SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-067935- -00000-0000
Fecha: 2011-06-01 14:02:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 477

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

PCT

SOLICITUD DE

PATENTE DE INVENCION
PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

21. EXPEDIENTE No. 11-67935

54. TITULO: **N-OXIAMIDAS ESPIROHERETOCÍCLICAS COMO PESTICIDAS**

52. CLASIFICACION INTERNACIONAL: **A01N 43/90, C07D 211/94, C07D 471/10**

71. SOLICITANTE: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

DOMICILIO: **Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea - SUIZA**

74. APODERADO: **Dra. MARGARITA CASTELLANOS A.**

22. BOGOTA, D.C., _____

02-07-2011

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-067935- -00000-0000

Fecha: 2011-06-01 14:02:15 Dep: 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 477

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

ADM. [illegible] - NUEVAS CREACIONES

PATENTE DE INVENCION [ ] **MODELO DE UTILIDAD** [ ] **Art. 33 Decisión 486/00**

- [ ] Indicación que se solicita una patente
- [ ] Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
- [ ] Descripción de la invención
- [ ] Dibujos de ser estos pertinentes
- [ ] Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)

Completa [ ] Incompleta [ ]

PATENTE DE INVENCION PCT [X] **MODELO DE UTILIDAD PCT** [ ] **Art. 33 Decisión 486/00 Circular Única**

- [X] Indicación que se solicita una PCT
- [X] Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
- [X] Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
- [ ] Dibujos de ser estos pertinentes
- [X] Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)

Completa [X] Incompleta [ ]

DISEÑO INDUSTRIAL [ ] **(Art. 119 Decisión 486/00)**

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

Completa [ ] Incompleta [ ]

ESQUEMA DE TRAZADO [ ] **(Art. 92 Decisión 486/00)**

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

Completa [ ] Incompleta [ ]

000001

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-067935- -00000-0000
Fecha: 2011-06-01 14:02:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 477

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTES
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

(1)

[X] **Patente de Invención.** [ ] **Patente de Modelo de Utilidad.**

[X] **Capítulo I** [ ] **Capítulo II**

(2) **SOLICITANTE (71)**

Nombre: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**
Dirección: **Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea - SUIZA**
Nacionalidad o Domicilio: **Basilea - SUIZA**
Lugar de Constitución: **SUIZA**
Teléfono: Fax:
E-mail:

IDENTIFICACIÓN
C.C. [ ] NIT [ ]
C.E. [ ] Otro [ ]
Cual
Número

(3) **REPRESENTANTE O APODERADO**

Nombre: **MARGARITA CASTELLANOS A.**
Dirección: **CALLE 94A No. 7A-09**
Teléfono: **756 0770** Fax: **755 0158**
E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN
C.C. [X] NIT [ ]
C.E. [ ] Otro [ ]
Cual
Número **39'779.654** TPA **70.819**

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

VER ANEXO # 1

(5) **PCT (86)**

Solicitud Internacional No. **PCT/EP2009/066039** Fecha **30/11/2009**
Publicación Internacional No. **WO 2010/063670 A1** Fecha **10/06/2010**

(6) **Título (54)** **N-OXIAMIDAS ESPIROHERETOCÍCLICAS COMO PESTICIDAS**

(7) **Clasificación Internacional (51)** **A01N 43/90, C07D 211/94, C07D 471/10**

(8) **Prioridad** SI [X] NO [ ]

(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
GB	02/12/2008	0822005,5
GB	27/03/2009	0905340,6

(9) **Comprobantes de pago Nos.** **11-0050518, 11-0043084, 11-0045107 y 11-0045108** **Fecha** **Mayo 26, Mayo 5 y Mayo 11 de 2011**

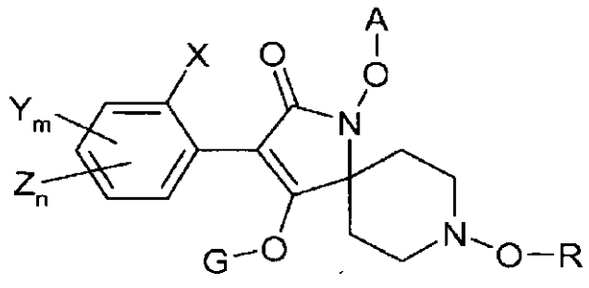
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

000002

(10) Anexos

- [X] Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- [X] Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- [X] Poderes, si fuere el caso, junto con la sustitución del mismo a mi favor
- [ ] 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).
- [ ] Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- [ ] Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- [ ] De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- [ ] De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- [ ] De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- [X] Arte final 12x12
- [ ] De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o titulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- [ ] De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- [X] Otros: **Tarjeta Propietario, Extracto para la publicación**

(11) FIGURA CARACTERISTICA:



(I)

(12) Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**

FIRMA:

C.C. No. 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 C.S.J.

1 JUN. 2011

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página. - MCA/gcb - P2220

CASTELLANOS & CO LTDA
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

ANEXO # 1
INVENTORES

1. **MICHEL MUEHLEBACH**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 STEIN
   SUIZA

2. **THOMAS PITTERNA**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 STEIN
   SUIZA

3. **ANDRE JEANGUENAT**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG.
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 STEIN
   SUIZA

4. **MYRIEM EL QACEMI**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 STEIN
   SUIZA

5. **ROGER GRAHAM HALL**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 STEIN
   SUIZA

6. **ANDREW EDMUNDS**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG.
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 STEIN
   SUIZA

7. **CAMILLA CORSI**
   Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
   Schaffhauserstrasse
   CH-4332 STEIN
   SUIZA

8. **ANDRÉ DENIS STOLLER**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 STEIN
SUIZA

9. **CHRISTOPHER RICHARD GODFREY**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 STEIN
SUIZA

10. **JÜRGEN HARRY SCHAETZER**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 STEIN
SUIZA

11. **OLIVIER LOISELEUR**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 STEIN
SUIZA

12. **PETER MAIENFISCH**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 STEIN
SUIZA

13. **JÉRÔME YVES CASSAYRE**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 STEIN
SUIZA

000005

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0050518

Bogotá D.C., Mayo 26 de 2011 - 10:49:51

RECIBIDO DE : CASTELLANOS Y Y CO NI 800.174.641

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	420542043	26/05/2011	33.712.400.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCION	571.000.00	571.000.00
				$571.000.00

SON: **QUINIENTOS SETENTA Y UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
****

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-067935- -00000-0000
Fecha: 2011-06-01 14:02:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 477

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0043084

Bogotá D.C., Mayo 05 de 2011 - 14:19:34

RECIBIDO DE : CASTELLANOS Y Y CO NI 800.174.641

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	167747974	05/05/2011	3.025.600.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMITE	27.000.00	27.000.00
				$27.000.00

SON: **VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
-*********-

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
No. 11-067935- -00000-0000
Fecha: 2011-06-01 14:02:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 477

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO 000007
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0045107

Bogotá D.C., Mayo 11 de 2011 - 12:45:50

RECIBIDO DE : CASTELLANOS Y Y CO NI 800.174.641

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	48431994	11/05/2011	14.593.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMITE	27.000.00	27.000.00
				$27.000.00

SON: **VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____
****

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-067935- -00000-0000

Fecha: 2011-06-01 14:02:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 477

000003

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0045108

Bogotá D.C., Mayo 11 de 2011 - 12:45:50

RECIBIDO DE : CASTELLANOS Y Y CO NI 800.174.641

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	48431994	11/05/2011	14.593.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMITE	27.000.00	27.000.00
				$27.000.00

SON: **VEINTISIETE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 11-067935- -00000-0000

Fecha: 2011-06-01 14:02:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 477

000009

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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

(43) International Publication Date
10 June 2010 (10.06.2010)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2010/063670 A1

(51) International Patent Classification:
A01N 43/90 (2006.01) *C07D 471/10* (2006.01)
C07D 211/94 (2006.01)

(21) International Application Number:
PCT/EP2009/066039

(22) International Filing Date:
30 November 2009 (30.11.2009)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0822005.5 2 December 2008 (02.12.2008) GB
0905340.6 27 March 2009 (27.03.2009) GB

(71) Applicant *(for all designated States except US)*: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG** [CH/CH]; Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants *(for US only)*: **MUEHLEBACH, Michel** [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **PITTERNA, Thomas** [AT/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **JEANGUENAT, André** [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **EL QACEMI, Myriem** [FR/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **HALL, Roger Graham** [GB/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **EDMUNDS, Andrew** [GB/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **CORSI, Camilla** [IT/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **STOLLER, André** [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **GODFREY, Christopher, Richard** [GB/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **SCHAETZER, Jürgen Harry** [DE/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **LOISELEUR, Olivier** [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **MAIENFISCH, Peter** [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). **CASSAYRE, Jérôme Yves** [FR/CH]; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH).

