyethan und 3.7 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 40 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert.-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Chromatographie des so erhaltenen Rückstandes an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester als Eluens ergibt das gewünschte Produkt.

Man erhält 230 mg (26% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(isopropyl)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 127-128°C.

Beispiel 4

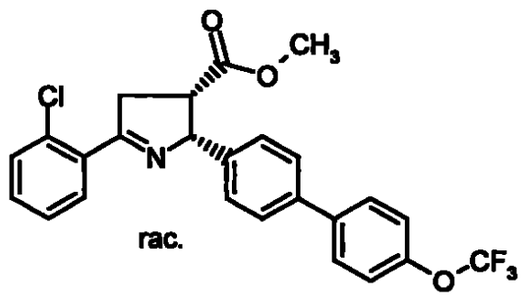


(I-b-2)

Eine Mischung aus 55.9 g (163 mmol) der Verbindung (II-b-1), 28.1 g (327 mmol) Acrylsäuremethylester und 33.0 g (327 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man dreimal mit je 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml Konz. Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S)-2-(4-Bromphenyl)-5-(2-chlorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 134°C.

Beispiel 5



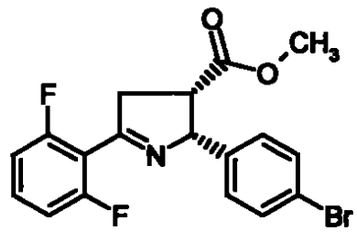
(I-f-1)

Eine Mischung aus 1.09 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-2), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2 Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 prozentige Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert.-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Der Rückstand wird an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigsäureethylester als Eluens chromatographiert.

Man erhält 620 mg (47% d. Th.) ((2S, 3R), (2R, 3S))-5-(2-Chlorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester als gelbliches Öl.

log P (pH 2.3) = 5.05.

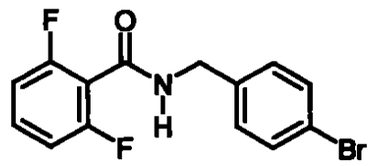
Beispiel 6



rac.

(I-b-3)

Synthese 1. Stufe:



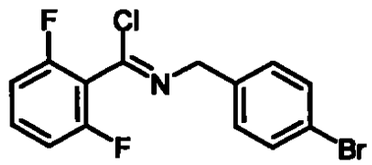
(VIII-a-1)

Zu einer Lösung von 73.3 g (464 mmol) 2,6-Difluorbenzoesäure in 1000 ml Dichlormethan und 2 ml Dimethylformamid wird eine Lösung von 64.8 g (510 mmol) Oxalylchlorid in 200 ml Dichlormethan bei 20°C unter Argon zugetropft (1 h, Innentemperatur fällt ohne Argonstrom auf 15°C). Nach Ende der starken Gasentwicklung (CO_2, CO, HCl) wird auf 35°C erwärmt und 5 min nachgerührt. Anschließend gibt man 103.2 g (464 mmol) 4-Brombenzylaminhydrochlorid zu und tropft eine Lösung von 140.5 g (1391 mmol) Triethylamin in 100 ml Dichlormethan bei 0°C zu der Lösung des Säurechlorids. Nach Beendigung der Reaktion gibt man 200 ml Dichlormethan zu. Dann wird zweimal mit je 500 ml 2N HCl, zweimal mit je 250 ml 2 N NaOH ausgeschüttelt, anschließend neutral gewaschen und einmal mit 100 ml

konzentrierter Natriumchloridlösung extrahiert. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird filtriert und das Filtrat unter vermindertem Druck vollständig eingeengt. Die gewünschte Verbindung kristallisiet aus Dichlormethan/n-Hexan.

Man erhält 125.7 g (83 % d. Th.) N-(4-Brombenzyl)-2,6-difluorbenzamid vom Schmelzpunkt 142°C.

Synthese 2. Stufe:



(II-a-1)

25 g (76.7 mmol) der Verbindung (VIII-a-1) wird in 60 ml Thionylchlorid für 2 h unter Rückfluss erhitzt. Anschließend engt man unter vermindertem Druck vollständig ein.

Der so erhaltene Rückstand wirde ohne weitere Reinigung für die Folgereaktionen eingesetzt.

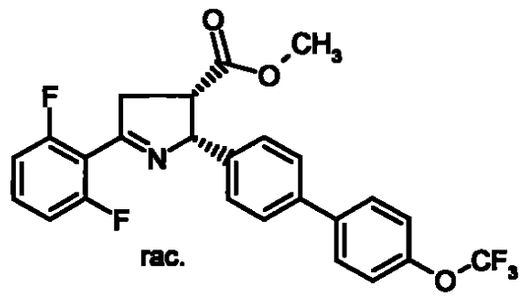
Synthese 3. Stufe:

Eine Mischung von 25.4 g (73.7 mmol) der Verbindung II-a-1, 25.3 g Acrylsäuremethylester (294 mmol) und 29.8 g (295 mmol) Triethylamin wird für 14 d unter Licht- und Luftausschluss stehen gelassen.

Zur Aufarbeitung nimmt man in 500 ml Dichlormethan auf und extrahiert die organische Phase dreimal mit je 500 ml 2N Salzsäure. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck eingeengt und der so erhaltene Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Methanol als Laufmittel chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethylester vom Schmelzpunkt 133°C.

Beispiel 7



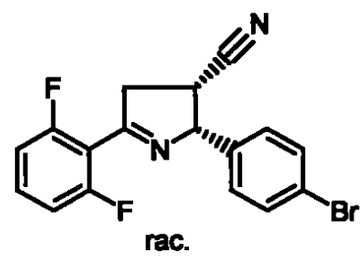
rac.

(I-d-1)

Eine Mischung aus 1.10 g (2.78 mmol) der Verbindung (I-b-3), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenyl-phosphin-Palladium, 20 ml 1,2-Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natrium-carbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert.-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert.-butylether ergab einen weißen Feststoff.

Man erhält 480 mg (39% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-Difluorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonsäuremethyl-ester vom Schmelzpunkt 125°C.

Beispiel 8



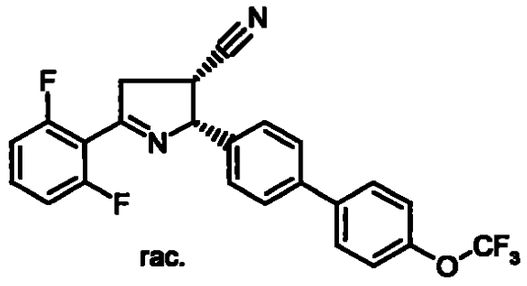
rac.

(I-b-4)

Eine Mischung aus 25.4 g (76.6 mmol) der Verbindung (II-a-1), 16.2 g (303 mmol) Acrylsäurenitril und 30.7 g (303 mmol) Triethylamin in 300 ml Dichlormethan wird für 7 d unter Licht- und Luftausschluss bei Raumtemperatur stehen gelassen. Anschließend wäscht man dreimal mit je 100 ml 2N Salzsäure, einmal mit 100 ml Wasser und einmal mit 100 ml konzentrierter Natriumchlorid-Lösung. Nach Trocknen über Natriumsulfat wird unter vermindertem Druck vollständig eingeengt und der Rückstand mehrfach an Kieselgel mit Dichlormethan/Cyclohexan als Eluens chromatographiert.

Man erhält ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-Bromphenyl)-5-(2,6-difluorphenyl)-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt 159°C.

Beispiel 9



rac. (I-a-3)

Eine Mischung aus 1.00 g (2.78 mmol) der Verbindungen (I-b-4), 0.606 g (2.90 mmol) 4-Trifluormethoxy-phenyl-boronsäure, 0.16 g (0.14 mmol) Tetrakis-triphenylphosphin-Palladium, 20 ml 1,2 Dimethoxyethan und 5.0 ml 20 proz. Natriumcarbonat-Lösung wird für 30 Minuten unter Argon auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur nimmt man den Ansatz in 30 ml Wasser und 30 ml Methyl-tert.-butylether auf. Nach Abtrennen der organischen Phase wird die wässrige Phase erschöpfend mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Man trocknet die vereinigten organischen Phasen über Natriumsulfat und engt unter vermindertem Druck vollständig ein. Kristallisation aus Dichlormethan/Methyl-tert.-butylether ergibt einen hellgelben Feststoff.

Man erhält 520 mg (42% d. Th.) ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-Difluorphenyl)-2-[4'-(trifluormethoxy)-1,1'-biphenyl-4-yl]-3,4-dihydro-2H-pyrrol-3-carbonitril vom Schmelzpunkt: 145°C.

Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele

Beispiel A

Liriomyza-Test

Lösungsmittel: 3 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

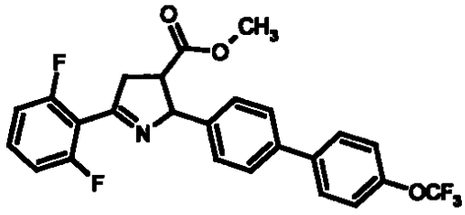
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Bohnenpflanzen (Phaseolus vulgaris), die von Eiern und Entwicklungsstadien der Thripse (Liriomyza trifolii) befallen sind, werden in eine Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration getaucht.

Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Thripse abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Thripse abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle A: Liromyza-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100

Beispiel B

Meloidogyne-Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

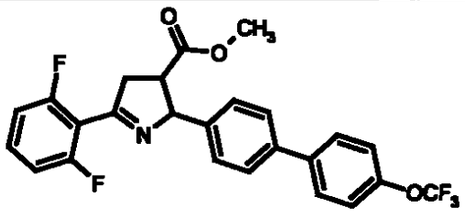
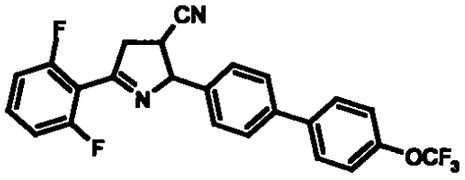
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, Meloidogyne incognita-Ei-Larvensuspension und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass keine Gallen gefunden wurden; 0% bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der der unbehandelten Kontrolle entspricht.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle B: Meloidogyne-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 14 Tagen
	20	100
	20	90

Beispiel C

Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

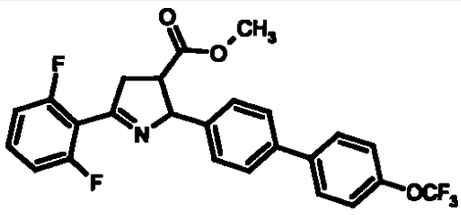
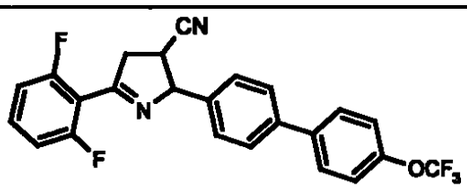
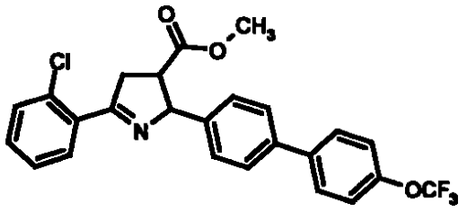
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichkäfers (Phaedon cochleariae) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C: Phaedon-Larven-Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Beispiel D

Spodoptera frugiperda-Test

Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

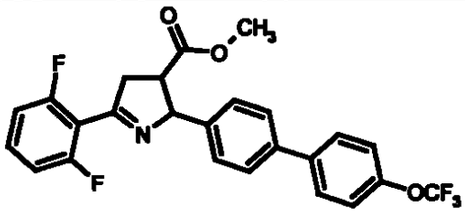
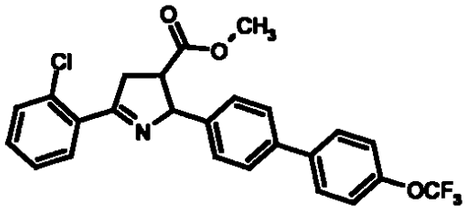
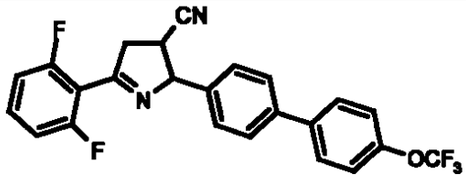
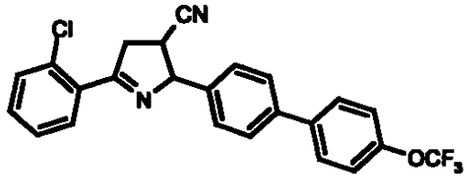
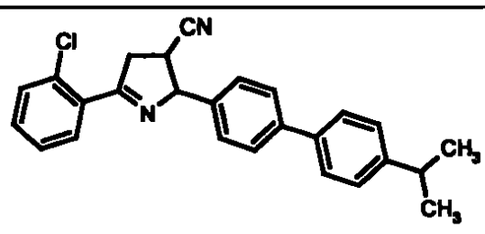
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurmes (Spodoptera frugiperda) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0% bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

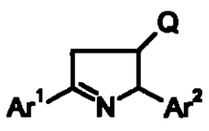
Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentrationen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle D: Spodoptera frugiperda -Test

Wirkstoff	Wirkstoffkonzentration in ppm	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Patentansprüche

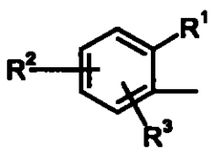
1. Δ^1-Pyrroline der Formel (I)



(I)

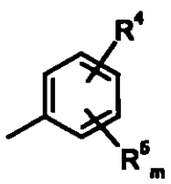
in welcher

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in denen

m für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit einem oder mehreren Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff, oder $-S(O)_o-$, steht,

D für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Alkylen, Alkenylen, Alkinylen, Alkylenoxy, Oxyalkylen, Oxyalkylenoxy, Thioalkylen, Halogenalkylen, Halogenalkenylen steht,

E für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Halogenalkylsulfonyl, Dialkylaminosulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, Alkyl, Trialkylsilyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkenyloxy, Halogenalkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, Cycloalkyl, Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl, Phenyl steht,

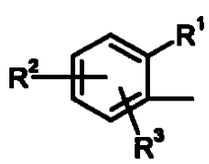
R^{10} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl steht,

R^{11} für Alkyl, Aryl steht,

R^{12} für Alkyl, Halogenalkyl, Aralkyl oder Aryl steht.

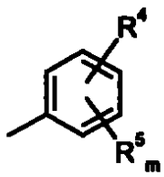
2. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, worin

m für 0, 1, 2 oder 3 steht,

R^1 für Halogen, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$ steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$ stehen,

R^4 für Fluor, Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindliche Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Halogen, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, Tri(C_1-C_6-alkyl)-silyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_nR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (C_1-C_6-Halogenalkyl)aminosulfonyl, Bis(C_1-C_6-alkoxy)-boran, $-B(OH)_2$ steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, $-S(O)_n$, $-NR^6$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropyl, Oxiranyl steht,

A für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff, oder $-S(O)_n-$ steht,

D für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen, C_1-C_6-Halogenalkylen, C_2-C_6-Halogenalkenylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen steht,

E für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, Pentafluorthio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Halogen, Formyl, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, Tri(C_1-C_4-alkyl)silyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_6-Halogenalkyl)sulfonyloxy, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, oder gemeinsam für Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, C_1-C_6-Akyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl, Phenyl steht,

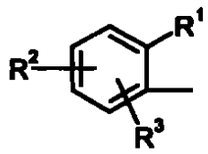
R^{10} für C_1-C_6-Akyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl steht,

R^{11} für C_1-C_6-Alkyl, Phenyl steht,

R^{12} für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, Benzyl oder Phenyl steht.

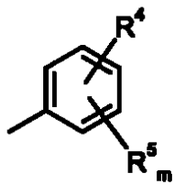
3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in welchen

m für 0, 1 oder 2 steht,

R^1 für Fluor, Chlor, Brom, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy stehen,

R^4 für Chlor, Brom, Iod oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, Nitro, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl, C_1-C_6-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_6-Alkoxy,

$-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan) steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, Oxysulfonyl (OSO_2), C_1-C_4-Alkylen, C_2-C_4-Alkenylen, C_2-C_4-Alkinylen, C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen, Cyclopropyl, Oxiranyl steht,

A für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, Naphthyl oder Tetrahydronaphthyl oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes 5- bis 10-gliedriges, 1 oder 2 aromatische Ringe enthaltendes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen, kombiniert aus 0 bis 4 Stickstoffatomen, 0 bis 2 Sauerstoffatomen und 0 bis 2 Schwefelatomen steht,

B für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für $-(CH_2)_n-$, Sauerstoff, oder $-S(O)_o-$ steht,

D für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_4-Alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_4-Alkylsulfonyl steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, Carbonyloxy, Oxycarbonyl, C_1-C_6-Alkylen, C_2-C_6-Alkenylen, C_2-C_6-Alkinylen; jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkylen oder C_2-C_6-Alkenylen; C_1-C_4-Alkylenoxy, C_1-C_4-Oxyalkylen, C_1-C_4-Oxyalkylenoxy, C_1-C_4-Thioalkylen steht,

E für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_2-C_6-Alkinyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, C_2-C_6-Alkenyl oder C_1-C_6-Alkylsulfonyl steht,

W^1 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, (C_1-C_4-Halogenalkyl)-sulfonyloxy, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

W^2 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Alkoxy, C_2-C_6-Halogenalkenyloxy, $-OSO_2CF_3$, C_1-C_4-Alkylcarbonyl, C_1-C_4-Alkoxycarbonyl, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$ steht,

n für 0, 1, 2 oder 3 steht,

Q für $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, einen 5- bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus mit 2- bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

o für 0, 1 oder 2 steht,

R^6 für C_1-C_6-Alkyl oder jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes Methyl oder Ethyl steht,

R^7 und R^8 unabhängig voneinander für C_1-C_6-Akyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, oder gemeinsam für C_4-C_5-Alkylen stehen,

R^9 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, jeweils durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl, Benzyl, Phenyl steht,

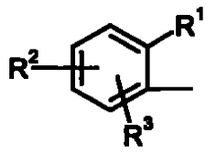
R^{10} für C_1-C_6-Alkyl, durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_6-Alkyl steht,

R^{11} für C_1-C_4-Alkyl, Phenyl steht,

R^{12} für C_1-C_4-Alkyl oder für durch Fluor oder Chlor substituiertes C_1-C_4-Alkyl steht.