(74) Agent: **HÖLSCHER, Ingo**; Syngenta Crop Protection Münchwilen AG, Patent Department, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH).

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

(84) Designated States *(unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Declarations under Rule 4.17:

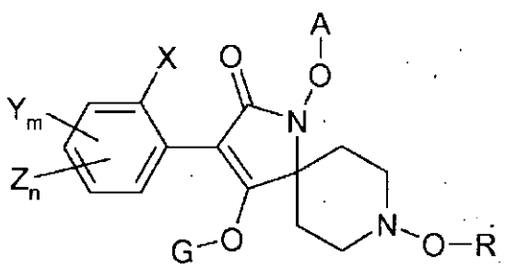
— *as to applicant's entitlement to apply for and be granted a patent (Rule 4.17(ii))*

Published:

— *with international search report (Art. 21(3))*

[Continued on next page]

(54) Title: SPIROHETEROCYCLIC N-OXYAMIDES AS PESTICIDES



(I)

(57) Abstract: Novel compounds of the formula (I), wherein the substituents are as defined in claim 1; compositions containing them and their use as insecticides, acaricides, nematicides or molluscicides.

WO 2010/063670 A1

— *before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments (Rule 48.2(h))*

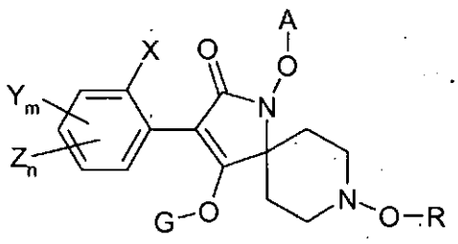
SPIROHETEROCYCLIC N-OXYAMIDES AS PESTICIDES

The present invention relates to new N-oxyamide substituted spiroheterocyclic pyrrolidine dione derivatives, to processes for preparing them, to insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal compositions comprising them and to methods of using them to combat and control insect, acarine, mollusc and nematode pests.

Spirocyclic pyrrolidine dione derivatives are disclosed for example in WO 2000/068196, JP 2001072661, and in articles from M. Ito et al., Heterocycles 57, 881-894, 2002; Bioscience, Biotechnology, and Biochemistry 66, 2406-14, 2002; Bioorganic & Medicinal Chemistry 11, 761-68, 2003; Bioscience, Biotechnology, and Biochemistry 67, 1230-8, 2003. Further, spiroheterocyclic pyrrolidine dione derivatives are known, for example, from WO 2009/049851.

It has now surprisingly been found that certain novel N-oxyamide substituted spiroheterocyclic pyrrolidine dione derivatives have good insecticidal properties.

The present invention therefore provides compounds of formula I



(I),

wherein

X , Y and Z independently of each other are C_{1-4}alkyl, C_{3-6}cycloalkyl, C_{1-4}haloalkyl, C_{1-4}alkoxy, halogen, phenyl or phenyl substituted by C_{1-4}alkyl, C_{1-4}haloalkyl, halogen or cyano;

m and n, independently of each other, are 0, 1, 2 or 3 and m+n is 0, 1, 2 or 3;

G is hydrogen, an alkali metal, alkaline earth metal, ammonium, sulfonium or a latentiating group;

R is hydrogen, C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{1-6}cyanoalkyl, benzyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl or is a group G; and

A is hydrogen, C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, or C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl where in the cycloalkyl moiety a methylene group is replaced by O, S or NR_0, where R_0 is C_{1-6}alkyl or C_{1-6}alkoxy, or A is C_{2-6}alkenyl, C_{2-6}haloalkenyl, C_{3-6}alkynyl, C_{1-6}cyanoalkyl, benzyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl, oxetanyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, C_{1-6}alkylcarbonyl, C_{1-6}alkoxycarbonyl, C_{3-6}cycloalkylcarbonyl, N-di(C_{1-6}alkyl)carbamoyl, benzoyl, C_{1-6}alkylsulfonyl or phenylsulfonyl, C_{1-4}alkylthio(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkylsulfinyl(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkylsulfonyl(C_{1-4})alkyl, furanyl-(C_{1-4})alkyl, tetrahydro-thiofuranyl, tetrahydro-thiopyranyl, 1-(C_{1-4})alkoxy-piperidin-4-yl; or an agrochemically acceptable salt or an N-oxide thereof.

In the compounds of the formula I, each alkyl moiety either alone or as part of a larger group is a straight or branched chain and is, for example, methyl, ethyl, n-propyl, n-butyl, iso-propyl, sec-butyl, iso-butyl, tert-butyl, n-pentyl, iso-pentyl and n-hexyl.

Alkoxy groups preferably have a preferred chain length of from 1 to 4 carbon atoms. Alkoxy is, for example, methoxy, ethoxy, propoxy, i-propoxy, n-butoxy, isobutoxy, sec-butoxy and tert-butoxy. Such groups can be part of a larger group such as alkoxyalkyl and alkoxyalkoxyalkyl. Alkoxyalkyl groups preferably have a chain length of 1 to 4 carbon atoms. Alkoxyalkyl is, for example, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, n-propoxymethyl, n-propoxyethyl or isopropoxymethyl.

Halogen is generally fluorine, chlorine, bromine or iodine. This also applies, correspondingly, to halogen in combination with other meanings, such as haloalkyl.

Haloalkyl groups preferably have a chain length of from 1 to 6 carbon atoms. Haloalkyl is, for example, fluoromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, chloromethyl, dichloromethyl, trichloromethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2-fluoroethyl, 2-chloroethyl, pentafluoroethyl, 1,1-difluoro-2,2,2-trichloroethyl, 2,2,3,3-tetrafluoroethyl and 2,2,2-trichloroethyl; preferably trichloromethyl, difluorochloromethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl and dichlorofluoromethyl.

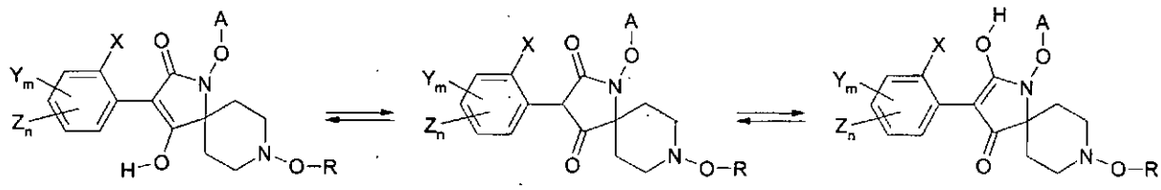
The cycloalkyl groups preferably have from 3 to 6 ring carbon atoms, for example cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl and cyclohexyl. In these rings, a methylene group can be replaced by an oxygen and/or sulphur atom, which leads, for example, to oxetanyl,

tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, furanyl, tetrahydro-thiofuranyl and tetrahydro-thiopyranyl rings.

Phenyl, also as part of a substituent such as benzyl, may be substituted, preferably by alkyl, haloalkyl or halogen groups. In this case, the substituents can be in ortho, meta and/or para position. The preferred substituent positions are the ortho and para positions to the ring attachment point.

The compounds of formula I may exist in different geometric or optical isomers or different tautomeric forms. One or more centres of chirality may be present, in which case compounds of the formula I may be present as pure enantiomers, mixtures of enantiomers, pure diastereomers or mixtures of diastereomers. Centres of tautomerisation may be present. This invention covers all such isomers and tautomers and mixtures thereof in all proportions as well as isotopic forms such as deuterated compounds.

Depending on the nature of the substituents, compounds of formula I may exist in different isomeric forms, which are all within the scope of the claimed compounds of the formula I. When G is hydrogen, for example, compounds of formula I may exist in different tautomeric forms:



This invention covers all such isomers and tautomers and mixtures thereof in all proportions. Also, when the chemical structure of substituents gives raise to the existence of isomers such as substituents, which contain double bonds and thus exist as *cis*- and *trans*-isomers, such isomers, too, are within the scope of the claimed compounds of the formula I.

The invention relates also to the agriculturally acceptable salts which the compounds of formula I are able to form with transition metal, alkali metal and alkaline earth metal bases, amines, quaternary ammonium bases or tertiary sulfonium bases.

Among the transition metal, alkali metal and alkaline earth metal salt formers, special mention should be made of the hydroxides of copper, iron, lithium, sodium, potassium, magnesium and calcium, and preferably the hydroxides, bicarbonates and carbonates of sodium and potassium.

Examples of amines suitable for ammonium salt formation include ammonia as well as primary, secondary and tertiary C_1-C_{18}alkylamines, C_1-C_4hydroxyalkylamines and C_2-C_4alkoxyalkyl-amines, for example methylamine, ethylamine, *n*-propylamine, *i*-propylamine, the four butylamine isomers, *n*-amylamine, *i*-amylamine, hexylamine, heptylamine, octylamine, nonylamine, decylamine, pentadecylamine, hexadecylamine, heptadecylamine, octadecylamine, methylethylamine, methylisopropylamine, methylhexylamine, methylnonylamine, methylpentadecylamine, methyloctadecylamine, ethylbutylamine, ethylheptylamine, ethyloctylamine, hexylheptylamine, hexyloctylamine, dimethylamine, diethylamine, di-*n*-propylamine, di-*i*-propylamine, di-*n*-butylamine, di-*n*-amylamine, di-*i*-amylamine, dihexylamine, diheptylamine, dioctylamine, ethanolamine, *n*-propanolamine, *i*-propanolamine, *N*,*N*-diethanolamine, *N*-ethylpropanolamine, *N*-butylethanolamine, allylamine, *n*-but-2-enylamine, *n*-pent-2-enylamine, 2,3-dimethylbut-2-enylamine, dibut-2-enylamine, *n*-hex-2-enylamine, propylenediamine, trimethylamine, triethylamine, tri-*n*-propylamine, tri-*i*-propylamine, tri-*n*-butylamine, tri-*i*-butylamine, tri-*sec*-butylamine, tri-*n*-amylamine, methoxyethylamine and ethoxyethylamine; heterocyclic amines, for example pyridine, quinoline, isoquinoline, morpholine, piperidine, pyrrolidine, indoline, quinuclidine and azepine; primary arylamines, for example anilines, methoxyanilines, ethoxyanilines, *o*-, *m*- and *p*-toluidines, phenylenediamines, benzidines, naphthylamines and *o*-, *m*- and *p*-chloroanilines; but especially triethylamine, *i*-propylamine and di-*i*-propylamine.

Preferred quaternary ammonium bases suitable for salt formation correspond, for example, to the formula $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$, wherein R_a, R_b, R_c and R_d are each independently of the others hydrogen or C_1-C_4alkyl. Further suitable tetraalkylammonium bases with other anions can be obtained, for example, by anion exchange reactions.

Preferred tertiary sulfonium bases suitable for salt formation correspond, for example, to the formula $[SR_eR_fR_g]OH$, wherein R_e, R_f and R_g are each independently of the others C_1-C_4 alkyl. Trimethylsulfonium hydroxide is especially preferred. Suitable sulfonium bases may be obtained from the reaction of thioethers, in particular dialkylsulfides, with

alkylhalides, followed by conversion to a suitable base, for example a hydroxide, by anion exchange reactions.

It should be understood that in those compounds of formula I, where G is a metal, ammonium or sulfonium as mentioned above and as such represents a cation, the corresponding negative charge is largely delocalised across the O-C=C-C=O unit.

The compounds of formula I according to the invention also include hydrates which may be formed during the salt formation.

The term "latentiating group" as used for the moiety G are well known to the person skilled in the art of making compounds suitable for use in plant protection products such as insecticidal, acaricidal, molluscicidal and nematocidal compounds Such latentiating groups are selected to allow its removal by one or a combination of biochemical, chemical or physical processes to afford compounds of formula I where G is H before, during or following application to the treated pests, locus of the pests or plants. Examples of these processes include enzymatic cleavage, chemical hydrolysis and photolysis. Compounds bearing such groups G may offer certain advantages, such as improved penetration of the cuticula of the plants treated, increased tolerance of crops, improved compatibility or stability in formulated mixtures containing other herbicides, herbicide safeners, plant growth regulators, fungicides or insecticides, or reduced leaching in soils.

The latentiating group G is preferably selected from the groups C_1-C_8alkyl, C_2-C_8haloalkyl, phenylC_1-C_8alkyl (wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano or by nitro), heteroarylC_1-C_8alkyl (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl, halogen, cyano or by nitro), C_3-C_8alkenyl, C_3-C_8haloalkenyl, C_3-C_8alkynyl, $C(X^a)$-R^a, $C(X^b)$-X^c-R^b, $C(X^d)$-$N(R^c)$-R^d, -SO_2-R^e, -$P(X^e)(R^f)$-R^g or CH_2-X^f-R^h wherein X^a, X^b, X^c, X^d, X^e and X^f are independently of each other oxygen or sulfur;

R^a is H, C_1-C_{18}alkyl, C_2-C_{18}alkenyl, C_2-C_{18}alkynyl, C_1-C_{10}haloalkyl, C_1-C_{10}cyanoalkyl, C_1-C_{10}nitroalkyl, C_1-C_{10}aminoalkyl, C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_7cycloalkylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkenyloxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkynylC_1-C_5oxyalkyl, C_1-C_5alkylthioC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfinylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfonylC_1-

C_5alkyl, C_2-C_8alkylideneaminoxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxycarbonylC_1-C_5alkyl, aminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylaminoC_1-C_5alkyl, *N*-C_1-C_5alkylcarbonyl-*N*-C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_6trialkylsilylC_1-C_5alkyl, phenylC_1-C_5alkyl (wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), heteroarylC_1-C_5alkyl, (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), C_2-C_5haloalkenyl, C_3-C_8cycloalkyl, phenyl or phenyl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, heteroaryl or heteroaryl substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro,

R^b is C_1-C_{18}alkyl, C_3-C_{18}alkenyl, C_3-C_{18}alkynyl, C_2-C_{10}haloalkyl, C_1-C_{10}cyanoalkyl, C_1-C_{10}nitroalkyl, C_2-C_{10}aminoalkyl, C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_7cycloalkylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkenyloxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkynyloxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylthioC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfinylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8alkylideneaminoxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxycarbonylC_1-C_5alkyl, aminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylaminoC_1-C_5alkyl, *N*-C_1-C_5alkylcarbonyl-*N*-C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_6trialkylsilylC_1-C_5alkyl, phenylC_1-C_5alkyl (wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), heteroarylC_1-C_5alkyl, (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkyl-thio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), C_3-C_5haloalkenyl, C_3-C_8cycloalkyl, phenyl or phenyl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3halo-alkoxy, halogen, cyano or nitro, heteroaryl or heteroaryl substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-$_3$haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro,

R^c and R^d are each independently of each other hydrogen, C_1-C_{10}alkyl, C_3-C_{10}alkenyl, C_3-C_{10}alkynyl, C_2-C_{10}haloalkyl, C_1-C_{10}cyanoalkyl, C_1-C_{10}nitroalkyl, C_1-C_{10}aminoalkyl, C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_7cycloalkylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkenyloxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkynyloxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylthioC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfinylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8alkylideneaminoxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxycarbonylC_1-C_5alkyl, aminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_2-

C_8dialkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylaminoC_1-C_5alkyl, *N*-C_1-C_5alkylcarbonyl-*N*-C_2-C_5alkylaminoalkyl, C_3-C_6trialkylsilylC_1-C_5alkyl, phenylC_1-C_5alkyl (wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), heteroarylC_1-C_5alkyl, (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), C_2-C_5haloalkenyl, C_3-C_8cycloalkyl, phenyl or phenyl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, heteroaryl or heteroaryl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, heteroarylamino or heteroarylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, diheteroarylamino or diheteroarylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, phenylamino or phenylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or by nitro, diphenylamino or diphenylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or by nitro or C_3-C_7cycloalkylamino, di-C_3-C_7cycloalkylamino or C_3-C_7cycloalkoxy or R^c and R^d may join together to form a 3-7 membered ring, optionally containing one heteroatom selected from O or S,