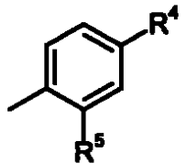
4. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^1 für den Rest



steht und

Ar^2 für den Rest



steht, in welchen

R^1 für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec.-Butoxy, tert.-Butoxy steht,

R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec.-Butoxy, tert.-Butoxy stehen,

R^4 für Chlor, Brom oder eine der folgenden in ortho- oder para-Position des Arylrings befindlichen Gruppierungen

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E

steht,

R^5 für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$ oder $-SO_2CF_3$ steht,

X für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E oder Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$ steht,

A für gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes Phenyl, oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder

zweifach durch Reste aus der Liste W^2 substituiertes Tetrazolyl, Furyl, Benzofuryl, Thienyl, Benzothienyl, Pyrrolyl, Indolyl, Oxazolyl, Benzoxazolyl, Isoxazyl, Imidazyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Benzothiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazyl steht,

B für gegebenenfalls einfach durch Reste aus der Liste W^1 substituiertes p-Phenylen steht,

Z für Sauerstoff, Schwefel oder $-SO_2-$ steht,

D für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$ steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel, $-SO_2-$, Carbonyl, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E oder Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$ steht,

E für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, 2-Propenyl, Butenyl, Propargyl, Butinyl, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$ steht,

W^1 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Formyl, Nitro, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, Isobutyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Isobutoxy, sec.-Butoxy, tert.-Butoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$,

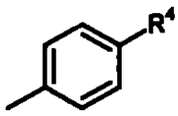
$-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$, $-SOCHF_2$, $-SOCF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe steht,

W^2 für Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, tert.-Butyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethylthio, $-OSO_2CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe steht,

Q für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec.-Butyl, $-CO_2$-tert.-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec.-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, $-CO_2$-Trifluorethyl, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-Propyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert.-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, $-PO(OMe)_2$, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl, $-PO(OEt)_2$, $-PO(OPh)_2$, Dihydrodioxacinyl, Oxazolyl, Thiazolyl, Imidazolyl, Tetrazolyl steht.

5. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welchen

Ar^2 für den Rest



steht,

R^1 für Fluor oder Chlor steht,

R^2 für Wasserstoff, Chlor oder Fluor steht,

R^4 für -B-Z-D steht,

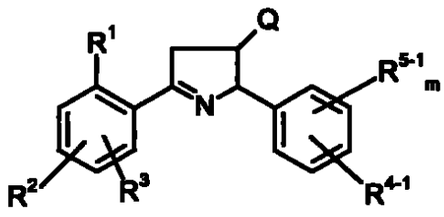
B für p-Phenylen steht,

Z für Sauerstoff oder Schwefel steht,

D für $-CF_3$ steht,

Q für $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-Propyl, $-CO_2$-Isopropyl, $-CO_2$-n-Butyl, $-CO_2$-Isobutyl, $-CO_2$-sec.-Butyl, $-CO_2$-tert.-Butyl, $-CO_2$-n-Pentyl, $-CO_2$-Neopentyl, $-CO_2$-sec.-Isoamyl, $-CO_2$-Pentan-3-yl, $-CO_2$-Cyclopentyl, $-CO_2$-n-Hexyl, $-CO_2$-Cyclohexyl, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-Propyl), -CONH(Isopropyl), -CONH(n-Butyl), -CONH(tert.-Butyl), -CONH(n-Pentyl), -CONH(n-Hexyl), -CONH(Cyclohexyl), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-Propyl})_2$, $-CON(Isopropyl)_2$, $-CON(n\text{-Butyl})_2$, $-CON(n\text{-Pentyl})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-Propyl, -CON(Me)n-Butyl, -CON(Me)n-Pentyl, -CN, Pyrrolidinocarbonyl, Piperidinocarbonyl steht.

6. Δ^1-Pyrroline der Formel (I-n)



(I-a)

in welcher

R^1, R^2, R^3, Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

R^{4-1} für A oder B-Z-D

steht, wobei

A, B, Z und D die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

und

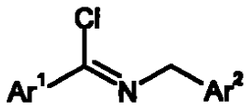
R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Haloalkylaminosulfonyl steht,

wobei

R^6, R^7, R^8 und o die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben.

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet,

A-1.) dass man Iminochloride der Formel (II-a)



(II-a)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



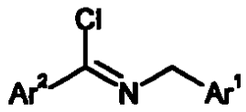
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

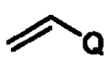
in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

A-2.) dass man Iminochloride der Formel (II-b)



(II-b)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



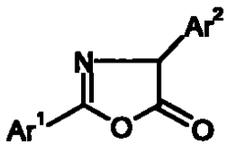
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

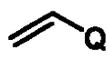
in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

B.) dass man Oxazolinone der Formel (IV)



(IV)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



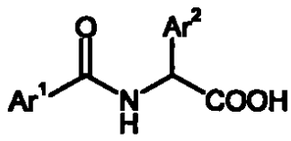
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

C.) dass man Carbonsäuren der Formel (V)



(V)

mit Dipolarophilen der Formel (III)



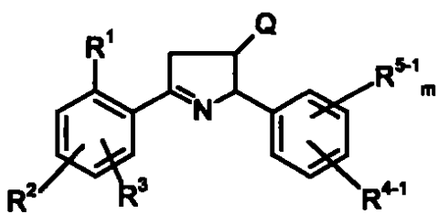
(III)

in welchen

Ar^1, Ar^2, und Q die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart von Essigsäureanhydrid und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt, oder

D.) dass man Δ^1-Pyrroline der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher

R^1, R^2, R^3, Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

R^{4-1} für A oder B-Z-D

steht, wobei

A, B, Z und D die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

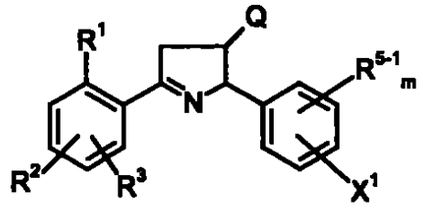
und

R^{5-1} für Fluor, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkyl, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Trialkylsilyl, Alkoxycarbonyl, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, Haloalkylaminosulfonyl steht,

wobei

R^6, R^7, R^8 und o die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man Verbindungen der Formel (I-b)



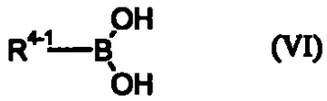
(I-b)

in welcher

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q und m die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebenen Bedeutungen haben und

X^1 für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht

mit Boronsäuren der Formel (VI)



(VI)

in welcher

R^{4-1} die in diesem Anspruch angegebene Bedeutung hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt

oder

dass man Verbindungen der Formel (I-a) erhält, indem man Verbindungen der Formel (I-b)

in welcher

X^1 für 2-(4,4,5,5-Tetramethyl-1,3,2-dioxoborolan) steht

mit (Hetero)cyclen der Formel (VII)



(VII)

in welcher A die in den Ansprüchen 1 bis 5 angegebene Bedeutung hat und

T für Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$ steht,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

8. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

9. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zur Bekämpfung von Schädlingen.

10. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.

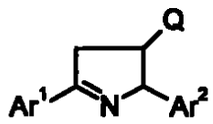
11. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

12. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5 zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln.

Δ^1-Pyrroline

Zusammenfassung

Neue Δ^1-Pyrroline der Formel (I)



(I)

in welcher

Ar^1, Ar^2 und Q die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,

mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen.

REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA.

CERTIFICACION DE PRIORIDAD SOBRE LA PRESENTACION DE UNA SOLICITUD DE PATENTE.

Número de expediente: 100 47 116.1

Fecha de solicitud: 22de Septiembre de 2000

Solicitante/Propietario: Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen/Alemania

Titulo:Δ^1-PIRROLINAS

Clasificación Internacional de Patentes: C 07 D, A 01 N

Las piezas adjuntas son una reproducción fiel y exacta de los documentos originales de esta solicitud de patente.

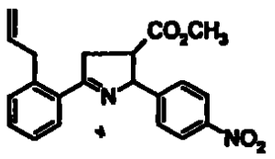
München, a 05 de Julio de 2001
Oficina Alemana de Patentes y Marcas.
El presidente
Firmado por orden: Nietledt.

Hay un sello estampado en seco que dice: Oficina Alemana de Patentes y Marcas.

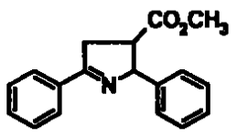
Δ^1-PIRROLINAS

La presente invención se refiere a nuevas Δ^1-pirrolinas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo como agentes pesticidas.

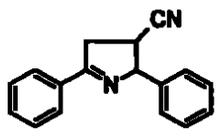
Hasta el presente se han dado a conocer solo algunas 2,5-bis-aril-Δ^1-pirrolinas substituidas:



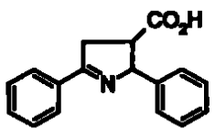
A. Padwa and A. Ku, J. Am. Chem. Soc. 1978, *100*, 2181



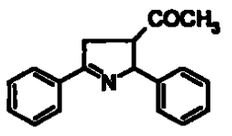
A. Padwa and J. Smolanoff, J. Am. Chem. Soc. 1971, *93*, 548



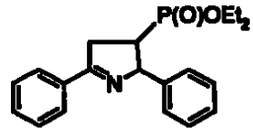
A. Padwa et al, J. Am. Chem. Soc. 1973, *95*, 1945



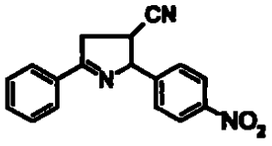
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1970, *103*, 2368



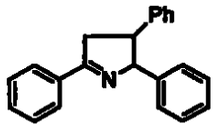
O. Tsuge *et al.*, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347



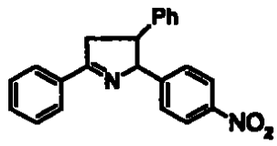
Gakis,N. *et al.*, Helv.Chim. Acta 1976, *68*, 748



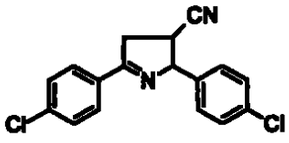
R. Huisgen *et al.*, Chem. Ber. 1972, *105*, 1258



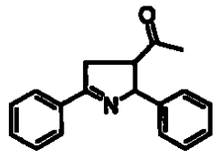
Padwa *et al.*, Tet. Lett. 1972, 4087



Huisgen *et al.*, Tet. Lett. 1968, 3603



A. R. Katritzky *et al.*, Synthesis 1991, *10*, 993



O. Tsuge, Bull. Chem. Soc. Jpn. 1987, *60*, 3347

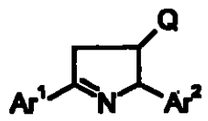
No se conoce nada sobre su conveniencia para el empleo a modo de agentes pesticidas.

En las publicaciones WO 00/21958, WO 99/59968, WO 99/59967 y WO 98/22438 se han descrito otras Δ^1-pirrolinas y su conveniencia como agentes pesticidas.

Sin embargo el nivel de actividad y/o la duración de la actividad de estos compuestos conocidos con anterioridad, especialmente contra determinados organismos y/o con ocasión de bajas concentraciones de aplicación, no son completamente satisfactorios en todos los campos de aplicación.

Debido a la multiplicidad de requisitos exigidos a los agentes pesticidas modernos, por ejemplo en lo que se refiere al nivel de actividad, a la duración de la actividad, al espectro de actividad, al espectro de aplicación, a la toxicidad, a la combinación con otros productos activos, a la combinación con agentes auxiliares de la fórmulación o a la síntesis, y debido a la posible aparición de resistencias no puede considerarse, sin embargo, como concluido el desarrollo de tales productos, y existen permanentemente una elevada necesidad de nuevos compuestos, que tengan ventajas, al menos en lo que se refiere a aspectos parciales, frente a los compuestos conocidos.

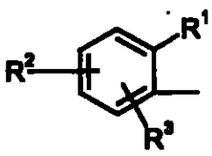
Se han encontrado ahora nuevas Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I)



(I)

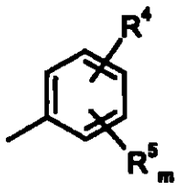
en la que

Ar^1 significa el resto



y

Ar^2 significa el resto



en los que

m significa 0, 1, 2, 3 o 4,

R^1 significa halógeno, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^4 significa halógeno o uno de los agrupamientos siguientes

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalquilsulfoniloxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2-NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, halógenoalquilaminosulfonilo, bisalcoxiborano, $-B(OH)_2$,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_o$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo, o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en caso dado una o varias veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo, substituido en caso dado una o varias veces por restos de la lista W^2, con 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, con uno o varios heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo, halógenoalquenilo, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, halógenoalquileno, halógenoalquenileno,

E significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo, halógenoalquenileno, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

W^1 significa ciano, halógeno, ciano, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi, halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, pentaflúortio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi, halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$,

$-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa hidrógeno, alquilo o halógenoalquilo,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, o conjuntamente significan alquileno,

R^9 significa hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, aralquilo, fenilo,

R^{10} significa alquilo, halógenoalquilo, aralquilo,

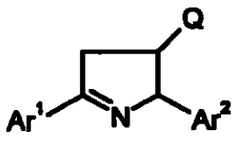
R^{11} significa alquilo, arilo,

R^{12} significa alquilo, halógenoalquilo, aralquilo o arilo,

Los compuestos de la fórmula (I) pueden presentarse en caso dado, en función del tipo y del número de los substituyentes, a modo de isómeros geométricos y/o ópticos o bien a modo de regioisómeros o de sus mezclas isómeras en composición variable. Según la invención se reivindican tanto los isómeros puros como también las mezclas de los isómeros.

Se ha encontrado además que se obtienen los nuevos compuestos de la fórmula (I) según uno de los procedimientos descritos a continuación.

Pueden obtenerse las Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I)



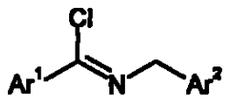
(I)

en la que

Ar^1, Ar^2, y Q tienen los significados anteriormente indicados,

porque

A-1.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-a)



(II-a)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



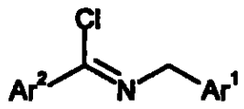
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados anteriormente indicados,

en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

A-2.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-b)



(II-b)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



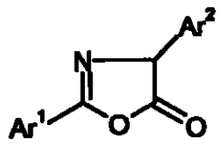
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2, y Q tienen los significados anteriormente indicados,

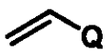
en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

B.) se hacen reaccionar oxazolinonas de la fórmula (IV)



(IV)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



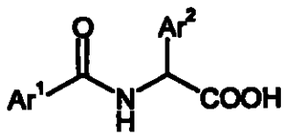
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados anteriormente indicados,

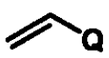
en caso dado en presencia de un diluyente, o porque

C.) se hacen reaccionar ácidos carboxílicos de la fórmula (V)



(V)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



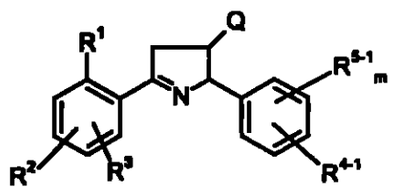
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados anteriormente indicados,

en presencia de anhidrido del ácido acético y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

D.) Pueden obtenerse las Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I-a)



(I-a)

en la que

R^1, R^2, R^3, Q y m tienen los significados anteriormente indicados,

R^{4-1} significas A o B-Z-D

donde

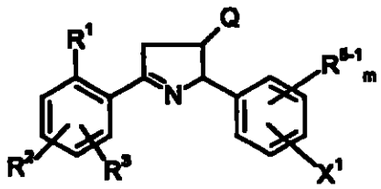
A, B, Z y D tienen los significados anteriormente indicados, y

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, haloalquilaminosulfonilo,

donde

R^6, R^7, R^8 y o tienen los significados anteriormente indicados,

porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (I-b)



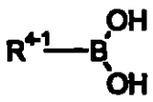
(I-b)

en la que

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q y m tienen los significados anteriormente indicados y

X^1 significa Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$

con ácidos borónicos de la fórmula (VI)



(VI)

en la que

R^{4-1} tiene el significado anteriormente indicado,

en presencia de un catalizador, y en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido y en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (I-b)

en la que

X^1 significa 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano),

con (hetero)ciclos de la fórmula (VII)

T—A (VII)

en la que A tiene el significado anteriormente indicado y

T significa Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$,

en presencia de un catalizador, y en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado en presencia de un diluyente.