R^e is C_1-C_{10}alkyl, C_2-C_{10}alkenyl, C_2-C_{10}alkynyl, C_1-C_{10}haloalkyl, C_1-C_{10}cyanoalkyl, C_1-C_{10}nitroalkyl, C_1-C_{10}aminoalkyl, C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_7cycloalkylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkenyloxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkynyloxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylthioC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfinylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8alkylideneaminoxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxycarbonylC_1-C_5alkyl, aminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylaminoC_1-C_5alkyl, *N*-C_1-C_5alkylcarbonyl-*N*-C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_6trialkylsilylC_1-C_5alkyl, phenylC_1-C_5alkyl (wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), heteroarylC_1-C_5alkyl (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), C_2-C_5haloalkenyl, C_3-C_8cycloalkyl, phenyl or phenyl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, heteroaryl or heteroaryl substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or by nitro, heteroarylamino

or heteroarylamino substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or by nitro, diheteroarylamino or diheteroarylamino substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, phenylamino or phenylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, diphenylamino, or diphenylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, or C_3-C_7cycloalkylamino, diC_3-C_7cycloalkylamino or C_3-C_7cycloalkoxy, C_1-C_{10}alkoxy, C_1-C_{10}haloalkoxy, C_1-C_5alkylamino or C_2-C_8dialkylamino

R^f and R^g are are each independently of each other C_1-C_{10}alkyl, C_2-C_{10}alkenyl, C_2-C_{10}alkynyl, C_1-C_{10}alkoxy, C_1-C_{10}haloalkyl, C_1-C_{10}cyanoalkyl, C_1-C_{10}nitroalkyl, C_1-C_{10}aminoalkyl, C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_7cycloalkylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkenyloxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkynyloxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylthioC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfinylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8alkylideneaminoxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxycarbonylC_1-C_5alkyl, aminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylaminoC_1-C_5alkyl, *N*-C_1-C_5alkylcarbonyl-*N*-C_2-C_5alkylaminoalkyl, C_3-C_6trialkylsilylC_1-C_5alkyl, phenylC_1-C_5alkyl (wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), heteroarylC_1-C_5alkyl (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3alkylsulfonyl, halogen, cyano, or by nitro), C_2-C_5haloalkenyl, C_3-C_8cycloalkyl, phenyl or phenyl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, heteroaryl or heteroaryl substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or by nitro, heteroarylamino or heteroarylamino substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or by nitro, diheteroarylamino or diheteroarylamino substituted by C_1-C_3 alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, phenylamino or phenylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, diphenylamino, or diphenylamino substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, or C_3-C_7cycloalkylamino, diC_3-C_7cycloalkylamino or C_3-C_7cycloalkoxy, C_1-C_{10}haloalkoxy, C_1-C_5alkylamino or C_2-C_8dialkylamino, benzyloxy or phenoxy, wherein the benzyl and phenyl groups may in turn be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or nitro, and

R^h is C_1-C_{10}alkyl, C_3-C_{10}alkenyl, C_3-C_{10}alkynyl, C_1-C_{10}haloalkyl, C_1-C_{10}cyanoalkyl, C_1-C_{10}nitroalkyl, C_2-C_{10}aminoalkyl, C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_7cycloalkylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkenyloxyC_1-C_5alkyl, C_3-C_5alkynyloxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylthioC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfinylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylsulfonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8alkylideneaminoxyC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkoxycarbonylC_1-C_5alkyl, aminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_2-C_8dialkylaminocarbonylC_1-C_5alkyl, C_1-C_5alkylcarbonylaminoC_1-C_5alkyl, *N*-C_1-C_5alkylcarbonyl-*N*-C_1-C_5alkylaminoC_1-C_5alkyl, C_3-C_6trialkylsilylC_1-C_5alkyl, phenylC_1-C_5alkyl (wherein wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl, halogen, cyano or by nitro), heteroarylC_1-C_5alkyl (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl, halogen, cyano or by nitro), phenoxyC_1-C_5alkyl (wherein wherein the phenyl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3alkylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl, halogen, cyano or by nitro), heteroaryloxyC_1-C_5alkyl (wherein the heteroaryl may optionally be substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, C_1-C_3alkylthio, C_1-C_3akylsulfinyl, C_1-C_3 alkylsulfonyl, halogen, cyano or by nitro), C_3-C_5haloalkenyl, C_3-C_8cycloalkyl, phenyl or phenyl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen or by nitro, or heteroaryl, or heteroaryl substituted by C_1-C_3alkyl, C_1-C_3haloalkyl, C_1-C_3alkoxy, C_1-C_3haloalkoxy, halogen, cyano or by nitro.

In particular, the latentiating group G is a group $-C(X^a)-R^a$ or $-C(X^b)-X^c-R^b$, and the meanings of X^a, R^a, X^b, X^c and R^b are as defined above.

It is preferred that G is hydrogen, an alkali metal or alkaline earth metal, or an ammonium or sulfonium group, where hydrogen is especially preferred.

Preferably, in the compounds of the formula I, the substituent R is hydrogen, C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_2-C_6alkenyl, C_3-C_6alkynyl, benzyl or C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, in particular hydrogen, methyl, ethyl, trifluoromethyl, allyl, propargyl, benzyl, methoxymethyl, ethoxymethyl or methoxyethyl, and more particularly methyl.

Preferably, X, Y and Z denote hydrogen, C_1-C_4alkyl, C_3-C_6cycloalkyl, C_1-C_4alkoxy or halogen, in particular methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro, bromo or chloro, when m+n is 1-3, in particular, when m+n is 1-2.

Alternatively, Y and Z, independently of each other, denote hydrogen, C_1-C_4alkyl, C_3-C_6cycloalkyl, C_1-C_4alkoxy, halogen, phenyl or phenyl substituted by C_{1-4}alkyl or halogen, in particular methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro, chloro, bromo, phenyl or phenyl substituted with halogen, in particular fluoro or chloro, in particular in 4-position, when m+n is 1-3, in particular, when m+n is 1-2.

In the compounds of the formula I, the substituent A is preferably hydrogen, C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, or C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl where in the cycloalkyl moiety a methylene group is replaced by O or S, or A is C_{2-6}alkenyl, C_{3-6}alkynyl, benzyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl, oxetanyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, C_{1-4}alkylthio(C_{1-4})alkyl or furanyl(C_{1-4})alkyl,tetrahydrothiopyranyl or 1-(C_{1-4})alkoxy-piperidin-4-yl in particular hydrogen, methyl, ethyl, isopropyl, trifluoromethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2-fluoroethyl, cyclopropyl, cycclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cyclopropylmethyl, cyclobutylmethyl, cyclopentylmethyl, cyclohexylmethyl, allyl, propargyl, benzyl, methoxymethyl, ethoxymethyl, methoxyethyl, methoxyethoxymethyl, methoxymethoxyethyl, oxetan-3-yl, tetrahydrofuran-2-yl, tetrahydropyran-2-yl, tetrahydrofuran-3-yl, tetrahydropyran-4-yl, oxetan-3-ylmethyl, tetrahydrofuran-2-ylmethyl, tetrahydropyran-2-ylmethyl, tetrahydrofuran-3-ylmethyl, tetrahydropyran-3-ylmethyl, tetrahydropyran-4-ylmethyl, methylthioethyl, furan-2-ylmethyl, furan-3-ylmethyl or tetrahydro-thiopyran-4-ylmethyl.

In another preferred group of compounds of the formula (I), R is hydrogen, methyl, ethyl, trifluoromethyl, allyl, propargyl, benzyl, methoxymethyl, ethoxymethyl or methoxyethyl, X is methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro, bromo or chloro, Y and Z, independently of each other, are methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro, chloro, bromo, phenyl or phenyl substituted by halogen or C_1-C_2alkyl, G is hydrogen, A has the meanings assigned to it above and m+n is 1-3.

In a particularly preferred group of compounds of the formula (I), R is methyl, ethyl, allyl, propargyl, methoxymethyl, X is methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro, bromo or chloro, Y and Z, independently of each other, are methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro,

chloro, bromo, phenyl or phenyl substituted by halogen or C_1-C_2alkyl, G is hydrogen, A has the meanings assigned to it above, and m+n is 1-3.

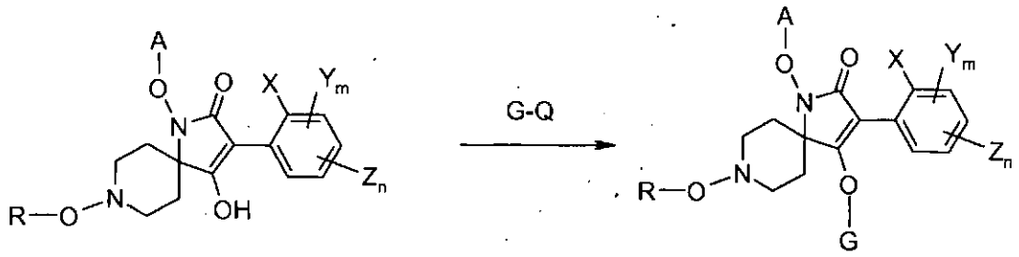
In an exceptionally preferred group of compounds of the formula (I), R is methyl, ethyl, methoxymethyl, X is methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro, bromo or chloro, Y and Z, independently of each other, are methyl, ethyl, cyclopropyl, methoxy, fluoro, chloro, bromo, phenyl or phenyl substituted by halogen or C_1-C_2alkyl, G is hydrogen, A is hydrogen, methyl, ethyl, isopropyl, trifluoromethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, 2,2-difluoroethyl, 2-fluoroethyl, cyclopropyl, cyclobutyl,cyclopentyl, cyclohexyl, cyclopropylmethyl, cyclobutylmethyl, cyclopentylmethyl, cyclohexylmethyl, allyl, propargyl, benzyl, methoxymethyl, ethoxymethyl, methoxyethyl, methoxyethoxymethyl, methoxymethoxyethyl, oxetan-3-yl, tetrahydrofuran-2-yl, tetrahydropyran-2-yl, tetrahydrofuran-3-yl, tetrahydropyran-4-yl, oxetan-3-ylmethyl, tetrahydrofuran-2-ylmethyl, tetrahydropyran-2-ylmethyl, tetrahydrofuran-3-ylmethyl, tetrahydropyran-3-ylmethyl, tetrahydropyran-4-ylmethyl, methylthioethyl, furan-2-ylmethyl, furan-3-ylmethyl or tetrahydro-thiopyran-4-ylmethyl and m+n is 1-3.
Even more preferred, R is methyl, X, Y, Z independently of each other, are methyl, fluoro, chloro, bromo or chlorophenyl, G is hydrogen and A is hydrogen, methyl, ethyl, isopropyl, cyclopropyl, cyclopropylmethyl, cyclopentylmethyl, cyclohexylmethyl, allyl, propargyl, benzyl, methoxymethyl, ethoxymethyl, methoxyethyl, methoxyethoxymethyl, methoxymethoxyethyl, oxetan-3-yl, tetrahydrofuran-2-yl, tetrahydropyran-2-yl, tetrahydrofuran-3-yl, tetrahydropyran-4-yl, oxetan-3-ylmethyl, tetrahydrofuran-2-ylmethyl, tetrahydropyran-2-ylmethyl, tetrahydrofuran-3-ylmethyl, tetrahydropyran-3-ylmethyl, tetrahydropyran-4-ylmethyl, methylthioethyl, methylsulfinylethyl, methylsulfonylethyl, furan-2-ylmethyl, furan-3-ylmethyl or tetrahydro-thiopyran-4-ylmethyl and m+n is 1-3.

The invention covers also salts of the compounds of the formula I with amines, alkali metal and alkaline earth metal bases or quaternary ammonium bases.
Among the alkali metal and alkaline earth metal hydroxides as salt formers, special mention should be made of the hydroxides of lithium, sodium, potassium, magnesium and calcium, but especially the hydroxides of sodium and potassium. The compounds of formula I according to the invention also include hydrates which may be formed during the salt formation.
Examples of amines suitable for ammonium salt formation include ammonia as well as primary, secondary and tertiary C_1-C_{18}alkylamines, C_1-C_4hydroxyalkylamines and C_2-C_4alkoxyalkylamines, for example methylamine, ethylamine, n-propylamine,

isopropylamine, the four butylamine isomers, n-amylamine, isoamylamine, hexylamine, heptylamine, octylamine, nonylamine, decylamine, pentadecylamine, hexadecylamine, heptadecylamine, octadecylamine, methylethylamine, methylisopropylamine, methylhexylamine, methylnonylamine, methylpentadecylamine, methyloctadecylamine, ethylbutylamine, ethylheptylamine, ethyloctylamine, hexylheptylamine, hexyloctylamine, dimethylamine, diethylamine, di-n-propylamine, diisopropylamine, di-n-butylamine, di-n-amylamine, diisoamylamine, dihexylamine, diheptylamine, dioctylamine, ethanolamine, n-propanolamine, isopropanolamine, N,N-diethanolamine, N-ethylpropanolamine, N-butylethanolamine, allylamine, n-but-2-enylamine, n-pent-2-enylamine, 2,3-dimethylbut-2-enylamine, dibut-2-enylamine, n-hex-2-enylamine, propylenediamine, trimethylamine, triethylamine, tri-n-propylamine, triisopropylamine, tri-n-butylamine, triisobutylamine, tri-sec-butylamine, tri-n-amylamine, methoxyethylamine and ethoxyethylamine; heterocyclic amines, for example pyridine, quinoline, isoquinoline, morpholine, piperidine, pyrrolidine, indoline, quinuclidine and azepine; primary arylamines, for example anilines, methoxyanilines, ethoxyanilines, o-, m- and p-toluidines, phenylenediamines, benzidines, naphthylamines and o-, m- and p-chloroanilines; but especially triethylamine, isopropylamine and diisopropylamine.

Preferred quaternary ammonium bases suitable for salt formation correspond, for example, to the formula $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$ wherein R_a, R_b, R_c and R_d are each independently of the others C_1-C_4alkyl. Further suitable tetraalkylammonium bases with other anions can be obtained, for example, by anion exchange reactions.

The compounds of the invention may be made by a variety of methods. For example, the compounds of formula I, wherein the substituents have the meanings assigned to them above, can be prepared by means of processes known *per se*, e.g. by treating compounds of formula II with an alkylating, acylating, phosphorylating or sulfonylating agent G-Q in the presence of at least one equivalent of a base, where G is the alkyl, acyl, phosphoryl or sulfonyl group to be incorporated and Q is a nucleofuge:



(II) (I)

Compounds of formula I, wherein G is a latentiating group of the formula $-C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$ or $-C(X^d)-NR^cR^d$ may be prepared by known procedures as described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266. Typically, compounds of formula II are treated with an acylating agent such as an acid halide (especially acid chloride), acid anhydride, haloformate (especially chloroformate), halothioformate (especially chlorothioformate), isocyanate, isothiocycanate, carbamoyl halide (especially carbamoyl chloride) or thiocarbamoyl halide (especially thiocarbamoyl chloride) in the presence of at least one equivalent of a suitable base, optionally in the presence of a suitable solvent. The base may be inorganic such as an alkali metal carbonate or hydroxide or a metal hydride, or an organic base such as a tertiary amine or metal alkoxide. Examples of suitable inorganic bases include sodium carbonate, sodium or potassium hydroxide, sodium hydride, and suitable organic bases include trialkylamines such as trimethylamine and triethylamine, pyridines or other amine bases such as 1,4-diazobicyclo[2.2.2]octane and 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene. Preferred bases include triethylamine and pyridine. Suitable solvents for this reaction are selected to be compatible with the reagents and include ethers such as tetrahydrofuran and 1,2-dimethoxyethane and halogenated solvents such as dichloromethane and chloroform. Certain bases, such as pyridine and triethylamine, may be employed successfully as both base and solvent. For cases, where the acylating agent is a carboxylic acid, acylation is preferably effected in the presence of a coupling agent such as 2-chloro-1-methylpyridinium iodide, *N,N'*-dicyclohexycarbodiimide, 1-(3-dimethylaminopropyl)-3-ethylcarbodiimide and *N,N'*-carbodiimidazole, and a base such as triethylamine or pyridine in a suitable solvent such as tetrahydrofuran, dichloromethane and acetonitrile. Suitable procedures are described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.