Finalmente se ha encontrado que los compuestos según la invención de la fórmula (I) tienen propiedades insecticidas muy buenas y que puede emplearse tanto en la protección de las plantas, como también en la protección de los materiales para la lucha contra las pestes indeseables, tales como insectos.

Los compuestos según la invención están definidos en general por medio de la fórmula (I). Los substituyentes o bien los intervalos preferentes de los restos indicados en las fórmulas anteriores, y que se indicarán a continuación se explican seguidamente.

Preferentemente,

m significa 0, 1, 2 o 3.

Preferentemente,

R^1 significa halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$,$-NR^7R^8$.

Preferentemente,

R^2 y R^3 significan, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$,$-NR^7R^8$.

Preferentemente,

R^4 significa flúor, cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes, que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E.

Preferentemente,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, tri(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)-sililo, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo, bis(alcoxi con 1 a 6 átomos de

carbono)borano, $-B(OH)_2$.

Preferentemente,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_n$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno.

Preferentemente,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en caso dado una a cuatro veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo con 5 a 10 miembros, que contiene uno o dos anillos aromáticos, substituido en caso dado de una a cuatro veces por restos de la lista W^2, con 1 a 4 heteroátomos, combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre (especialmente tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, tiazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo).

Preferentemente,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1.

Preferentemente,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_n-$.

Preferentemente,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6

átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo.

Preferentemente,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquileno con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo.

Preferentemente,

W^1 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, pentafluórtio, $-S(O)_oR^6$,

$-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

Preferentemente,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

Preferentemente,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4.

Preferentemente,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre.

Preferentemente,

o significa 0, 1 o 2.

Preferentemente,

R^6 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

Preferentemente,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o conjuntamente significan alquileno.

Preferentemente,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo, fenilo.

Preferentemente,

R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo.

Preferentemente,

R^{11} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, fenilo.

Preferentemente,

R^{12} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo o fenilo.

De forma especialmente preferente,

m significa 0, 1 o 2.

De forma especialmente preferente,

R^1 significa flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, o significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^4 significa cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes,

que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E.

De forma especialmente preferente,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, $-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano).

De forma especialmente preferente,

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno.

De forma especialmente preferente,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos respectivamente en caso dado de una hasta tres veces, por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo con 5 a 10 miembros, que contiene 1 o 2 anillos aromáticos, con 1 a 4 heteroátomos, combinados desde 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, desde 0 hasta 2 átomos de oxígeno y desde 0 hasta 2 átomos de azufre, substituidos, en caso dado, de una hasta tres veces, por restos de la lista W^2 (especialmente

tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo).

De forma especialmente preferente,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1.

De forma especialmente preferente,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$.

De forma especialmente preferente,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)aminosulfonilo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono; alquileno con 1 a 6 átomos de carbono o alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro; alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a

6 átomos de carbono)aminosulfonilo, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$.

De forma especialmente preferente,

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, $-OSO_2CF_3$, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-(R^6)=N-O(R^6)$.

De forma especialmente preferente,

n significa 0, 1, 2 o 3.

De forma especialmente preferente,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre (especialmente dihidrodioxazina,

oxazolina, tiazolina, imidazolina, tetrazol).

De forma especialmente preferente,

o significa 0, 1 o 2.

De forma especialmente preferente,

R^6 significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o significa metilo o etilo substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, o conjuntamente significan alquileno con 4 a 5 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro, bencilo o fenilo.

De forma especialmente preferente,

R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro.

De forma especialmente preferente,

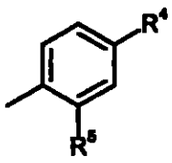
R^{11} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenilo.

De forma especialmente preferente,

R^{12} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro.

De forma muy especialmente preferente,

Ar^2 significa el resto



De forma muy especialmente preferente,

R^1 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R^4 significa cloro, bromo o significa uno de los agrupamientos siguientes

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E.

De forma muy especialmente preferente,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, hidroxi, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, triflúormetilo, diflúormetoxi, triflúormetoxi, triflúormetiltio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$ o $-SO_2CF_3$.

De forma muy especialmente preferente,

R^5 significa además hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente,

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-$,

$-(CH_2)_2-$, -CH=CH-(E o Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

De forma muy especialmente preferente.

A significa fenilo substituido en caso dado una o dos veces, por restos de la lista W^1, o significa tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo substituidos respectivamente en caso dado una o dos veces por restos de la lista 2.

De forma muy especialmente preferente.

B significa p-fenileno monosubstituido en caso dado por restos de la lista W^1.

De forma muy especialmente preferente.

Z significa oxígeno, azufre o $-SO_2-$.

De forma muy especialmente preferente.

D significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

De forma muy especialmente preferente.

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E o Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$.

De forma muy especialmente preferente.

E significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$,

$-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$.

De forma muy especialmente preferente,

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi, triflúormetoxi, diflúormetoxi, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$ $-SOCHF_2$, $-SOCF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

De forma muy especialmente preferente,

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc.-butilo, triflúormetilo, triflúormetoxi, diflúormetoxi, triflúormetiltio, $-OSO_2CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe.

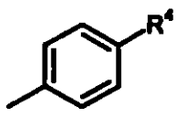
De forma muy especialmente preferente,

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, $-CO_2$-triflúoretilo, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-propilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo), -CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo,

-CON(Me)n-pentilo, -CN, -$PO(OMe)_2$, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo, -$PO(OEt)_2$, -$PO(OPh)_2$, dihidrodioxazinilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, tetrazolilo.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente

Ar^2 significa el resto



Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

R^1 significa flúor o cloro.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

R^2 significa hidrógeno, cloro o flúor.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente

R^4 significa –B-Z-D.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

B significa p-fenileno.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

Z significa oxígeno o azufre.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

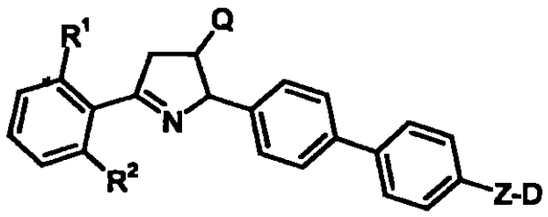
D significa $-CF_3$.

Especialmente, de forma muy especialmente preferente,

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo,$-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo) –CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-

pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), -$CONMe_2$, -$CONEt_2$, -$CON(n\text{-propilo})_2$, -$CON(isopropilo)_2$, -$CON(n\text{-butilo})_2$, -$CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo.

Son especialmente preferentes también los compuestos de la fórmula general (I-c)

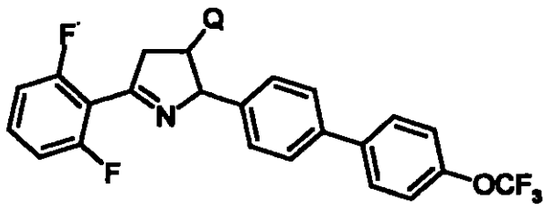


(I-c)

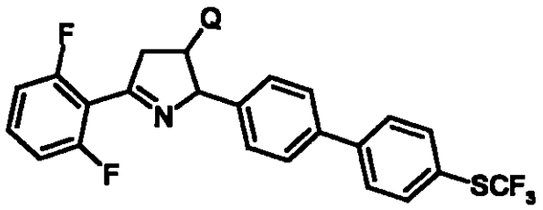
en la que

R^1, R^2, Z, D y Q tienen los significados anteriormente indicados.

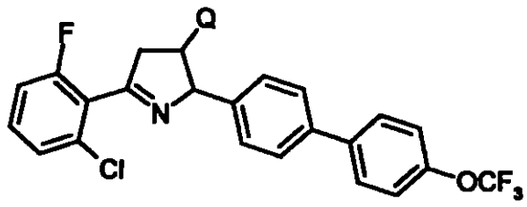
Son especialmente preferentes también los compuestos de las fórmulas generales (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) y (I-i)



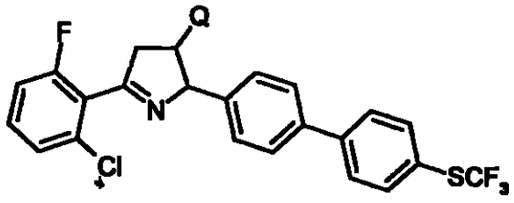
(I-d)



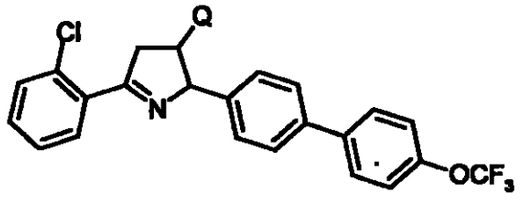
(I-e)



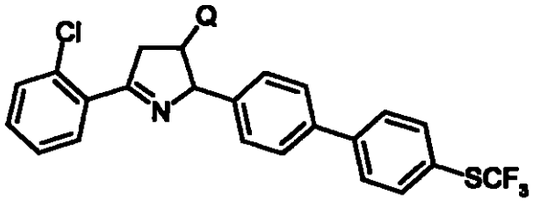
(I-f)



(I-g)



(I-h)



(I-i)

en las que

Q significa $-CO_2R^9$, $-CONHR^8$ o $-CONR^7R^8$,

teniendo R^7, R^8 y R^9 los significados anteriormente indicados.

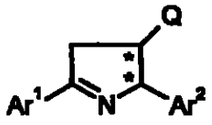
Son especialmente preferentes también los compuestos de las fórmulas generales (I-d), (I-e), (I-f), (I-g), (I-h) y (I-i)

en las que

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo,

CO_2-neopentilo, -CO_2-sec.-isoamilo, -CO_2-pentan-3-ilo, -CO_2-ciclopentilo, -CO_2-n-hexilo, -CO_2-ciclohexilo, -$CONHCH_3$, -$CONHCH_2CH_3$, -CONH-(n-propilo), -CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), -$CONMe_2$, -$CONEt_2$, -$CON(n\text{-propilo})_2$, -$CON(isopropilo)_2$, -$CON(n\text{-butilo})_2$, -$CON(n\text{-pentilo})_2$, CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo.

La fórmula general (I) tiene dos centros de asimetría, marcados en este caso por medio de *



(I)

Son preferentes los compuestos de la fórmula (I), en los cuales los substituyentes Q y Ar^2 se encuentran en posición cis sobre los dos centros quirales.

En las definiciones anteriormente indicadas, oxilalquileno o bien tioalquileno significan –O-alquil- o bien –S-alquil-, verificándose el enlace por ejemplo sobre Ar^2 a través del átomo de oxígeno o bien del átomo de azufre y estando enlazados sobre el resto alquilo en caso dado otros substituyentes tales como, por ejemplo, A en –X-A. Alquilenoxi o bien alquilentio significan –alquilo-O- o bien –alquilo-S-, verificándose el enlace por ejemplo sobre Ar^2 respectivamente a través del resto alquilo y estando enlazados con el átomo de oxígeno o bien de azufre, en caso dado, otros substituyentes tal como, por ejemplo, A en –X-A. Oxialquilenoxi significa –O-alquilo-O.

En la presente descripción heterociclo significa un hidrocarburo cíclico saturado o insaturado, en el cual están intercambiados uno o varios átomos de

carbono por uno o varios heteroátomos. En este caso los heteroátomos significan, preferentemente, O, S, N, P, especialmente significan O. S y N.

Son preferentes, especialmente preferentes o muy especialmente preferentes aquellos compuestos que portan los substituyentes citados de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente.

Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados, tales como alquilo o alquenilo, incluso en combinación con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, pueden ser respectivamente, en tanto en cuanto sea posible, de cadena lineal o de cadena ramificada.

Los restos substituidos en caso dado pueden estar substituidos una o varias veces, pudiendo ser iguales o diferentes los substituyentes en el caso de una polisubstitución.

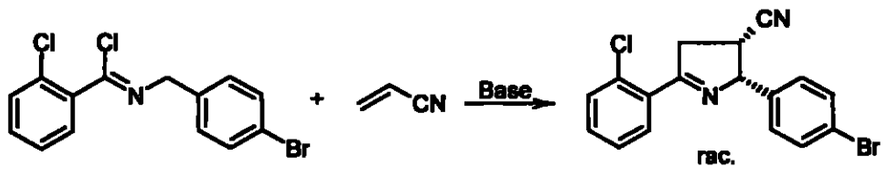
Varios restos con el mismo índice, tal como por ejemplo m restos R^5, con m>1, pueden ser iguales o diferentes.

Los restos substituidos por halógeno, tal como por ejemplo halógenoalquilo, están mono o polihalogenados. En el caso de una polihalogenación, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. En este caso halógeno significa flúor, cloro, bromo y yodo, especialmente significa flúor, cloro y bromo.

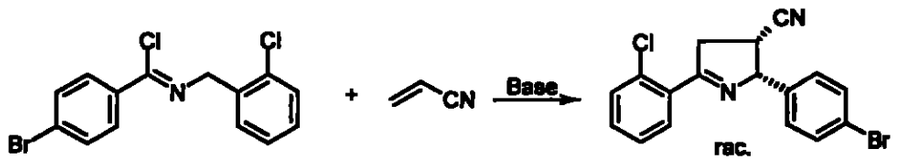
Las definiciones de los restos o bien las explicaciones indicadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes, pueden combinarse sin embargo arbitrariamente entre sí, es decir entre los intervalos y los intervalos preferentes respectivos. Estas son válidas para los productos finales así como, de manera correspondiente, para los productos de partida y para los productos intermedios.

Si se emplean, el cloruro de N-(4-bromobencil)-2-clorofenil-carboximidoilo y el acrilonitrilo como productos de partida podrá representarse el desarrollo del

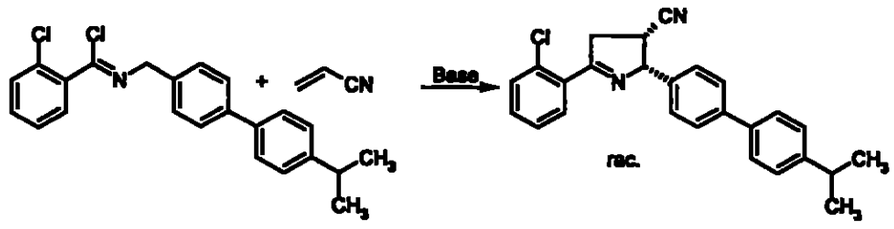
procedimiento (A-1) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Si se emplean el cloruro de N-(2-clorobencil)-4-bromofenil-carboximidoilo y el acrilonitrilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (A-2) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

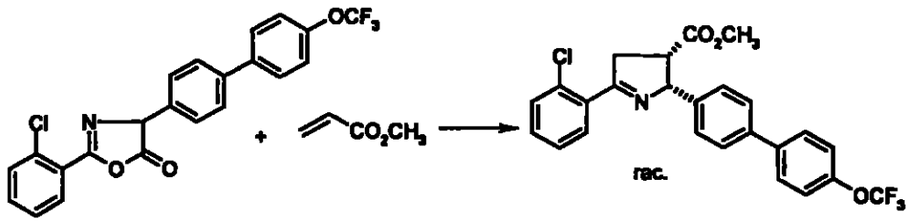


Si se emplean el cloruro de 2-cloro-N-[(4'-isopropil-1,1'-bifenil-4-il)metil]benzocarboximidoilo y acrilonitrilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (A-1) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

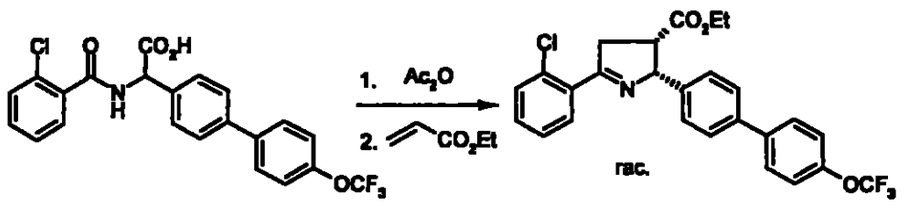


Si se emplean, la 2-(2'-clorobencil)-4-[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil]oxazolidin-5-ona y el acrilato de metilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (B) según la invención por medio del

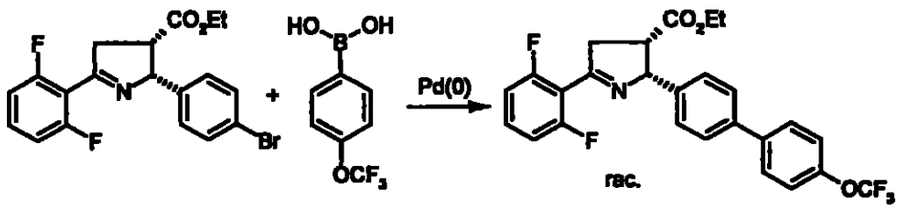
esquema de fórmulas siguiente.