Compounds of formula I, wherein G is a latentiating group of the formula $C(X^b)-X^c-R^b$ or $-C(X^d)-NR^cR^d$, may be also be prepared by treating compounds of formula II with phosgene or a phosgene equivalent, optionally in the presence of a solvent such as toluene or ethyl

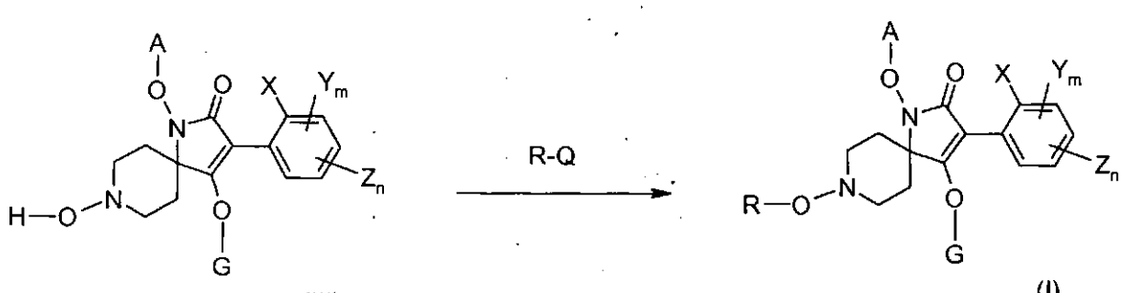
acetate, and a base and reacting the resultant chloroformate, or equivalent, with an alcohol, thiol or amine under known conditions, as described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.

Compounds of formula I, wherein G is a latentiating group of the formula $-P(X^e)R^fR^g$ may be prepared from compounds of formula II using procedures described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.

Compounds of formula I, wherein G is a latentiating group of the formula $-SO_2R^e$, may be prepared by reaction of compounds of formula II with an alkyl or aryl sulfonyl halide, preferably in the presence of at least one equivalent of base.

Compounds of formula I, wherein G is C_1-C_6alkyl, C_2-C_6alkenyl, C_3-C_6alkynyl or a latentiating group of the formula CH_2-X^f-R^h, may be prepared by treatment of a compound of formula II with a compound of formula G-Y wherein Y is a halogen (especially bromine or iodine), sulfonate (especially mesylate or tosylate) or a sulfate preferably in the presence of a base, under known conditions.

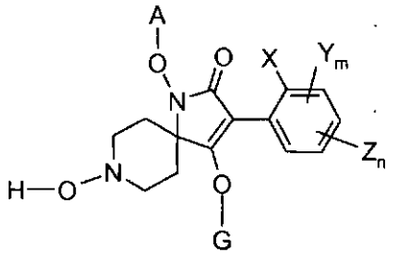
Compounds of formula I, in which R represents $-C(X^a)$-R^a, $C(X^b)$-X^c-R^b or $-C(X^d)$-NR^cR^d SO_2R^e, $P(X^e)R^fR^g$ or CH_2-X^f-R^h, can be obtained by treating compounds of formula III with an alkylating, acylating, phosphorylating or sulfonylating agent R-Q, wherein Q represents a nucleofuge, in the presence of at least one equivalent of a base.



(III) (I)

Suitable conditions are the same as described above for the conversion of compounds of formula II to compounds of formula I.

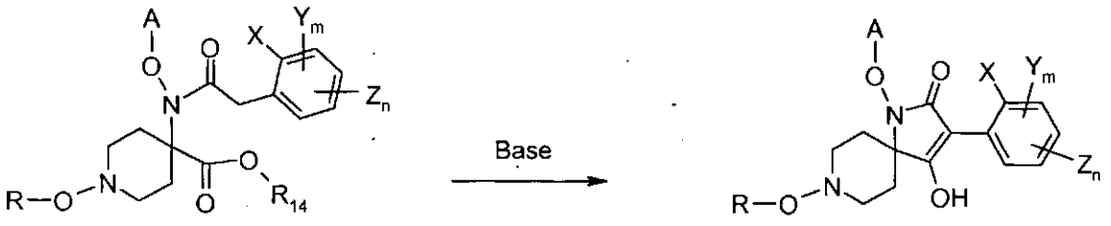
Compounds of formula III



(III)

can be obtained by catalytic hydrogenation of compounds of formula I, in which R is represented by a benzyl group.

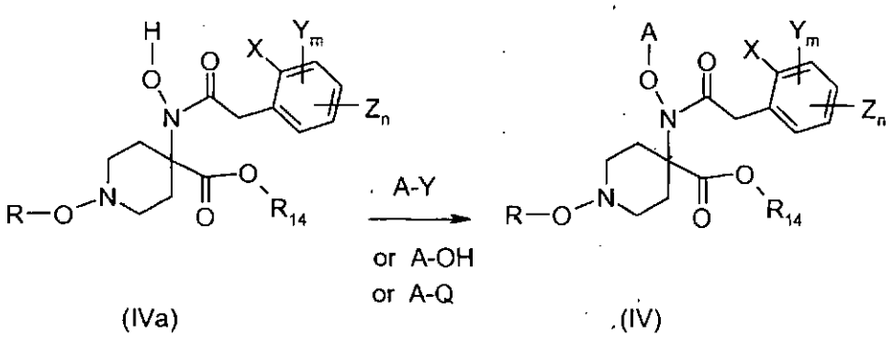
Compounds of formula II may be prepared via the cyclisation of compounds of formula IV,



(IV) (II)

wherein R_{14} is C_1-C_6 alkyl, preferably in the presence of base, and optionally in the presence of a suitable solvent, by methods described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.

Compounds of formula IV, wherein R_{14} is as defined above and wherein A is C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, or C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl where in the cycloalkyl moiety a methylene group is replaced by O, S or NR_0, where R_0 is C_{1-6}alkyl or C_{1-6}alkoxy, or A is C_{2-6}alkenyl, C_{2-6}haloalkenyl, C_{3-6}alkynyl, C_{1-6}cyanoalkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl, oxetan-3-yl, tetrahydrofuran-3-yl, tetrahydropyran-3-yl, tetrahydropyran-4-yl or benzyl may be prepared by treatment of a compound of formula IVa (A=H) with an alkylating agent of formula A-Y, wherein A is the alkyl group to be incorporated and Y is a halogen (especially bromine or iodine), sulfonate (especially mesylate or tosylate) or a sulfate, preferably in the presence of a base, under known conditions.



(IVa) (IV)

Alternatively, compounds of formula IV, wherein R_{14} is as defined above and wherein A is C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl(C_{4-4})alkyl, or C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl where in the cycloalkyl moiety a methylene group is replaced by O, S or NR_0, where R_0 is C_{1-6}alkyl or C_{1-6}alkoxy, or A is C_{2-6}alkenyl, C_{2-6}haloalkenyl, C_{3-6}alkynyl, C_{1-6}cyanoalkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl, oxetan-3-yl, tetrahydrofuran-3-yl, tetrahydropyran-3-yl, tetrahydropyran-4-yl or benzyl may be prepared by treatment of a compound of formula IVa (A=H) with an alcohol of formula A-OH, wherein A is the alkyl group to be incorporated, under the known conditions of the Mitsunobu reaction. Typically, the alcohol A-OH is reacted with the hydroxamic acid derivative IVa in the presence of a dialkyl azodicarboxylate (preferably diethyl azodicarboxylate DEAD, diisopropyl azodicarboxylate DIAD, 1,1'-(azodicarbonyl)dipiperidine ADDP, N,N,N',N'-tetramethylazodicarboxamide TMAD or equivalents) and a trialkyl- or triaryl phosphine (preferably triphenyl phosphine, tributyl phosphine or equivalents) usually in solvents like tetrahydrofuran, dioxane, dichloromethane, chloroform, dimethylformamide, toluene or benzene at -20 to 80°C, preferably at 0°C to 30°C. These known conditions are described for example by O. Mitsunobu, Synthesis 1981, 1-28; B.R. Castro, Org. React. 1983, 29, 1-162; D.L. Hughes, Org. React. 1992, 42, 335-656 or D.L. Hughes, Org. Prep. Preced. Int. 1996, 28, 127-164.

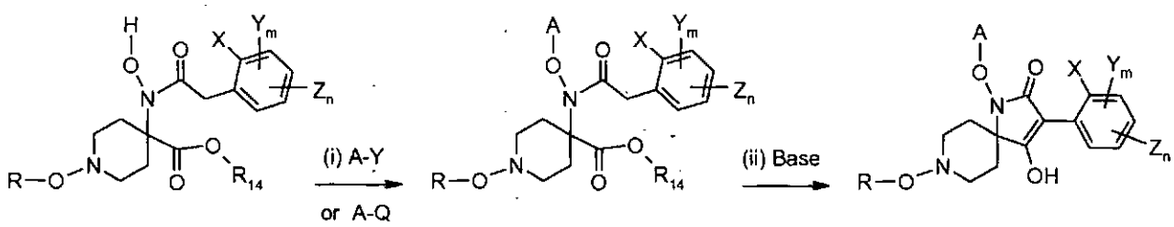
Compounds of formula IV, wherein R_{14} is as defined above and wherein A is tetrahydrofuran-2-yl or tetrahydropyran-2-yl may be prepared by treatment of a compound of formula IVa (A=H) with 2,3-dihydro-furan or 3,4-dihydro-2H-pyran preferably in the presence of an acid catalyst (especially p-toluene sulfonic acic or pyridinium p-toluenesulfonate), under known conditions described for example by Shanzer at al., J.Am.Chem.Soc. 129, 347-354, (2007).

Compounds of formula IV, in which R_{14} is as defined above and in which A represents C_{1-6}alkylcarbonyl, C_{1-6}alkoxycarbonyl, C_{3-6}cycloalkylcarbonyl, N-di(C_{1-6}alkyl)carbamoyl, benzoyl, C_{1-6}alkylsulfonyl or phenylsulfonyl, can be obtained by treating compounds of formula IVa (A=H) with an acylating or sulfonylating agent A-Q, wherein A is the acyl or sulfonyl group to be incorporated and Q represents a nucleofuge, in the presence of at least one equivalent of a base, under known conditions.

Compounds of formula IV, wherein R_{14} is as defined above and wherein A is C_{1-6}alkylcarbonyl, C_{1-6}alkoxycarbonyl, C_{3-6}cycloalkylcarbonyl or N-di(C_{1-6}alkyl)carbamoyl, may also be prepared by treating compounds of formula IVa (A=H) with phosgene or a phosgene equivalent, optionally in the presence of a solvent such as toluene or ethyl acetate, and a base and reacting the resultant chloroformate, or equivalent, with an alcohol or an amine, under known conditions.

Compounds of formula IV, wherein R_{14} is as defined above and wherein A is C_{1-6}alkylsulfonyl or phenylsulfonyl, may be prepared by reaction of compounds of formula IVa (A=H) with an alkyl or phenyl sulfonyl halide, preferably in the presence of at least one equivalent of base, under known conditions.

Suitable conditions are the same as described above for the conversion of compounds of formula II to compounds of formula I.

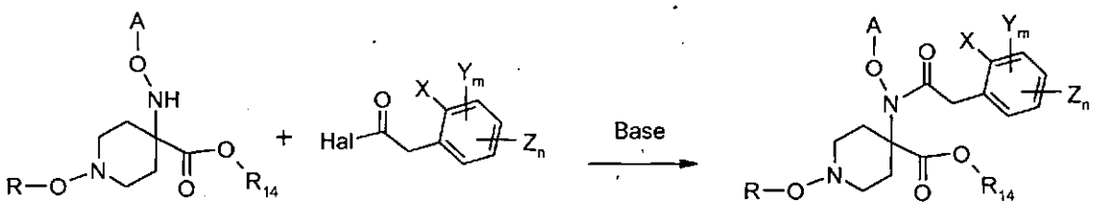


(IVa) (IV) (II)

Compounds of formula II may also be prepared in a two-step one-pot process involving (i) O-alkylation, acylation or sulfonylation of compounds of formula IVa with an agent A-Y or A-Q, where A is the alkyl, acyl or sulfonyl group to be incorporated and wherein Y and Q represents a nucleofuge as defined above, in the presence of at least one equivalent of a base, and

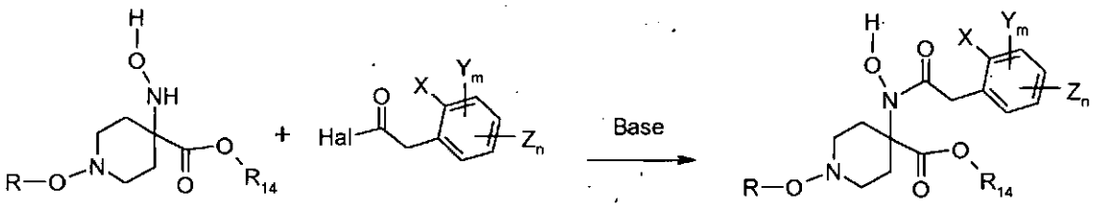
(ii) cyclisation of the intermediate compounds of formula IV, preferably in the presence of additional base, at least one more equivalent, and optionally in the presence of a suitable solvent, by methods described above.

R_{14} is typically C_1-C_6 alkyl. The base for steps (i) and (ii) may be the same or different.



(V) (VI) (IV)

Compounds of the general formula IV may be prepared by reacting O-substituted α-hydroxylamino acid derivatives of formula V with phenylacetyl halides of formula VI, preferably in the presence of a base in a suitable solvent by known methods described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.

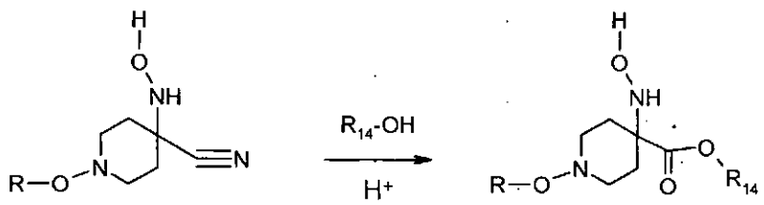


(Va) (VI) (IVa)

For the particular situation where A is hydrogen, compounds of formula IVa may be prepared by reacting α-hydroxylamino acid derivatives of formula Va with phenylacetyl halides of formula VI, preferably in the presence of a base in a suitable solvent under known methods. Of extreme advantage are acylation methods of α-hydroxylamino acid derivatives of formula Va where N-acylation selectivity can be achieved according, for example, to Vallée and Blandin, Organic & Biomolecular Chemistry, 4, 3125-3141, (2006) or to WO 1996/35714, and whereby the use of transition metal, alkali metal, and alkaline earth metal bases is preferred. The use of a mild base, especially bicarbonates and carbonates of lithium, sodium, potassium and cesium, and more particularly lithium, sodium, potassium and cesium hydrogen carbonate, and even more particularly sodium

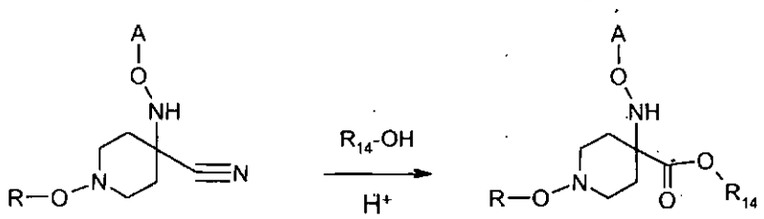
and potassium hydrogen carbonate in solvents like dichloromethane, tetrahydrofuran, dioxane or mixtures thereof are preferred reaction conditions. The solvent system for these mild basic acylation conditions may also be aqueous biphasic employing, for example, ethyl acetate (or dichloromethane, or any related organic solvent) and water, as decribed, for example, by Ito et al., Heterocycles, 57, 881-894, (2002).

Phenylacetyl halides of formula VI, wherein Hal is Cl or Br, are known compounds or can be prepared by known methods as described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.



(VIIa) (Va)

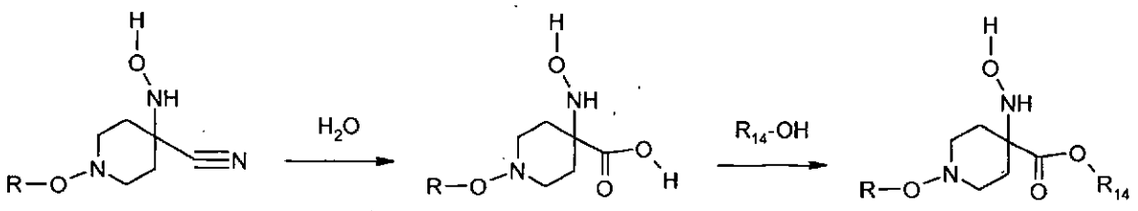
α-Hydroxylamino acid esters of the formula Va, wherein R_{14} is C_1-C_6 alkyl, may be prepared by reacting α-hydroxylamino nitriles of the formula VIIa with an alcohol of the formula $R_{14}OH$, preferably in the presence of a strong acid (especially sulfuric acic or hydrochlorid acid), under known conditions.