Si se emplean la N-(2-clorobenzoil)-2-[(4'-triflúormetoxi)bifenil]glicina y el anhidrido del ácido acético y el acrilato de etilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (C) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

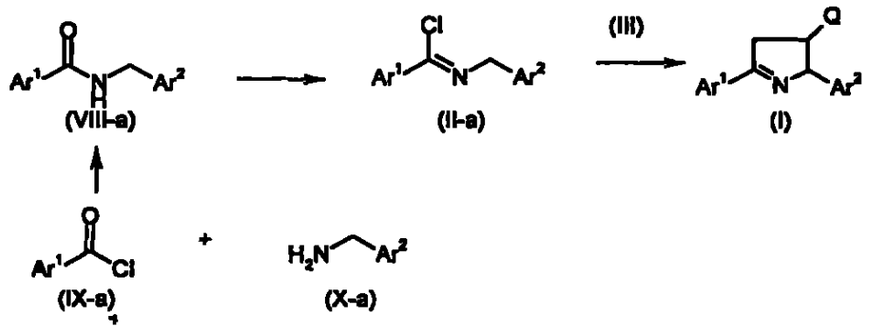


Si se emplean el 2-(4-bromofenil)-5-(2,6-diflúorfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrolo-3-carboxilato de etilo y el ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (D) por medio del esquema de fórmulas siguiente

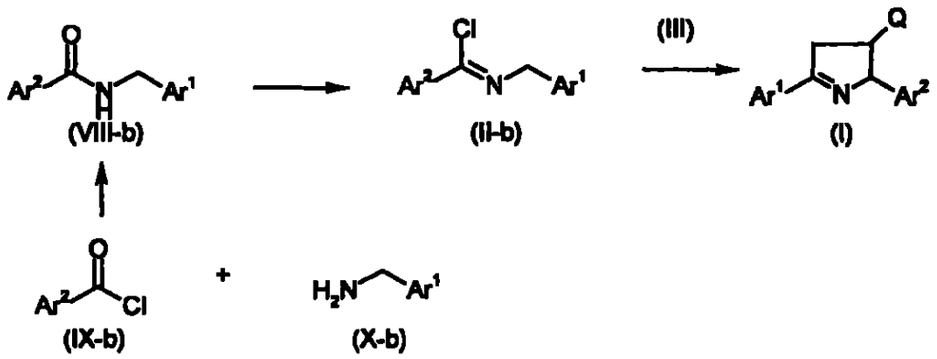


Explicaciones de los procedimientos y de los productos intermedios:

Procedimiento (A-1).



Procedimiento (A-2).



Los iminocloruros, necesarios como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la invención, están definidos en general por medio de las fórmulas (II-a) y (IIb). En estas fórmulas Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc., aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc., en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los iminocloruros de las fórmulas (II-a) y (II-b), necesarios como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la

invención, pueden prepararse por reacción de amidas de las fórmulas (VIII-a) y (VIII-b) con un reactivo de cloración (por ejemplo $SOCl_2$) en presencia de un diluyente. (Para otros métodos véase la publicación "The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond", en Patai, Interscience, New York. 12070, páginas 597-662).

Las amidas, necesarias como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la invención, están definidas en general por medio de las fórmulas (VIII-a) y (VIII-b). En estas fórmulas Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc. con relación a la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Las amidas de las fórmulas (VIII-a) y (VIII-b) pueden prepararse por ejemplo mediante reacción de cloruros de acilo de las fórmulas (IX-a) y (IX-b) con bencilaminas de las fórmulas (X-a) y (X-b) en presencia de una base (por ejemplo Et_3N o NaOH) y en presencia de un diluyente.

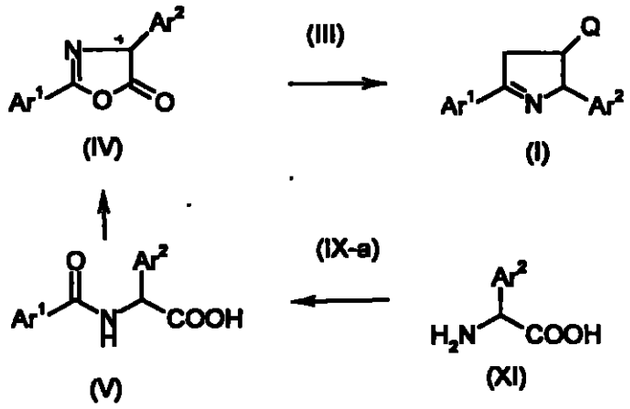
Los cloruros de acilo y las bencilaminas necesarios como productos de partida para la realización de los procedimientos (A-1) y (A-2) según la invención, están definidas en general por medio de las fórmulas (IX-a) y (IX-b) o bien por medio de las fórmulas (X-a) y (X-b). En estas fórmulas Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, como especialmente preferentes, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los cloruros de acilo de las fórmulas (IX-a) y (IX-b) son conocidos en general. Las bencilaminas de las fórmulas (X-a) y (X-b) son parcialmente conocidas, pero pueden prepararse a partir de los nitrilos o bien de los aldehidos

correspondientes según métodos conocidos (reducción o bien aminación reductora) (véase por ejemplo la publicación Vogel's Textbook Of Practical Organic Chemistry, Fifth Edition 1989, John Wiley and Sons, New York, autor: Vogel, Arthur, Israel; revisado por Furniss, Hannaford, Smith, and Tatchell, ISBN 0-582-46236-3).

Los compuestos de la fórmula (III) (Q = éster, nitrilo, cetona, amida, éster fosfórico, sulfona) son conocidos en general o bien pueden obtenerse en el comercio.

Procedimiento (B).



Las oxazolidinonas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (B) según la invención, están definidas en general por medio de la formula (IV). En esta fórmula Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc., aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

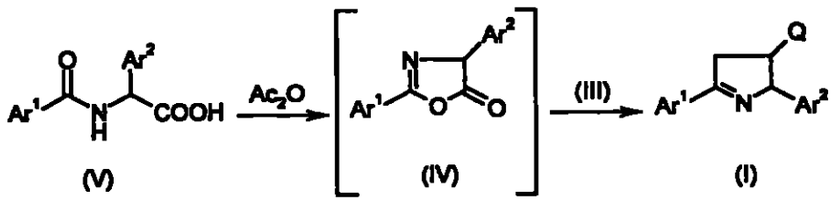
Las oxazolidinonas de la fórmula (IV), necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (B) según la invención pueden prepararse de manea análoga a la de los ejemplos conocidos por la literatura, a partir de los N-benzoil-aminoácidos de la fórmula (V). Las oxazolidinonas de la fórmula (IV) se hacen reaccionar a continuación con dipolarofilos de la fórmula (III) (véanse por

ejemplo la publicación Chem. Ber. 1970, **103**, 2368-2387, y la literatura allí citada).

Los N-benzoil-aminoácidos, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (B) según la invención, están definidos en general por medio de la fórmula (V). En esta fórmula Ar^1 y Ar^2 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, especialmente preferentes, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los compuestos de la fórmula (V) pueden obtenerse a partir de derivados de aminoácidos de la fórmula (XI) mediante reacción de cloruros de acilo de la fórmula (IX-a) en presencia de una base y de un diluyente. Los aminoácidos de la fórmula (XI) pueden obtenerse, en parte, en el comercio y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos. Véase por ejemplo la publicación Tetrahedron 1994, **50**, 1539-1650 y la literatura allí citada).

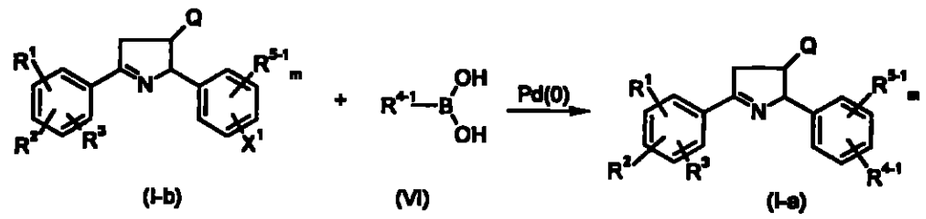
Procedimiento (C)



(V) (IV) (I)

Los N-benzoil-aminoácidos de la fórmula (V) pueden hacerse reaccionar también según una reacción tandem para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. En este caso se preparan *in situ* las oxazolidinonas de la fórmula (IV) a partir de compuestos de la fórmula (V) y de anhidrido del ácido acético (véase por ejemplo la publicación Chem. Ber. 1970, 103, 2368-2387) y a continuación se hacen reaccionar según el procedimiento (B) con dipolarofilos de la fórmula (III).

Procedimiento (D).



(I-b) (VI) (I-a)

En el caso en que Ar^2 signifique en el producto activo de la fórmula (I) según la invención un bifenilo, en caso dado substituido, pueden prepararse compuestos de la fórmula (I-a) por copulación de los compuestos de la fórmula (I-b) con ácidos borónicos de la fórmula (VI) en presencia de un catalizador de paladio y en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

En los compuestos de las fórmulas (I-a) o bien (I-b) , R^1, R^2, R^3 y m tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. aquellos significados que ya han sido citados para estos restos de manera preferente, de manera especialmente preferente, etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Preferentemente,

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)-sililo, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo.

De forma especialmente preferente,

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente

por flúor o por cloro, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_nR^6$, $-NR^7R^8$, $NHCO_2R^6$.

De forma muy especialmente preferente,

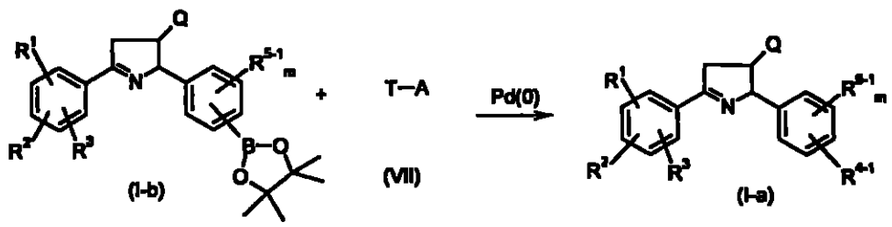
R^{5-1} significa flúor, hidroxi, metilo, etilo, metoxi, etoxi, triflúormetilo, diflúormetoxi, triflúormetoxi, $-OSO_2NMe_2$ o $-SO_2CF_3$.

En los compuestos de la fórmula (I-b), X^1 significa preferentemente cloro, bromo o yodo, de forma especialmente preferente significa cloro o bromo, de forma muy especialmente preferente significa bromo.

En los compuestos de las fórmulas (I-a) y (VI), R^{4-1} significa A o –B-Z-D. En este caso A, B, Z y D tienen preferentemente, de forma especialmente preferente, etc., aquellos significados que ya han sido citados para estos restos de manera preferente, de manera especialmente preferente, etc., en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los compuestos de la fórmula (I-b) se preparan por medio de los procedimientos A, B o C. Los ácidos borónicos de la fórmula (VI) son parcialmente conocidos, pero sin embargo pueden prepararse también a partir de (bromo)aromatos mediante clitiación o bien intercambio Br-Li (Mg) y a continuación reacción con compuestos de trisalcoxiboro (véase por ejemplo la publicación Tetrahedron Lett. 1993, 34, 8237-8240).

Además pueden prepararse los compuestos de la fórmula (Ia) a partir de compuestos de las fórmula (I-b) [X^1 = 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,33,2-dioxoborolano] y (hetero)ciclos de la fórmula (VII) de manera análoga a la de los métodos conocidos por la literatura (J. Org. Chem. 1995, 60, 7508 Tetrahedron Lett. 1997, 38,3841).



En los (hetero)ciclos de la fórmula (VII), T significa preferentemente cloro, bromo o yodo, de forma especialmente preferente significa cloro o bromo, de forma muy especialmente preferente significa cloro. A tiene preferentemente, de forma especialmente preferente, etc. los significados que ya han sido indicados para este resto de manera preferente, de manera especialmente preferente etc. en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Los compuestos de la fórmula (VII) son conocidos o pueden prepararse según procedimientos conocidos.

En la realización del procedimiento (D) según la invención se emplea, en general, un catalizador de paladio, que puede utilizarse, a su vez, con o sin adición de otros ligandos. Preferentemente se emplean a modo de catalizadores $PdCl_2$(dppf) [dppf = 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno], $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$, $PdCl_2(CH_3CN)_2$, $Pd_2(dba)_3$ [dba = dibencilidenacetona] o $Pd(OAc)_2$, de forma especialmente preferente $PdCl_2$(dppf) o $Pd(PPh_3)_4$, $PdCl_2(PPh_3)_2$ o $Pd(OAc)_2$, de forma muy especialmente preferente $PdCl_2$(dppf) o $Pd(PPh_3)_4$. Como ligandos entran en consideración triarilfosfinas, trialquilfosfinas o arsinas. Preferentemente se emplean dppf, PPh_3, P(t-Bu)$_3$, Pcy$_3$ o $AsPh_3$, de forma especialmente preferente dppf.

En la realización de los procedimientos según la invención (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) se obtienen compuestos de las fórmulas (I) o bien (I-a), en las cuales Q significa $-CO_2H$, mediante saponificación por ejemplo de los ésteres de metilo correspondientes según procedimientos conocidos (véase la publicación T.W.

Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd edition, p. 232-234).

Como agentes aceptores de ácido entran en consideración, en la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D), según la invención, respectivamente todas las bases inorgánicas y orgánicas usuales para este tipo de reacciones. De manera preferente pueden emplearse hidróxidos de metales alcalinotérreos, o hidróxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de calcio, hidróxido de potasio así como también hidróxido de amonio, carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) o diazabicicloundeceno (DBU). Sin embargo es posible trabajar también sin agente aceptor de ácido adicional, o emplear el aminocomponente en un exceso tal que actúe simultáneamente a modo de agente aceptor de ácido.

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos usuales inertes. Preferentemente pueden emplearse hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diiso-propiléter, metil-t-butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propioni-trilo, n- o i-

butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfósforo-triamida; ésteres tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido o sulfolano tal como sulfolano.

En la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) según la invención las temperaturas de la reacción pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 140°C, preferentemente entre 10°C y 120°C.

En la realización de los procedimientos (A-1), (A-2), (B), (C) y (D) según la invención se trabaja, en general, respectivamente, bajo presión atmosférica. No obstante es posible también trabajar respectivamente bajo presión mas elevada o a presión mas reducida.

En la realización del procedimiento (A-1) o (A-2) según la invención se emplean, sobre 1 mol de iminocloruro de las fórmulas (II-a) o (II-b), en general, 2 moles de dipolarofilo de la fórmula (III) así como desde 1 hasta 3 moles de agente aceptor de ácido. No obstante es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se extrae, se lava, se seca y el residuo se libera de impurezas eventualmente presentes todavía en caso dado según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

En la realización del procedimiento (B) según la invención se emplean, sobre 1 mol de oxazolinona de la fórmula (IV), en general 2 moles de dipolarofilo de la fórmula (III). No obstante es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se extrae, se lava, se seca y el residuo se libera en caso dado de las impurezas eventualmente

presentes todavía según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

En la realización del procedimiento (C) según la invención se emplean, sobre 1 mol de ácido carboxílico de la fórmula (V), en general 2 moles de dipolarofilo de la fórmula (III), así como de 1 a 3 moles de anhidrido del ácido acético. No obstante es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se extrae, se lava, se seca y el residuo se libera en caso dado de las impurezas eventualmente presentes todavía en caso dado según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

En la realización del procedimiento (D) según la invención se emplean, sobre 1 mol del compuesto de la fórmula (I), en general 1 mol de dipolarofilo de la fórmula (III) o también un exceso del mismo, así como de 1 hasta 5 moles de agente aceptor de ácido y 1/20 moles de catalizador. No obstante es posible también emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera que la mezcla de la reacción se distribuye entre agua y metil-terc.-butiléter, la fase orgánica se seca sobre sulfato de sodio y el residuo se libera en caso dado de las impurezas eventualmente presentes todavía según métodos usuales, tales como cromatografía o recristalización.

Los productos activos son adecuados para la lucha contra las pestes animales, preferentemente contra insectos, arácnidos y nematodos, que se presentan en agricultura, en la salud de los animales, en selvicultura, para la protección de productos almacenados y de materiales así como en el sector de la higiene. Son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes así como contra todos o algunos de los estadios del desarrollo. A las pestes anteriormente citadas pertenecen:

Del orden de los isópodos por ejemplo, Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, Blaniulus guttulatus.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, Geophilus carpophagus, Scutigera spp..

Del orden de los sinfilos, por ejemplo, Scutigerella immaculata.

Del orden de los tisánuros, por ejemplo, Lepisma saccharina.

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, Onychiurus armatus.

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus spp., Schistocerca gregaria.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blatella germanica,

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, Forficula auricularia.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, Reticulitermes spp..

Del orden de los ftirapteros, por ejemplo Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp., Trichodectes spp., Damalinia spp..

Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci, Thrips palmi, Fankliniella accidentalis..

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp..

Del orden de los homópteros, por ejemplo, Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Aphis fabae, Aphis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodephax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella

aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp..

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella xylostella, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Mamestra brassicae, Panolis flammea, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana, Cnaphalocerus spp., Oulema oryzae.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus..

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp..

Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomya spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys

spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

Del orden de los sifonópteros, por ejemplo, Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

Del orden de los arácnidos, por ejemplo, Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophys ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hylamma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

A los nematodos parasitantes de las plantas pertenecen, por ejemplo, Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

Los compuestos según la invención, de la fórmula (I), se caracterizan, especialmente, por un excelente efecto contra orugas, larvas de escarabajos, arañuelas, piojos de las hojas y moscas minadoras.

Los productos según la invención, de la fórmula (I), se caracterizan, especialmente, de una manera muy especial, por un excelente efecto contra larvas del escarabajo de la hoja del rábano rusticano (Phaedon cochleariae), contra las orugas de la polilla noctuela (Spodoptera frugiperda), contra larvas de la cigarra verde del arroz (Nephotettix cinticeps), contra los piojos de la hoja del duraznero (Myzus persicae) y contra todos los estadios de la arañuela roja común (Tetranychus urticae).

Los compuestos según la invención pueden emplearse en caso dado, en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación, también como

herbicidas y microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos y bactericidas. Pueden emplearse en caso dado también como productos intermedios o como productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo de forma directa o por acción sobre el medio ambiente, el biotopo o el recinto de almacenamiento según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

Los productos activos según la invención pueden transformarse en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos inyectables, suspensiones, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados,

concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como microencapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo mediante mezclado de los productos activos con extendedores, es decir, con disolventes líquidos, es decir disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

Cuando se emplea agua como extendedor, se pueden utilizar disolventes orgánicos, por ejemplo, como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración preferentemente: los hidrocarburos aromáticos. tales como xileno, tolueno o alquilnaftalinas, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o las parafinas, por ejemplo las fracciones de petróleo, los alcoholes tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, o los disolventes fuertemente polares, tales como la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración:
por ejemplo sales de amonio y harinas minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatoméas y los minerales sintéticos molturados, tal como ácido silícico altamente dispersado, el óxido de aluminio y silicatos; como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo los minerales naturales quebrados y fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita, así como los granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y granulados de material orgánico, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco;

como emulsionantes y/o espumantes entran en consideración: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como los ésteres polioxietilenados de los ácidos grasos, los éteres polioxietilenados de los alcoholes grasos, por ejemplo, el alquilarilpoliglicoléter, los alquilsulfonatos, los alquilsulfatos, los arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina;

como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, las lejías sulfíticas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulares o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálicos así como nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, en general, entre 0,1 y 95 % en peso, preferentemente entre 0,5 y 90 % de producto activo.

Los productos activos según la invención pueden presentarse en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezcla con otros productos activos, tales como insecticidas, cebos, esterilizantes, acaricidas, nematicidas, fungicidas, productos reguladores del crecimiento o herbicidas. A los insecticidas pertenecen por ejemplo ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, ésteres del ácido carbónico, hidrocarburos clorados, fenilureas, productos preparados por medio de microorganismos y similares.

Como componentes de mezcla entran en consideración, por ejemplo, los

compuestos siguientes:

Fungicidas:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-potasio, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Bonodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutilo, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticdiin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat, polisulfuro de calcio, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazin, Carboxin, Carvon, Chinomethionat(Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozycalon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etriadiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentihidroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusalfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminio, Fosetyl-sodio, Ftalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Fumametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumercyclos,

Guazatin,

Hexachlorobenceno, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadincalesilat, Iminoctadinetriacetato, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-metilo, preparaciones de cobre, tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, Oxina de cobre y mezcla de Boerdeaux,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanyipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfoxax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

dimetilditiocarbamato de níquel, Nitrothal-isopropilo, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolilnicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, , Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazole, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-sodio, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

Quinconazol, Quintozcen (PCNB),

Azufre y preparaciones de azufre,

Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Tthiophanate-metilo, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-metilo, Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutanil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram así como

Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,

α-(1,1-dimetiletil)-β-(2-fenoxietil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

α-(2,4-diclorofenil)-β-flúor-b-propil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

α-(2,4-diclorofenil)-β-metoxi-a-metil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

α-(5-metil-1,3-dioxan-5-il)-β-[[4-(triflúormetil)-fenil]-metilen]-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,

(5RS,6RS)-6-hidroxi-2,2,7,7-tetrametil-5-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-3-octanona,

(E)-α-(metoxiimino)-N-metil-2-fenoxi-fenilacetamida,

carbamidato de {2-metil-1-[[[1-(4-metilfenil)-etil]-amino]-carbonil]-propil}-1-isopropilo,

1-(2,4-diclorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-etanon-O-(fenilmetil)-oxima,

1-(2-metil-1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona,

1-(3,5-diclorofenil)-3-(2-propenil)-2,5-pirrolidindiona,

1-[(diyodometil)-sulfonil]-4-metil-benceno,

1-[[2-(2,4-diclorofenil)-1,3-dioxolan-2-il]-metil]-1H-imidazol,

1-[[2-(4-clorofenil)-3-feniloxiranil]-metil]-1H-1,2,4-triazol,

1-[1-[2-[(2,4-diclorofenil)-metoxi]-fenil]-etenil]-1H-imidazol,

1-metil-5-nonil-2-(fenilmetil)-3-pirrolidinol,

2',6'-dibromo-2-metil-4'-triflúormetoxi-4'-triflúor-metil-1,3-tiazol-5-carboxanilida,

2,2-dicloro-N-[1-(4-clorofenil)-etil]-1-etil-3-metil-ciclo-propanocarboxamida,

2,6-dicloro-5-(metiltio)-4-pirimidinil-tiocianato,

2,6-dicloro-N-(4-triflúormetilbencil)-benzamida,

2,6-dicloro-N-[[4-(triflúormetil)-fenil]-metil]-benzamida,

2-(2,3,3-triyodo-2-propenil)-2H-tetrazol,

2-[(1-metiletil)-sulfonil]-5-(triclorometil)-1,3,4-tiadiazol,

2-[[6-deoxi-4-O-(4-O-metil-β-D-glicopiranosil)-a-D-glucopi-ranosil]-amino]-4-metoxi-1H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-5-carbonitrilo,

2-aminobutano,

2-bromo-2-(bromometil)-pentandinitrilo,

2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida,

2-cloro-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(isotiocianatometil)-acetamida,

2-fenilfenol(OPP),

3,4-dicloro-1-[4-(diflúormetoxi)-fenil]-1H-pirrol-2,5-diona,

3,5-dicloro-N-[cian[(1-metil-2-propinil)-oxi]-metil]-benzamida,

3-(1,1-dimetilpropil)-1-oxo-1H-inden-2-carbonitrilo,

3-[2-(4-clorofenil)-5-etoxi-3-isoxazolidinil]-piridina,

4-cloro-2-cian-N,N-dimetil-5-(4-metilfenil)-1H-imidazol-1-sulfonamida,

4-metil-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-ona,

8-(1,1-dimetiletil)-N-etil-N-propil-1,4-dioxaspiro[4,5]decan-2-metanamina,

8-hidroxiquinolinsulfato,

2-[(fenilamino)-carbonil]-hidrazida del ácido 9H-xanten-9-carboxílico,

bis-(1-metiletil)-3-metil-4-[(3-metilbenzoil)-oxi]-2,5-tio-fendicarboxilato,

cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol,

hidrocloruro de cis-4-[3-[4-(1,1-dimetilpropil)-fenil-2-metilpropil]-2,6-dimetil-morfolina,

etil-[(4-clorofenil)-azo]-cianoacetato,

bicarbonato de potasio,

Methantetrathiol-sal sódica,

metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imida-zol-5-carboxilato,

metil-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(5-isoxazolilcarbonil)-DL-alaninato,

metil-N-(cloroacetil)-N-(2,6-dimetilfenil)-DL-alaninato,

N-(2,3-dicloro-4-hidroxifenil)-1-metil-ciclohexancarboxamida,

N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-fura-nil)-acetamida,

N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-N-(tetrahidro-2-oxo-3-tienil)-acetamida,

N-(2-cloro-4-nitrofenil)-4-metil-3-nitro-bencenosulfonamida,

N-(4-ciclohexilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-pirimidinamina,

N-(4-hexilfenil)-1,4,5,6-tetrahidro-2-pirimidinamina,

N-(5-cloro-2-metilfenil)-2-metoxi-N-(2-oxo-3-oxazolidinil)-acetamida,

N-(6-metoxi)-3-piridinil)-ciclopropancarboxamida,

N-[2,2,2-tricloro-1-[(cloroacetil)-amino]-etil]-benzamida,

N-[3-cloro-4,5-bis-(2-propiniloxi)-fenil]-N'-metoxi-metan-imidamida,

N-formil-N-hidroxi-DL-alanina, sal sódica

O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforamidotioato,

O-metil-S-fenil-fenilpropilfosforamidotioato,

S-metil-1,2,3-benzotiadiazol-7-carbotioato,

spiro[2H]-1-benzopiran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-ona,

Bactericidas:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin, Octhilinon, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas/Acaricidas/Nematicidas:

Abamectin, Acephat, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, bacillus thuringiensis, Baculovirus, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, , BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxin, Butylpiridaben,

Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron,

Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine. Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-metilo, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodio, Dofenapyn,

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopfthora spp., Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Ethofenprox, Etoxazole, Etrimphos,

Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxido, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,

Granulosevirus,

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

Imidacloprid, Isazophos, Isofenphos, Isoxathion, Ivemectin,

Poliedrovirus nucleares,

Lamda-cyhalothrin, Lufenuron,

Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenizide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, Monocrotophos,

Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron,

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M,

Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalon, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyrachlophos,

Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxifen, Quinalphos.

Ribavirin,

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos,

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermetrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hidrógeno oxalato, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii,

YI 5302,

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos,

(1R-cis)-[5-(fenilmetil)-3-furanil]-metil-3-[(dihidro-2-oxo-3(2H)-furaniliden)-metil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato

(3-fenoxifenil)-metil-2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato

1-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]tetrahidro-3,5-dimetil-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imina

2-(2-cloro-6-fluorfenil)-4-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]-4,5-dihidro-oxazol

2-(acetiloxi)-3-dodecil-1,4-naftalindiona

2-cloro-N-[[[4-(1-feniletoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida

2-cloro-N-[[[4-(2,2-dicloro-1,1-difluoretoxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida

3-metilfenil-propilcarbamato

4-[4-(4-etoxifenil)-4-metilpentil]-1-fluor-2-fenoxi-benceno

4-cloro-2-(1,1-dimetiletil)-5-[[2-(2,6-dimetil-4-fenoxifenoxi)etil]tio]-3(2H)-piridazinona

4-cloro-2-(2-cloro-2-metilpropil)-5-[(6-yodo-3-piridinil)metoxi]-3(2H)-piridazinona

4-cloro-5-[(6-cloro-3-piridinil)metoxi]-2-(3,4-diclorofenil)-3(2H)-piridazinona

Bacillus thuringiensis cepa EG-2348

[2-benzoil-1-(1,1-dimetil)-hidrazida del ácido benzoico

butanoato de 2,2-dimetil-3-(2,4-diclorofenil)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo

[3-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2-tiazolidiniliden]-cianamida

dihidro-2-(nitrometilen)-2H-1,3-tiazina-3(4H)-carboxaldehido

etil-[2-[[1,6-dihidro-6-oxo-1-(fenilmetil)-4-piridazinil]oxi]etil]-carbamato

N-(3,4,4-trifluor-1-oxo-3-butenil)-glicina

N-(4-clorofenil)-3-[4-(difluormetoxi)fenil]-4,5-dihidro-4-fenil-1H-pirazol-1-carboxamida

N-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]-N'-metil-N"-nitroguanida

N-metil-N'-(1-metil -2-propenil)-1,2-hidrazindicarbotioamida

N-metil-N'-2-propenil-1,2-hidrazindicarbotioamida

O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforoamidotioato,

También es posible una mezcla con otros productos activos conocidos, tales como herbicidas o con abonos y reguladores del crecimiento.

Los productos activos según la invención pueden presentarse además, cuando se utilizan como insecticidas, en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con sinérgicos. Los sinérgicos son los compuestos mediante los cuales se aumenta el efecto de los productos activos, sin que el sinérgico agregado tenga que ser activo en si mismo.

El contenido en producto activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el comercio puede variar dentro de amplios límites. La concentración de producto activo de las formas de aplicación puede encontrarse entre 0,0000001 hasta 95 % en peso de producto activo preferentemente entre 0,0001 y 1 % en peso.

La aplicación se lleva a cabo de una manera adaptada a las formas de aplicación.

En el empleo contra las pestes de la higiene y de los productos almacenados se caracterizan los productos activos por un efecto residual excelente sobre madera y arcilla así como por la buena estabilidad a los álcalis sobre soportes encalados.

Los productos activos según la invención no solamente son activos contra las pestes de las plantas, de la higiene y de los productos almacenados, sino también en el sector de la medicina veterinaria contra parásitos de los animales (ectoparásitos) tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros migratorios, moscas (chupadoras y picadoras), larvas parasitantes de moscas, piojos, liendres del cabello, liendres de las plumas y pulgas. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los anopluros, por ejemplo Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Del orden de los malofagidos y de los sub-ordenes amblicerinos así como isqunocerinos, por ejemplo Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

Del orden de los dípteros y de los sub-órdenes nematocerinos así como braquicerinos, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomya spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomya spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypodema spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Del orden de los sifonapteridos, por ejemplo Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Del orden de los heteropteridos, por ejemplo Cimex spp., Triatoma spp.,

Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Del orden de los blataridos, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blatella germanica, Supella spp..

De las sub-clase de los ácaros (Acarida) y del orden de los meta- así como mesoestigmatos, por ejemplo Argas spp., Ornithodorus spp., Otabius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

Del orden de los actinedidos (Prostigmata) y acaridídos (Astigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psoresgates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

De manera ejemplificativa muestran una actividad excelente contra los estadios larvarios de la mosca *Lucilia cuprina* y contra todos los estadios de desarrollo de garrapatas *Amblyomma variegatum*.

Los productos activos según la invención, de la fórmula (I), son adecuados también para la lucha contra los artrópodos, que atacan a los animales útiles en agricultura tales como, por ejemplo, vacas, corderos, cabras, caballos, chanchos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, demás animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros de salón, peces de acuario así como a los denominados animales de ensayo, tales como, por ejemplo, hámster, conejillos de Indias, ratas y ratones. Mediante la lucha contra estos artrópodos se evitaran casos de fallecimiento y reducciones de la productividad (en leche, carne, lana, pieles, huevos, miel, etc), de manera que, mediante el empleo de los productos activos

según la invención, es posible un mantenimiento de los animales mas económico y mas sencillo.

La aplicación de los productos activos según la invención se lleva a cabo en el sector de la veterinaria de forma conocida mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, tabletas, cápsulas, bebidas, grageas, granulados, pastas, bolis, por medio del procedimiento a través de la comida "feed-through", de supositorios, mediante administración parenteral, tal como, por ejemplo, mediante inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantatos, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dermal en forma, por ejemplo de inmersión o de baño (Dippen), pulverizado (Spray), regado superficial (Pour-on y Spot-on), de lavado, de empolvado así como con ayuda de cuerpos moldeados que contengan el producto activo tales como collarines, marcas para las orejas, marcas para el rabo, bandas para las extremidades, cabestros, dispositivos de marcado, etc.

Cuando se emplean para ganado doméstico, aves, animales domésticos etc. pueden emplearse los productos activos de la fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, agentes capaces de extenderse), que contengan los productos activos en cantidades de 1 a 80 % en peso, directamente o tras dilución de 100 hasta 10.000 veces o pueden emplearse a modo de baño químico.

Además se ha encontrado que los productos activos según la invención muestran un elevado efecto insecticida contra insectos, que destruyen los materiales industriales.

De manera ejemplificativa y preferente - sin embargo sin carácter limitativo - pueden citarse los insectos siguientes:

Escarabajos, tales como

Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium

carpine, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis; Xyleborus spec., Tryptodendron spec., Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec., Dinoderus minutos.

Himenópteros, tales como

Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.

Termitas, tales como

Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus.

Tisanuros, tal como Lepisma saccarina.

Por materiales industriales se entenderán en el contexto presente materiales no-vivos, tales como, preferentemente, materiales sintéticos, pegamentos, colas, papel y cartón, cuero, madera y productos de elaboración de la madera y pinturas.

De una manera muy especial, los materiales a ser protegidos contra el ataque de los insectos están constituidos por madera y productos de elaboración de la madera.

Por madera y productos de elaboración de la madera, que pueden ser protegidos por medio de los agentes según la invención o de las mezclas que los contengan, deberá entenderse, por ejemplo:

madera para la construcción, vigas de madera, traviesas para ferrocarril, piezas para puentes, costillas para barcas, vehículos de madera, cajas, paletas, contenedores, postes telefónicos, revestimientos de madera, ventanas y puertas de madera, contrachapado de madera, placas de contrachapado, trabajos de carpintería o productos de madera, que encuentran aplicación, de una manera muy general, en el hogar o en la industria de la construcción.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de concentrados

o de formulaciones usuales en general tales como polvos, granulados, soluciones, suspensiones, emulsiones o pastas.

Las citadas formulaciones puede prepararse en forma en si conocida, por ejemplo por mezclado de los productos activos con al menos un disolvente o bien diluyente, emulsionante, dispersantes y/o aglutinante o agente de fijación, repelente del agua, en caso dado secantes y estabilizantes contra los UV y, en caso dado, colorantes y pigmentos así como otros agentes auxiliares de elaboración.

Los agentes o concentrados insecticidas a ser empleados para la protección de la madera y de los materiales de madera, contienen el producto activo según la invención en una concentración de 0,0001 hasta 95 % en peso, especialmente de 0,001 hasta 60 % en peso.

Las cantidades de los agentes o bien de los concentrados empleados dependen del tipo y del origen de los insectos y del medio. Las cantidades de aplicación óptimas pueden determinarse respectivamente por medio de series de ensayos previamente a la aplicación. En general sin embargo es suficiente con emplear de 0,0001 hasta 20 % en peso, preferentemente de 0,001 hasta 10 % en peso del producto activo, referido al material a ser protegido.

Como disolvente y/o diluyente sirve un disolvente o una mezcla de disolventes órgano-químicos y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos, oleaginosos o tipo oleaginoso, difícilmente volátiles y/o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos polares y/o agua y, en caso dado un emulsionante y/o humectante.

Como disolventes órgano-químicos se emplearán, preferentemente, disolventes oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente situado por encima de 45°C. A modo de tales disolventes difícilmente volátiles, insolubles en agua,

oleaginosos o de tipo oleaginoso, se emplearán aceites minerales correspondientes o sus fracciones aromáticas o mezclas de disolventes que contengan aceites minerales, preferentemente bencina para ensayos, petróleo y/o alquilbenceno.

Ventajosamente se emplearán aceites minerales con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, bencina para ensayos con un intervalo de ebullición de 170 hasta 220°C, aceite para husillos con un intervalo de ebullición de 250 hasta 350°C, petróleo o bien hidrocarburos aromáticos con un intervalo de ebullición de 160 hasta 280°C, aceite de terpentina y similares.

En una forma de realización preferente se emplearán hidrocarburos alifáticos líquidos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 210°C o mezcla de elevado punto de ebullición de hidrocarburos aromáticos y alifáticos con un intervalo de ebullición de 180 hasta 220°C y/o aceite para husillos y/o monocloronaftalina, preferentemente α-monocloronaftalina.

Los disolventes orgánicos, difícilmente volátiles, oleaginosos o de tipo oleaginoso, con un índice de evaporación situado por encima de 35 y con un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, pueden substituirse parcialmente por disolventes órgano-químicos ligeros o de volatilidad media, con la condición de que la mezcla de disolventes presente un índice de evaporación situado por encima de 35 y un punto de llama situado por encima de 30°C, preferentemente por encima de 45°C, y que la mezcla insecticida-fungicida sea soluble o emulsionable en esta mezcla de disolventes.

Según una forma de realización preferente se substituirá una parte del disolvente o de la mezcla de disolventes órgano-químicos o un disolvente o mezcla de disolventes órgano-químicos alifáticos, polares. Preferentemente se emplearán disolventes órgano-químicos alifáticos que contengan grupos hidroxilo y/o éster y/o éter, tales como, por ejemplo, glicoléter, ésteres o similares.

Como aglutinantes órgano-químicos se emplearán en el ámbito de la presente invención las resinas sintéticas y/o los aceites secantes de fraguado, en si conocidos, diluibles con agua y/o solubles o dispersables o bien emulsionables en los disolventes órgano-químicos empleados, especialmente aglutinantes constituidos por o que contengan resina acrílica, una resina vinílica, por ejemplo acetato de polivinilo, resina de poliéster, resina de policondensación o de poliadición, resina de poliuretano, resina alquídica o bien resina alquídica modificada, resina fenólica, resina hidrocarbonada tal como resina de indeno-cumarona, resina de silicona, aceites secantes vegetales y/o secantes y/o aglutinantes secantes físicos a base de una resina natural y/o sintética.

La resina sintética, empleada como aglutinante, puede emplearse en forma de una emulsión, dispersión o solución. Como aglutinantes pueden emplearse también betún o substancias bituminosas hasta un 10 % en peso. De manera complementaria pueden emplearse colorantes, pigmentos agentes repelentes del agua, correctores del olor e inhibidores o agentes protectores contra la corrosión en si conocidos, y similares.

Es preferente emplear en el medio o en el concentrado, según la invención, como aglutinante órgano-químico al menos una resina alquídica o bien una resina alquídica modificada y/o un aceite vegetal secante. Preferentemente se emplearán según la invención resinas alquídicas con un contenido en aceite mayor que el 45 % en peso, preferentemente del 50 hasta el 68 % en peso.

El aglutinante citado puede substituirse parcial o totalmente por un agente(mezcla) de fijación o por una plastificante(mezcla). Estos aditivos deben evitar una volatilización de los productos activos así como una cristalización o bien una precipitación. Preferentemente substituyen a un 0,01 hasta un 30 % del aglutinante (referido al 100 % del aglutinante empleado).

Los plastificantes son de la clase química de los ésteres del ácido ftálico tales como ftalato de dibutilo, de dioctilo o de bencilbutilo, ésteres del ácido fosfórico, tal

como el fosfato de tributilo, ésteres del ácido adípico, tal como el adipato de di-(2-etilhexilo), estearatos tales como estearato de butilo o estearato de amilo, oleatos tal como oleato de butilo, éteres de glicerina o glicoléteres de elevado peso molecular, ésteres de glicerina así como ésteres del ácido p-toluenosulfónico.

Los agentes de fijación están basados químicamente en polivinilal-quiléteres tal como el polivinilmetiléter o en cetonas tales como benzofenona, etilen-benzofenona.

Como disolvente o bien diluyente entra en consideración especialmente el agua, en caso dado en mezcla con uno o varios de los disolventes o bien diluyentes, emulsionante y dispersantes órgano-químicos anteriormente citados.

Se consigue una protección especialmente efectiva de la madera mediante los procedimientos de impregnación a escala industrial, por ejemplo procedimientos al vacío, al vacío doble o a presión.

Los agentes listos para su aplicación pueden contener en caso dado otros insecticidas y, en caso dado uno o varios fungicidas.

Como componentes adicionales de la mezcla entran en consideración preferentemente los insecticidas y fungicidas citados en la **WO 94/29 268**. Los compuestos citados en este documento constituyen, expresamente, parte integrante de la presente solicitud.

Como componentes de mezcla muy especialmente preferentes entran en consideración insecticidas, tales como Chlorpyriphos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron y Triflumuron,

así como fungicidas tales como Epoxiconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolylfluanid, 3-yodo-2-propinil-butilcarbamato, N-octil-isotiazolin-3-ona y 4,5-dicloro-N-octilisotiazolin-3-ona.

Al mismo tiempo pueden emplearse los productos activos según la invención para la protección contra la proliferación de organismos sobre objetos, especialmente sobre los cuerpos de buques, tamices, redes, construcciones, instalaciones portuarias e instalaciones de señalización, que entran en contacto con agua de mar o con agua salubre.

La proliferación de organismos debida a Oligochaeten sesiles, tales como tubicideos calcáreos así como debido a los bivalvos y especies del grupo de los lepadomorfos (bellotas de mar), tal como diversos tipos de Lepas y Scalpellum o debido a tipos del grupo de los balanomorfos (percebes), tales como especies de Balanus, o Pollicipes, aumentan la resistencia al rozamiento de los barcos y conduce, como consecuencia de un mayor consumo de energía y además debido a las frecuentes estancias en dique seco, a un claro aumento de los costes de explotación.

Además de la proliferación de organismos debida a las algas, por ejemplo Ectocarpus sp. y Ceramium sp., tiene un significado especial en particular la proliferación de organismos debida a grupos sesiles de entomostráceos, que se agrupan bajo el nombre de Cirripedia (crustáceos cirrípedos).

Se ha encontrado ahora, sorprendentemente, que los productos activos según la invención presentan un efecto antiincrustante (antiproliferación de organismos) excelente

Mediante el empleo de los productos activos según la invención puede desistirse al empleo de metales pesados tales como por ejemplo en los sulfuros de bis(trialquilestaño), laurato de tri-n-butilestaño, cloruro de tri-n-butilestaño, óxido cuproso (I), cloruro de trietilestaño, tri-n-butil-(2-fenil-4-clorofenoxi)-estaño, óxido de tributilestaño, disulfuro de molibdeno, óxido de antimonio, butil-titanato polímero, cloruro de fenil-(bispiridin)-bismuto, fluoruro de tri-n-butilestaño, etilenbistiocarbamato de manganeso, dimetilditiocarbamato de cinc,

etilenbistiocarbamato de cinc, sal de cinc del 2-piridintiol-1-óxido, etilen-bistiocarbamato de bisdimetilditiocarbamoilcinc, etilen-bisditiocarbamato cuproso (I), tiocianato de cobre, naftenato de cobre y halogenuros de tributilestaño o puede reducirse decisivamente la concentración de estos compuestos.

Las pinturas antiincrustantes listas para su aplicación contienen, en caso dado, además, otros productos activos, preferentemente alguicidas, fungicidas, herbicidas, molusquicidas o bien con otros productos activos antiincrustantes.

Como componentes de la combinación para los agentes antiincrustantes según la invención son adecuados, preferentemente:

Alguicidas tales como

2-tec.-butilamino-4-ciclopropilamino-6-metiltio-1,3,5-triazina, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine y Terbutryn;

Fungicidas tales como

S,S-dióxido de la ciclohexilamida del ácido benzo[b]-tiofencarboxílico, Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-yodo-2-propinil-butilcarbamato, Tolylfluanid y azoles tales como

Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propioconazole y Tebuconazole;

Molusquicidas tales como

Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb y Trimethacarb;

o agentes antiincrustantes tradicionales tales como

4,5-dicloro-2-octil-4-isotiazolin-3-ona, diyodometilparatrilsulfona, 2-(N,N-dimetiltiocarbamoiltio)-5-nitrotiazilo, sales de potasio, de cobre, de sodio y de cinc del 2-piridintiol-1-óxido, piridin-trifenilborano, tetrabutildiestannoxano, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, 2,4,5,6-tetraclorisoftalonitrilo, disulfuro de

tetrametiltiouram y 2,4,6-triclorofenil-maleinimida.

Los agentes antiincrustantes empleados contienen los productos activos según la invención en una concentración de 0,001 hasta 50 % en peso, especialmente de 0,01 hasta 20 % en peso.

Los agentes antiincrustantes según la invención contienen además usualmente los componentes frecuentes, pero sin limitarse a los mismos, tales como por ejemplo los que se han descrito en Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732 y Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973.

Las pinturas antiincrustantes contienen, además de los productos activos alguicidas, fungicidas, molusquicidas e insecticidas según la invención, especialmente aglutinantes.

Ejemplos de aglutinantes reconocidos son cloruro de polivinilo en un sistema disolvente, caucho clorado en un sistema disolvente, resinas acrílicas en un sistema disolvente especialmente en un sistema acuoso, sistemas de copolímeros de cloruro de vinilo/acetato de vinilo en forma de dispersiones acuosas o en forma de sistemas en disolventes orgánicos, cauchos de butadieno/estireno/acrilonitrilo, aceites desecantes tales como aceite de linaza, ésteres resínicos o ésteres resínicos modificados en combinación con alquitranes o betunes, asfalto así como epoxicompuestos, pequeñas cantidades de clorocaucho, polipropileno clorado y resinas vinílicas.

En caso dado las pinturas contienen también pigmentos inorgánicos, pigmentos orgánicos o colorantes, que preferentemente sean insolubles en el agua marina. Además las pinturas pueden contener materiales tales como colofonio para posibilitar una liberación controlada de los productos activos. Las pinturas pueden contener además plastificantes, agentes modificantes que influyan sobre las propiedades reológicas así como otros componentes tradicionales. También en

sistemas antiincrustantes de auto-pulido puede incorporarse los compuestos según la invención o las mezclas anteriormente citadas.

Los productos activos según la invención son adecuados para combatir las pestes animales, especialmente los insectos, arácnidos y ácaros, que se presentan en los recintos cerrados, tales como, por ejemplo, viviendas, instalaciones fabriles, oficinas, cabinas de vehículos automóviles y similares. Estas pueden emplearse para combatir estas pestes en productos insecticidas para el hogar. Estas son activas contra tipos sensibles y resistentes así como contra todos los estadios de desarrollo. A estas pestes pertenecen:

Del orden de los escorpionideos, por ejemplo, Buthus occitanus.

Del orden de los ácaros, por ejemplo, Argas persicus, Argas reflexus, Bryobia ssp., Dermanysus gallinae, Glyciphagus domesticus, Ornithodorus moubat, Rhipicephalus sanguineus, Trombicula alfreddugesi, Neutrombicula autumnalis, Dermatophagoides pteronissimus, Dermatophagoides forinae.

Del orden de los araneos, por ejemplo Avicullariidae, Araneidae.

Del orden de los opiliones, por ejemplo Pseudoscorpiones chelifer, Pseudoscorpiuones cheiridium, Opiliones phalangium.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Del orden de los diplopodos, por ejemplo, Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp..

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, Geophilus spp..

Del orden de los cigentomos, por ejemplo, Ctenolepisma spp., Lepisma sacharina, Lepismodes inquilinus.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo Blatta orientalies, Blatella germanica, Blatella asahinai, Leucophaea maderae, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta australasiae, Periplaneta americana, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Supella

longipalpa.

Del orden de los saltatorios, por ejemplo, Acheta domesticus.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, Forficula auricularia.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, Kalotermes spp., Reticulitermes spp.

Del orden de los psocoptéros, por ejemplo, Lepinatus spp., Liposcelis spp.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, Anthrenus spp., Attagenus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae, Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles spp., Calliphora erythrocephala, Chysozona pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Drosophila spp., Fannia canicularis, Musca domestica, Phlebotomus spp, Sarcophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Achoria grisella, Galleria mollonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium pharaonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.

Del orden de los anopluros, por ejemplo Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Phthirus pubis.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodinus prolixus, Triatoma infestans.

La aplicación en el sector de los insecticidas domésticos se lleva a cabo sola o en combinación con otros productos activos adecuados tales como ésteres del ácido

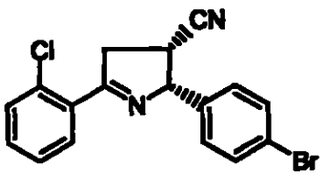
fosfórico, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento o productos activos de otras clases de insecticidas conocidos,

La aplicación se lleva a cabo en aerosoles, agentes para pulverización sin presión, por ejemplo esprays por bombeo y por pulverizado, dispositivos automáticos de nebulizado, nebulizadores, generadores de espuma, geles, productos para evaporadores con plaquetas para los evaporadores de celulosa o de material sintético, evaporadores de líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados mediante ventilador, sistemas evaporadores sin consumo de energía o bien pasivos, papeles contra las polillas, bolsitas contra las polillas y geles contra las polillas, en forma de granulados o de polvo, en cebos esparcibles o en estaciones para cebos.

La obtención y el empleo de los productos según la invención se desprenden de los ejemplos siguientes.

Ejemplos de obtención.

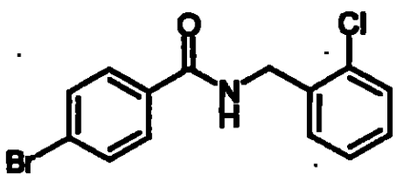
Ejemplo 1.



rac.

(I-b-1)

Síntesis Primera etapa:



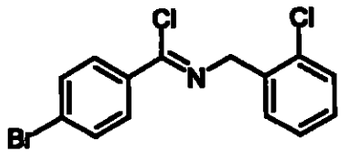
(VIII-b-1)

Se añade, gota a gota, a una mezcla constituida por 100,5 g (0,50 moles) de

ácido 4-bromobenzoico, 12 ml de dimetilformamida y 1.200 ml de diclorometano, bajo agitación, a una solución de 63,5 g (0,50 moles) de cloruro de oxalilo en 50 ml de diclorometano. Al cabo de 4 horas de agitación y una vez concluido el desprendimiento gaseoso (HCl, CO, CO_2) se refrigera bajo argon a –60°C y se añade, gota a gota, en el transcurso de 10 minutos, una mezcla constituida por 70,8 g (0,50 moles) de 2-clorobencilamina y 161,0 g (1,25 moles) de N,N-diisopropil-etilamina. Tras agitación durante la noche se lava la solución amarilla, formada de este modo, sucesivamente, tres veces con 250 ml cada vez de ácido clorhídrico 2N, una vez con 300 ml de agua y una vez con 30 ml de solución saturada de cloruro de sodio. Tras secado de la fase orgánica sobre sulfato de sodio y concentración por evaporación total se obtiene un residuo que se agita con 200 ml de diclorometano a temperatura ambiente y a continuación se separa mediante filtración por succión. El residuo, obtenido de este modo, se recoge en 200 ml de metil-terc.-butiléter, se calienta brevemente a ebullición, se deja refrigerar y nuevamente se separa mediante filtración por succión.

Se obtienen 108 g (83 % de la teoría) de la 4-bromo-N-(2-clorobencil)-benzamida con un punto de fusión de 133°C.

Síntesis segunda etapa:



(II-b-1)

Se calienta a reflujo durante 2 horas una mezcla constituida por 106,

(0,34 moles) del compuesto (VIII-b-1) y 200 ml de cloruro de tionilo. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente, se elimina el cloruro de tionilo en

exceso bajo presión reducida. El aceite amarillo obtenido de este modo, se cristaliza tras un corto reposo a temperatura ambiente.

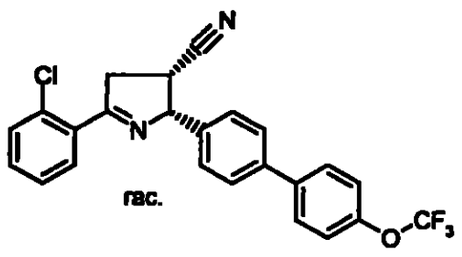
Se obtienen 112,5 g (97 % de l teoría) del cloruro de 4-bromo-N-(2-clorobencil)fenilcarboximidoilo con un punto de fusión de 58 hasta 61°C.

Síntesis tercera etapa:

Se deja reposar durante 7 días con exclusión de la luz y el aire, a temperatura ambiente, una mezcla constituida por 55,9 g (63 mmoles) del compuesto (II-b-1), 17,3 g (327 mmoles) de acrilonitrilo y 33,0 g (327 mmoles) de trietilamina en 300 ml de diclorometano. A continuación se lava con tres veces 100 ml de ácido clorhídrico 2N, una vez con 100 ml de agua y una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida y el residuo se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con clorometano/ciclohexano.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-bromofenil)-5-(2-clorofenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 110°C.

Ejemplo 2.



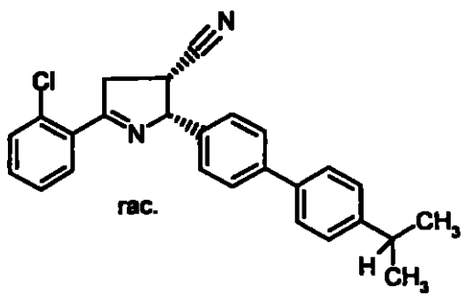
(I-a-1)

Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituidapor 0,997 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-1), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución de carbonato de sodio al 20

%. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y en 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cristalización en diclorometano/metil-terc.-butiléter proporciona un producto sólido blanco.

Se obtienen 320 mg (26 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-clorofenil)-2-[4'-triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 132°C.

Ejemplo 3.



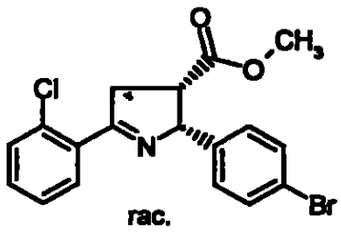
(I-a-2)

Se calienta durante 40 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 0,803 g (2,23 mmoles) del compuesto (I-b-1), 0,732 g (4,46 mmoles) del ácido 4-isopropil-fenil-borónico, 0,130 g (0,12 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 15 ml de 1,2-dimetoxietano y 3,7 ml de solución de carbonato de sodio al 20 %. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cromatografía del residuo, obtenido de

este modo, sobre gel de sílice con ciclohexano/acetato de etilo como Eluyentes, proporcionan el producto deseado.

Se obtienen 230 mg (26 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2-clorofenil)-2-[4'-(isopropil)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 127-128°C.

Ejemplo 4.

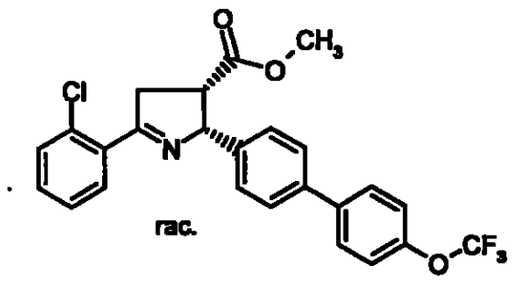


(I-b-2)

Se deja reposar durante 7 días, con exclusión de la luz y del aire, a temperatura ambiente, una mezcla constituida por 55,9 g (163 mmoles) del compuesto (II-b-1), 28,1 g (327 mmoles) de acrilato de metilo y 33,0 g (327 mmoles) de trietilamina en 300 ml de diclorometano. A continuación se lava tres veces con 100 ml cada vez de ácido clorhídrico 2N, una vez con 100 ml de agua y una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida y el residuo se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con diclorometano/ci-clohexano.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S)-2-(4-bromofenil)-5-(2-clorofenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo con un punto de fusión de 134°C.

Ejemplo 5.



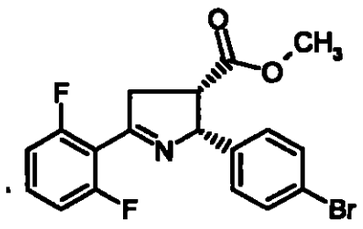
(I-f-1)

Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 1,09 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-2), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución de carbonato de sodio al 20 %. Tras refrigeración a temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Se secan las fases orgánicas reunidas sobre sulfato de sodio y se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida. El residuo se cromatografía sobre gel de sílicie con ciclohexano/acetato de etilo a modo de Eluyentes.

Se obtienen 620 mg (47 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S))-5-(2-clorofenil)-2—[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo en forma de aceite amarillento.

logP (pH 2,3)= 5,05.

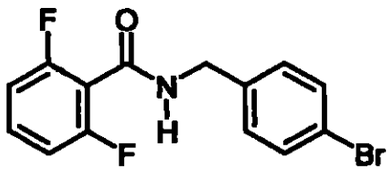
Ejemplo 6.



rac.

(I-b-3)

Síntesis primera etapa:



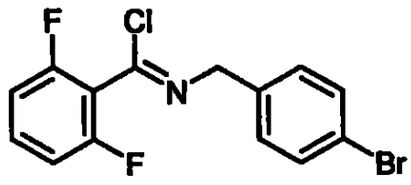
(VIII-a-1)

Se añade, gota a gota, a una solución de 73,3 g (4,64 mmoles) del ácido 2,6-diflúorbenzoico en 1.000 ml de diclorometano y 2 ml de dimetilformamida, una solución de 64,8 g (510 mmoles) de cloruro de oxalilo en 20 ml de diclorometano, a 20°C (1 hora, la temperatura interna cae hasta 15°C sin corriente de argon). Tras el final del fuerte desprendimiento gaseoso (CO_2, CO, HCl) se calienta a 35°C y se continua agitando durante 5 minutos. A continuación se añaden 103,2 g (464 mmoles) de hidrocloruro de 4-bromobencilamina y se añaden, gota a gota, una solución de 140,5 g (1391 mmoles) de trietilamina en 100 ml de diclorometano a 0°C a la solución del cloruro de acilo. Una vez concluida la reacción se añaden 200 ml de diclorometano. A continuación se sacuden dos veces con 500 ml cada vez de HCl 2N, dos veces con 250 ml cada vez de NaOH 2N, a continuación se lava hasta neutralidad y se extrae una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras el secado sobre sulfato de sodio se filtra y el filtrado se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida. El compuesto deseado se separa por cristalización en diclorometano/n-hexano.

Se obtienen 125,7 g (83 % de la teoría) de la N-(4-bromobencil)-2,6-

diflúorbenzamida con un punto de fusión de 142°C.

Síntesis segunda etapa:



(II-a-1)

Se calientan 25 g (76,7 mmoles) del compuesto (VIII-a-1) en 60 ml de cloruro de tionilo durante 2 horas a reflujo. A continuación se concentra completamente por evaporación a presión reducida.

El residuo, obtenido de este modo, se emplea, sin purificación adicional, para las reacciones subsiguientes.

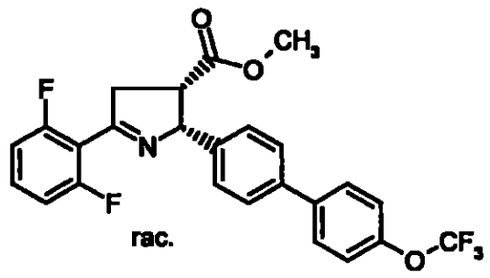
Síntesis tercera etapa:

Se deja reposar durante 14 días, con exclusión de la luz y del aire, una mezcla de 25,4 g (73,7 mmoles) del compuesto (II-a-1), 25,3 g de acrilato de metilo (294 mmoles) y 29,8 g (295 mmoles) de trietilamina.

Para la elaboración se recoge en 500 ml de diclorometano y se extrae la fase orgánica tres veces con 500 ml, cada vez, de ácido clorhídrico 2N. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra por evaporación bajo presión reducida y el residuo, obtenido de este modo, se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con diclorometano/metanol a modo de eluyente.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-bromofenil)-5-(2,6-diflúorfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo con un punto de fusión de 133°C.

Ejemplo 7.

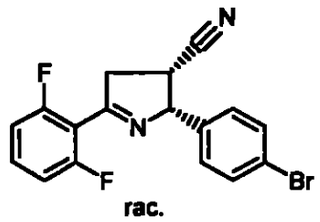


(I-d-1)

Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 1,10 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-3), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución de carbonato de sodio al 20 %. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cristalización en diclorometano/metil-terc.-butiléter proporciona un producto sólido blanco.

Se obtienen 480 mg (39 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-diflúorfenil)-2-[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carboxilato de metilo con un punto de fusión de 125°C.

Ejemplo 8.



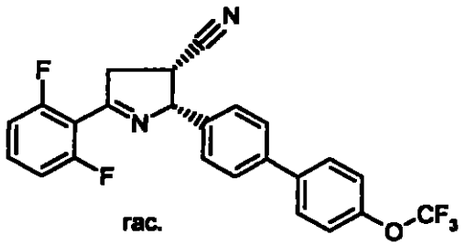
(I-b-4)

Se deja reposar durante 7 días, con exclusión de la luz y del aire, a

temperatura ambiente, una mezcla constituida por 25,4 g (76,6 mmoles) del compuesto (II-a-1), 16,2 g (303 mmoles) de acrilonitrilo y 30,7 g (303 mmoles) de trietilamina en 300 ml de diclorometano. A continuación se lava tres veces con 100 ml; cada vez, de ácido clorhídrico 2N, una vez con 100 ml de agua y una vez con 100 ml de solución concentrada de cloruro de sodio. Tras secado sobre sulfato de sodio se concentra completamente por evaporación bajo presión reducida y el residuo se cromatografía varias veces sobre gel de sílice con diclorometano/ciclohexano como Eluyentes.

Se obtiene el ((2S,3R), (2R,3S))-2-(4-bromofenil)-5-(2,6-diflúorfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de 159°C.

Ejemplo 9.



rac. (I-a-3)

Se calienta durante 30 minutos, bajo argon, a 90°C, una mezcla constituida por 1,00 g (2,78 mmoles) del compuesto (I-b-4), 0,606 g (2,90 mmoles) del ácido 4-triflúormetoxi-fenil-borónico, 0,16 g (0,14 mmoles) de tetraquis-trifenilfosfina-paladio, 20 ml de 1,2-dimetoxietano y 5,0 ml de solución al 20 % de carbonato de sodio. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se recoge la carga en 30 ml de agua y 30 ml de metil-terc.-butiléter. Tras separación de la fase orgánica se extrae la fase acuosa hasta agotamiento con metil-terc.-butiléter. Se secan las fases orgánicas reunidas sobre sulfato de sodio y se concentran completamente por evaporación bajo presión reducida. La cristalización en diclorometano/metil-terc.-

butiléter, proporciona un producto sólido amarillo claro.

Se obtienen 520 mg (42 % de la teoría) del ((2S,3R), (2R,3S)-5-(2,6-diflúorfenil)-2-[4'-(triflúormetoxi)-1,1'-bifenil-4-il]-3,4-dihidro-2H-pirrol-3-carbonitrilo con un punto de fusión de :145°C.

La determinación de los valores logP indicados se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18). Temperatura: 43°C.

Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido: 0,1 % de ácido fosfórico acuoso, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo.

El calibrado se llevó a cabo con alcano-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores lambda-máximos se determinaron por medio de los espectros de UV con 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A

Ensayo con Liriomyza

Disolvente: 3 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

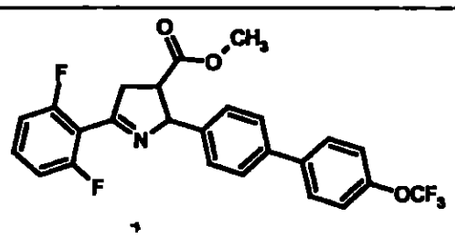
Se sumergen plantas de judías (Phaseolus vulgaris), que están atacadas por huevos y

estadios de desarrollo de tisanopteros (Liriomyza trifolii), en una preparación del producto activo de la concentración deseada.

Al cabo del tiempo deseado se determina el efecto en %. En este caso 100 % significa que se han destruido todos los tisanopteros; 0 % significa que no se ha destruido ningún tisanóptero.

Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla A: Ensayo con Liriomyza

Producto activo	Concentración en producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7 días
	1.000	100

Ejemplo B

Ensayo con Meloidogyne

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

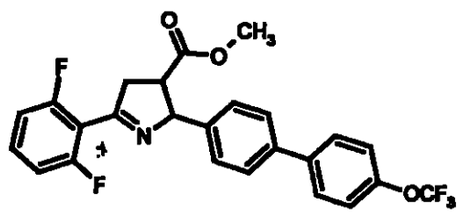
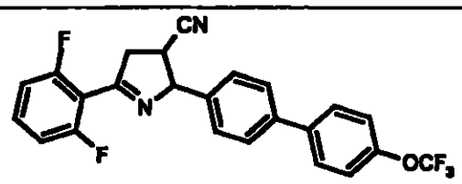
Se rellenan recipientes con arena, solución del producto activo, suspensión de huevos-larvas de Meloidogyne incognita y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantucas se desarrollan. Se desarrollan vesículas sobre las raíces.

Al cabo del tiempo deseado se determina en % el efecto nematicida por medio de la formación de vesículas. En este caso 100 % significa que no se formaron vesículas; 0 % significa que el número de vesículas en las plantas tratadas corresponde al de los controles no tratados.

Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los

resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla B: Ensayo con Meloidogyne

Producto activo	Concentración en producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 14 días
	20	100
	20	90

Ejemplo C

Ensayo con larvas de Phaedon

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

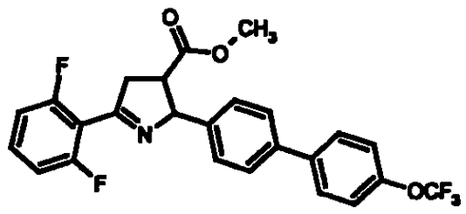
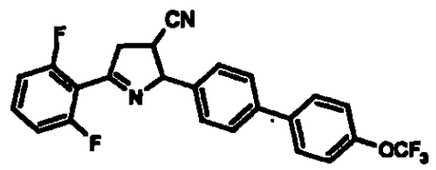
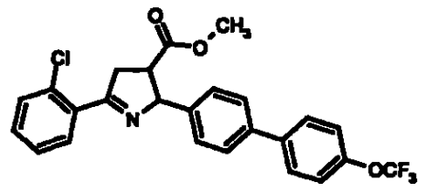
Se tratan hojas de col (Brassica oleracea) por inmersión en la preparación de producto activo de la concentración deseada y se cubren con larvas del escarabajo de la hoja de rábano picante (Phaedon cochleariae), mientras las hojas estén aún

húmedas.

Al cabo del tiempo deseado se determina la destrucción en %. En este caso 100 % significa que todas las larvas del escarabajo fueron destruidas, 0 % significa que no fue destruida ninguna larva del escarabajo.

Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla C: Ensayo con larvas de Phaedon

Producto activo	**Concentración en producto activo en ppm**	**Grado de destrucción en % al cabo de 7 días**
	1000	100
	1000	100
	1000	100

Ejemplo D

Ensayo con Spodoptera frugiperda

Disolvente: 30 Partes en peso de dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

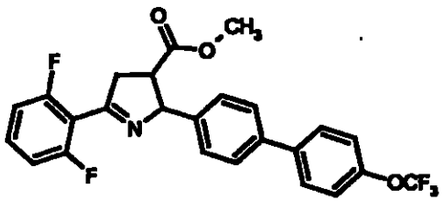
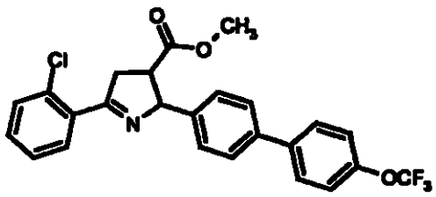
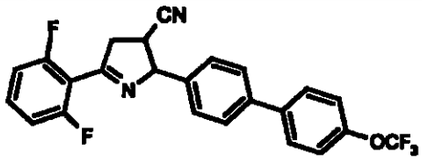
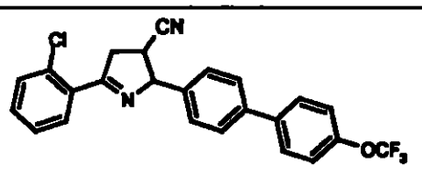
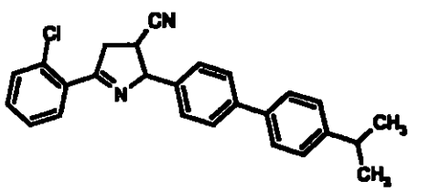
Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo se mezcla 1 parte en peso de producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua, que contiene emulsionante, hasta la concentración deseada.

Se tratan hojas de col (Brassica oleracea) mediante inmersión en la preparación del producto activo de la concentración deseada y se cubren con orugas del gusano invasor (Spodoptera frugiperda), en tanto en cuanto las hojas estén aún húmedas.

Al cabo del tiempo deseado se determina el efecto en %. En este caso 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

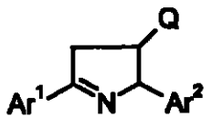
Los productos activos, las concentraciones en productos activos y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

Tabla D: Ensayo con Spodoptera frugiperda

Producto activo	Concentración en producto activo en ppm	Grado de destrucción en % al cabo de 7 días
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

REIVINDICACIONES

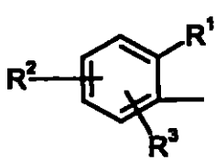
1.- Δ^1-Pirrolinas de la fórmula (I)



(I)

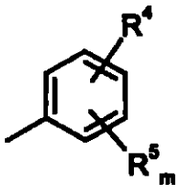
en la que

Ar^1 significa el resto



y

Ar^2 significa el resto



en los que

m significa 0, 1, 2, 3 o 4,

R^1 significa halógeno, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, alcoxialquilo, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$,

R^4 significa halógeno o uno de los agrupamientos siguientes

(m) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo, alquilcarbonilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalquilsulfoniloxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2-NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, halógenoalquilaminosulfonilo, bisalcoxiborano, $-B(OH)_2$,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_o$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo, o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en caso dado una o varias veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo, substituido en caso dado una o varias veces por restos de la lista W^2, con 5 a 10 miembros, saturado o insaturado, con uno o varios heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo, halógenoalquenilo, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno, alquenileno, alquinileno, alquilenoxi, oxialquileno, oxialquilenoxi, tioalquileno, halógenoalquileno, halógenoalquenileno,

E significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, halógenoalquilo,

halógenoalquenileno, halógenoalquilsulfonilo, dialquilaminosulfonilo,

W^1 significa ciano, halógeno, ciano, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi, halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, pentaflúortio, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo, trialquilsililo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalqueniloxi, halógenoalquilsulfoniloxi, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa hidrógeno, alquilo o halógenoalquilo,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, o conjuntamente significan alquileno,

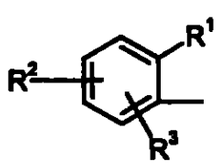
R^9 significa hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, halógenoalquilo, aralquilo, fenilo,

R^{10} significa alquilo, halógenoalquilo, aralquilo,

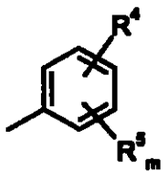
R^{11} significa alquilo, arilo,

2.- Compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



m significa 0, 1, 2 o 3,

R^1 significa halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$,$-NR^7R^8$,

R^2 y R^3 significan, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$,$-NR^7R^8$,

R^4 significa flúor, cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes, que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(m) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa halógeno, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, tri(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)-sililo, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-CONR^7R^8$,

$-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo, bis(alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono)borano, $-B(OH)_2$,

X significa un enlace directo, oxígeno, $-S(O)_o$, $-NR^6$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos, respectivamente, en caso dado una a cuatro veces por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo con 5 a 10 miembros, que contiene uno o dos anillos aromáticos, substituido en caso dado de una a cuatro veces por restos de la lista W^2, con 1 a 4 heteroátomos, combinados de 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, de 0 hasta 2 átomos de oxígeno y de 0 hasta 2 átomos de azufre (especialmente tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, tiazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo),

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo

con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquileno con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) sulfonilo, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo,

W^1 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, pentaflúortio, $-S(O)_oR^6$, $SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2N(R^6)CO_2R^6$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, halógeno, formilo, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, tri(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sililo, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo

con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2, 3 o 4,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 a 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre,

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o conjuntamente significan alquileno,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo, fenilo,

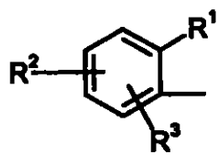
R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo,

R^{11} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, fenilo,

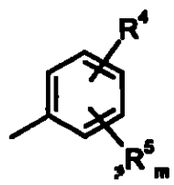
R^{12} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, bencilo o fenilo,

3.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



m significa 0, 1 o 2,

R^1 significa flúor, cloro, bromo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, o significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro,

R^4 significa cloro, bromo, yodo o significa uno de los agrupamientos siguientes, que se encuentran en posición orto o para del anillo arilo

(m) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, $-CONH_2$, $-CSNH_2$, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 6

átomos de carbono o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, $-OSO_2CF_3$, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, $-B(OH)_2$, 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano),

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, oxisulfonilo (OSO_2), alquileno con 1 a 4 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 4 átomos de carbono, alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono, ciclopropileno, oxiranileno,

A significa fenilo, naftilo o tetrahidronaftilo substituidos respectivamente en caso dado de una hasta tres veces, por restos de la lista W^1 o significa heterociclilo con 5 a 10 miembros, que contiene 1 o 2 anillos aromáticos, con 1 a 4 heteroátomos, combinados desde 0 hasta 4 átomos de nitrógeno, desde 0 hasta 2 átomos de oxígeno y desde 0 hasta 2 átomos de azufre, substituidos, en caso dado, de una hasta tres veces, por restos de la lista W^2 (especialmente tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazilo, imidazilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo, quinolinilo o isoquinolinilo),

B significa p-fenileno substituido en caso dado una o dos veces por restos de la lista W^1,

Z significa $-(CH_2)_n-$, oxígeno o $-S(O)_o-$,

D significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)aminosulfonilo, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, carboniloxi, oxicarbonilo, alquileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono, alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono; alquileno con 1 a 6 átomos de carbono o alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro; alquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquileno con 1 a 4 átomos de carbono, oxialquilenoxi con 1 a 4 átomos de carbono, tioalquileno con 1 a 4 átomos de carbono,

E significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, di(alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)aminosulfonilo, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro,

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos de carbono, (halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono)sulfoniloxi, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $-SO_2NR^7R^8$, $OSO_2NR^7R^8$, $-OSO_2R^{12}$, $-C(R^6)=N-O(R^6)$,

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro, halógenoalqueniloxi con 2 a 6 átomos

de carbono, $-OSO_2CF_3$, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, $-S(O)_oR^6$, $SO_2NR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-(R^6)=N-O(R^6)$,

n significa 0, 1, 2 o 3,

Q significa $-CO_2R^9$, $-COR^{10}$, $-CONR^7R^8$, -CN, $-PO(OR^{11})_2$, un heterociclo con 5 a 7 miembros, saturado o insaturado, con 2 hasta 4 heteroátomos de la serie formada por nitrógeno, oxígeno y azufre (especialmente dihidrodioxazina, oxazolina, tiazolina, imidazolina, tetrazol),

o significa 0, 1 o 2,

R^6 significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o significa metilo o etilo substituidos, respectivamente, por flúor o por cloro,

R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos respectivamente por flúor o por cloro, o conjuntamente significan alquileno con 4 a 5 átomos de carbono,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, significan alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro, bencilo o fenilo,

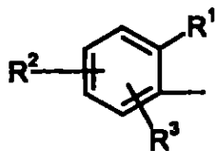
R^{10} significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro,

R^{11} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenilo,

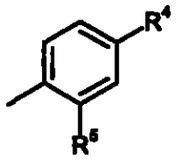
R^{12} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido por flúor o por cloro,

4.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



R^1 significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi,

R^2 y R^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi,

R^4 significa cloro, bromo o significa uno de los agrupamientos siguientes

(l) -X-A

(m) -B-Z-D

(n) -Y-E,

R^5 significa flúor, cloro, bromo, hidroxi, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, triflúormetilo, diflúormetoxi, triflúormetoxi, triflúormetiltio, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2NMe_2$ o $-SO_2CF_3$,

R^5 significa además hidrógeno,

X significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, -CH=CH-(E o Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $-S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$,

A significa fenilo substituido en caso dado una o dos veces, por restos de la lista W^1, o significa tetrazolilo, furilo, benzofurilo, tienilo, benzotienilo, pirrolilo, indolilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, pirazilo, tiazolilo, benzotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazilo, triazinilo, triazilo substituidos respectivamente en caso dado una o dos veces por restos de la lista 2,

B significa p-fenileno monosubstituido en caso dado por restos de la lista W^1.

Z significa oxígeno, azufre o $-SO_2-$,

D significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$,

Y significa un enlace directo, oxígeno, azufre, $-SO_2-$, carbonilo, $-CH_2-(CH_2)_2-$, -CH=CH- (E o Z), $-C\equiv C-$, $-CH_2O-$, $-(CH_2)_2O-$, $-OCH_2-$, $-SCH_2-$, $S(CH_2)_2-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$,

E significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, 2-propenilo, butenilo, propargilo, butinilo, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2(CF_2)_3CF_3$, $-SO_2NMe_2$,

W^1 significa ciano, flúor, cloro, bromo, formilo, nitro, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec.-butilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec.-butoxi, terc.-butoxi, triflúormetoxi, diflúormetoxi, $-CF_3$, $-CHF_2$, $CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCF_3$, $-CH_2CF_2H$, $-OCH_2CF_3$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCF_3$, $-SCF_3$, $-SCHF_2$, $-SO_2CHF_2$, $-SO_2CF_3$ $-SOCHF_2$, $-SOCF_3$,

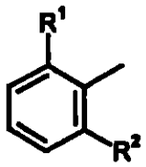
$-SO_2NMe_2$, $-OSO_2CH_3$, $-OSO_2CF_3$, $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2Et$, $-SO_2Me$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe,

W^2 significa ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, terc.-butilo, triflúormetilo, triflúormetoxi, diflúormetoxi, triflúormetiltio, $-OSO_2CF_3$, $-COCH_3$, $-CO_2CH_3$, $-OCH_2CF_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2NMe_2$, $-OSO_2NMe_2$, -C(Me)=N-O(Et), -C(Et)=N-OMe,

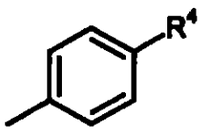
Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo, $-CO_2$-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, $-CO_2$-triflúoretilo, $-CO_2CH_2Ph$, $-CO_2Ph$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, -CO-n-propilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo), -CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, $-PO(OMe)_2$, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo, $-PO(OEt)_2$, $-PO(OPh)_2$, dihidrodioxazinilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, tetrazolilo,

5.- Compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Ar^1 significa el resto



Ar^2 significa el resto



$R^{1'}$ significa flúor o cloro,

R^2 significa hidrógeno, cloro o flúor,

R^4 significa -B-Z-D,

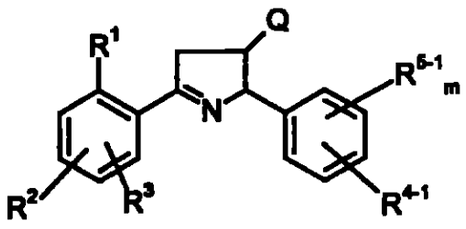
B significa p-fenileno,

Z significa oxígeno o azufre,

D significa $-CF_3$,

Q significa $-CO_2CH_3$, $-CO_2CH_2CH_3$, $-CO_2$-n-propilo.-CO_2-isopropilo, $-CO_2$-n-butilo, $-CO_2$-isobutilo, $-CO_2$-sec.-butilo, $-CO_2$-terc.-butilo, $-CO_2$-n-pentilo, $-CO_2$-neopentilo, $-CO_2$-sec.-isoamilo, $-CO_2$-pentano-3-ilo, $-CO_2$-ciclopentilo, $-CO_2$-n-hexilo, $-CO_2$-ciclohexilo, -CONHMe, -CONHEt, -CONH(n-propilo) –CONH(isopropilo), -CONH(n-butilo), -CONH(terc.-butilo), -CONH(n-pentilo), -CONH(n-hexilo), -CONH(ciclohexilo), $-CONMe_2$, $-CONEt_2$, $-CON(n\text{-propilo})_2$, $-CON(isopropilo)_2$, $-CON(n\text{-butilo})_2$, $-CON(n\text{-pentilo})_2$, -CON(Me)Et, -CON(Me)n-propilo, -CON(Me)n-butilo, -CON(Me)n-pentilo, -CN, pirrolidinocarbonilo, piperidinocarbonilo,

6.- Δ^1-Pirrolinas de la fórmula (I-a)



(I-a)

en la que

R^1, R^2, R^3, Q y m tienen los significados indicados en una de las reivindicaciones 1 a 5,

R^{4-1} significa A o B-Z-D

donde

A, B, Z y D tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

y

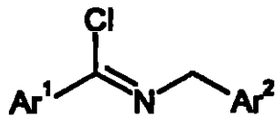
R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, haloalquilaminosulfonilo,

donde

R^6, R^7, R^8 y o tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5.

7.- Procedimiento para la obtención de compuestos de la fórmula (I), según una de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque

A-1.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-a)



(II-a)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



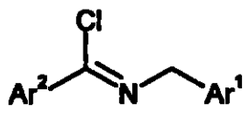
(III)

en las que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados las reivindicaciones 1 a 5,

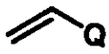
en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

A-2.) se hacen reaccionar iminocloruros de la fórmula (II-b)



(II-b)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



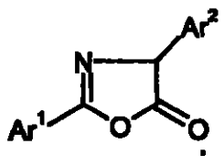
(III)

en la que

Ar^1, Ar^2, y Q tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

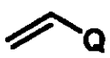
en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

B.) se hacen reaccionar oxazolinonas de la fórmula (IV)



(IV)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



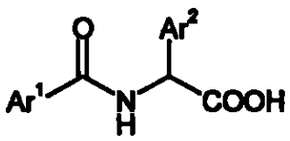
(III)

en la que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

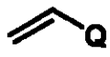
en caso dado en presencia de un diluyente, o porque

C.) se hacen reaccionar ácidos carboxílicos de la fórmula (V)



(V)

con dipolarofilos de la fórmula (III)



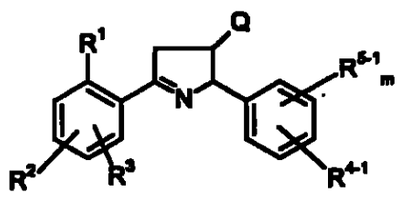
(III)

en la que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

en presencia de anhidrido acético y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o porque

D.) se obtienen las Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I-a)



(I-a)

en la que

R^1, R^2, R^3, Q y m tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

R^{4-1} significas A o B-Z-D

donde

A, B, Z y D tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

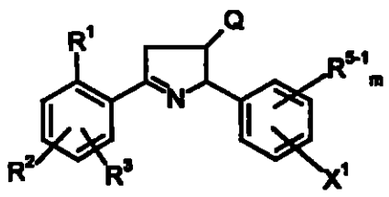
y

R^{5-1} significa flúor, hidroxi, ciano, nitro, alquilo, alcoxi, halógenoalquilo, halógenoalcoxi, trialquilsililo, alcoxicarbonilo, $-CONR^7R^8$, $-OSO_2NR^7R^8$, $-S(O)_oR^6$, $-NR^7R^8$, $-NHCO_2R^6$, haloalquilaminosulfonilo,

donde

R^6, R^7, R^8 y o tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5,

porque se hacen reaccionar compuestos de la fórmula (I-b)



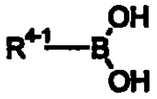
(I-b)

en la que

R^1, R^2, R^3, R^{5-1}, Q y m tienen los significados indicados en las reivindicaciones 1 a 5 y

X^1 significa Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$

con ácidos borónicos de la fórmula (VI)



(VI)

en la que

R^{4-1} tiene el significado indicado en esta reivindicación,

en presencia de un catalizador, en caso dado, en presencia de un agente aceptor de ácido y en caso dado, en presencia de un diluyente,

o porque

se obtienen los compuestos de la fórmula (I-a), porque se hacen reaccionar, compuestos de la fórmula (I-b)

en la que

X^b significa 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxoborolano),

con (hetero)ciclos de la fórmula (VII)

$$T—A \qquad (VII)$$

en la que A tiene el significado indicado en las reivindicaciones 1 a 5

y

T significa Cl, Br, I, $-OSO_2CF_3$,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado en presencia de un diluyente.

8.- Agentes pesticidas, caracterizados porque tienen un contenido en al menos un compuesto de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 5, además de extendedores y/o productos tensioactivos.

9.- Compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 5, para la lucha contra las pestes.

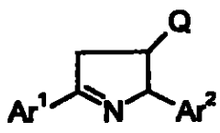
10.- Procedimiento para la lucha contra las pestes, caracterizado porque se dejan actuar los compuestos de la fórmula (I) según una de las reivindicaciones 1 a 5, sobre las pestes y/o sobre su medio ambiente.

11.- Procedimiento para la obtención de agentes pesticidas, caracterizado porque se mezclan compuestos de la fórmula (I), según una de las reivindicaciones 1 a 5, con extendedores y/o con productos tensioactivos.

12.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I), según una de las reivindicaciones 1 a 5, para la fabricación de agentes pesticidas.

RESUMEN

Nuevas Δ^1-pirrolinas de la fórmula (I)



(I)

en la que

Ar^1, Ar^2 y Q tienen los significados indicados en la descripción,

a varios procedimientos para la obtención de estos productos y a su empleo para la lucha contra las pestes.

456.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 03023960 00000000
Fecha (AMD): 2003-03-20 17:02:34 Folios: 436
Tracite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

:rcio
ICIA

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 15,138
FECHA : MARZO 3 DE 2003

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	12169291	03/03/2003	13,256,000.00

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

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-02 SOLICITUDES	7 TRAMITES DE SOL. DE DISENOS INDUS	400,000.00
		TOTAL : $	400,000.00

SON: CUATROCIENTOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador 382 0840
Fax 350 5220
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

Q6 13549-841-002.0