(VII) (V)

More generally, α-hydroxylamino O-substituted acid esters of the formula V, wherein R_{14} is C_1-C_6 alkyl and wherein A is as defined above, may be prepared by reacting α-hydroxylamino O-substituted nitriles of the formula VII with an alcohol of the formula

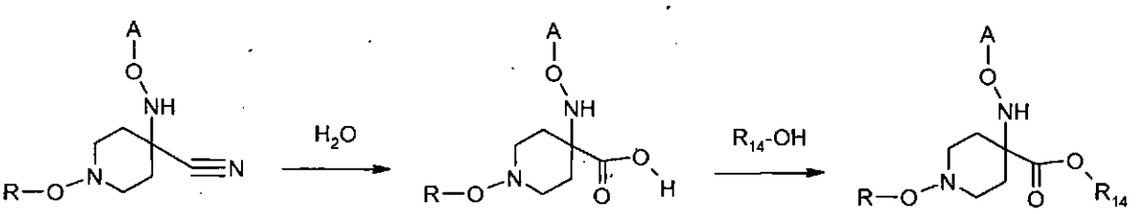
$R_{14}OH$, preferably in the presence of a strong acid (especially sulfuric acic or hydrochlorid acid), under known conditions.



(VIIa) (XIa) (Va)

α-Hydroxylamino acid esters of the formula Va, wherein R_{14} is C_1-C_6 alkyl, can also be prepared by known methods from α-hydroxylamino acids of formula XIa. Esterification of XIa with an alcohol of the formula $R_{14}OH$ under thionyl chloride activation is a typical example for the preparation of esters Va, as described for example in WO09/049851, but other known esterification methods may also be applied, like for example treatment of a compound of the formula XIa with an alcohol of the formula $R_{14}OH$ under acidic conditions (typically H_2SO_4 or HCl). For the particular situation where R_{14} is methyl, a compound of the formula XIa may also be treated with diazomethane or trimethylsilyldiazomethane, or with acetyl chloride in methanol. The compounds XIa and Va can be isolated as free amines or amine salts.

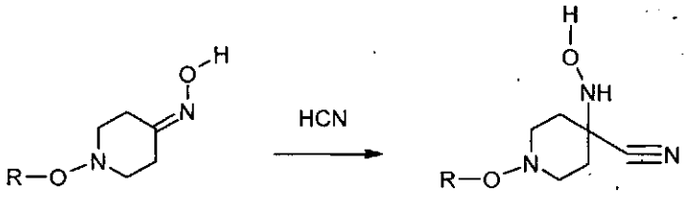
α-Hydroxylamino acids of formula XIa can themselves be prepared by known methods, typically under hydrolysis conditions usually either acidic or basic, from α-hydroxylamino nitriles of formula VIIa. A representative example for the nitrile hydrolysis (compound VIIa) into its corresponding carboxylic acid functionality (compound XIa) under aqueous H_2SO_4 or HCl conditions may be found, for example, in E.F.G. Duynstee et al., Recueil Trav. Chim. Pays-Bas 84, 1442-1451, (1965).



(VII) (XI) (V)

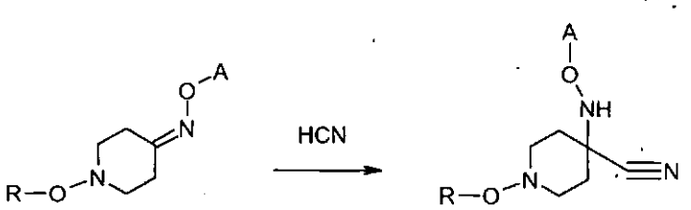
More generally, α-hydroxylamino O-substituted acid esters of the formula V, wherein R_{14} is C_1-C_6 alkyl and wherein A is as defined above, can also be prepared by known methods from α-hydroxylamino O-substituted acids of formula XI. Esterification of XI with an alcohol of the formula $R_{14}OH$ under thionyl chloride activation is a typical example for the preparation of esters V, as described for example in WO09/049851, but other known esterification methods may also be applied, like for example treatment of a compound of the formula XI with an alcohol of the formula $R_{14}OH$ under acidic conditions (typically H_2SO_4 or HCl). For the particular situation where R_{14} is methyl, a compound of the formula XI may also be treated with diazomethane or trimethylsilyldiazomethane, or with acetyl chloride in methanol. The compounds XI and V can be isolated as free amines or amine salts.

α-Hydroxylamino O-substituted acids of formula XI can themselves be prepared by known methods, typically under hydrolysis conditions usually either acidic or basic, from α-hydroxylamino O-substituted nitriles of formula VII.



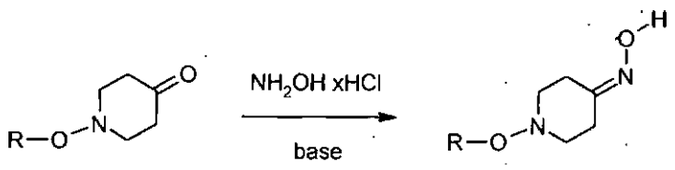
(VIIIa) (VIIa)

α-Hydroxylamino nitriles of the formula VIIa may be prepared by reacting oximes of the formula VIIIa with hydrogen cyanide, under known conditions. Particularly advantageous is the mild method using a cyanide source (especially sodium or potassium cyanide) in an aqueous phosphate buffer according, for example, to Porter and Hellerman, J.Am.Chem.Soc. 66, 1652-55, (1944) and J.Am.Chem.Soc. 61, 754, (1939).



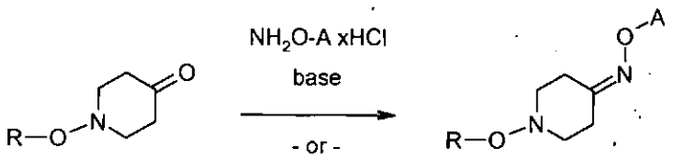
(VIII) (VII)

More generally, α-hydroxylamino O-substituted nitriles of the formula VII, wherein A is as defined above, may be prepared by reacting O-substituted oximes of the formula VIII with hydrogen cyanide, under known conditions. Particularly advantageous is the mild method using a cyanide source (especially sodium or potassium cyanide) in an aqueous phosphate buffer according, for example, to Porter and Hellerman, J.Am.Chem.Soc. 66, 1652-55, (1944) and J.Am.Chem.Soc. 61, 754, (1939).



(IX) (VIIIa)

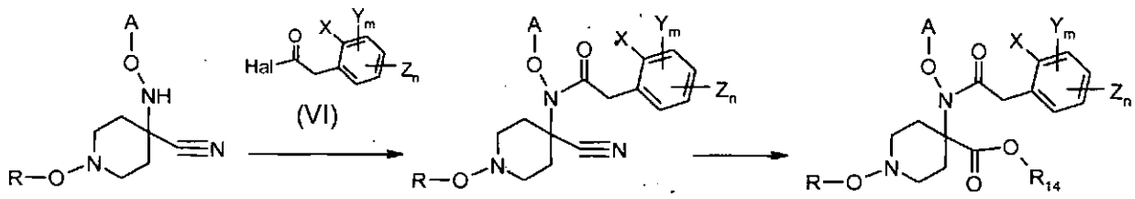
Oximes of the formula VIIIa may be prepared by reacting ketones of the formula IX with hydroxyl amine hydrochloride (or hydroxyl amine free base; or another hydrohalide salt or equivalent salt of hydroxylamine), optionally in the presence of a base and in a suitable solvent, under standard conditions.



(IX) (VIII)

More generally, O-substituted oximes of the formula VIII, wherein A is as defined above, may be prepared by reacting ketones of the formula IX with an O-substituted hydroxyl amine hydrochloride of the formula H_2NO-A xHCl (or another hydrohalide salt or equivalent salt of the corresponding O-substituted hydroxyl amine H_2NO-A), preferably in the presence of a base and in a suitable solvent, under standard conditions. Ketones of the formula IX may also be reacted with an O-substituted hydroxyl amine free base of the formula H_2NO-A under similar standard reaction conditions.

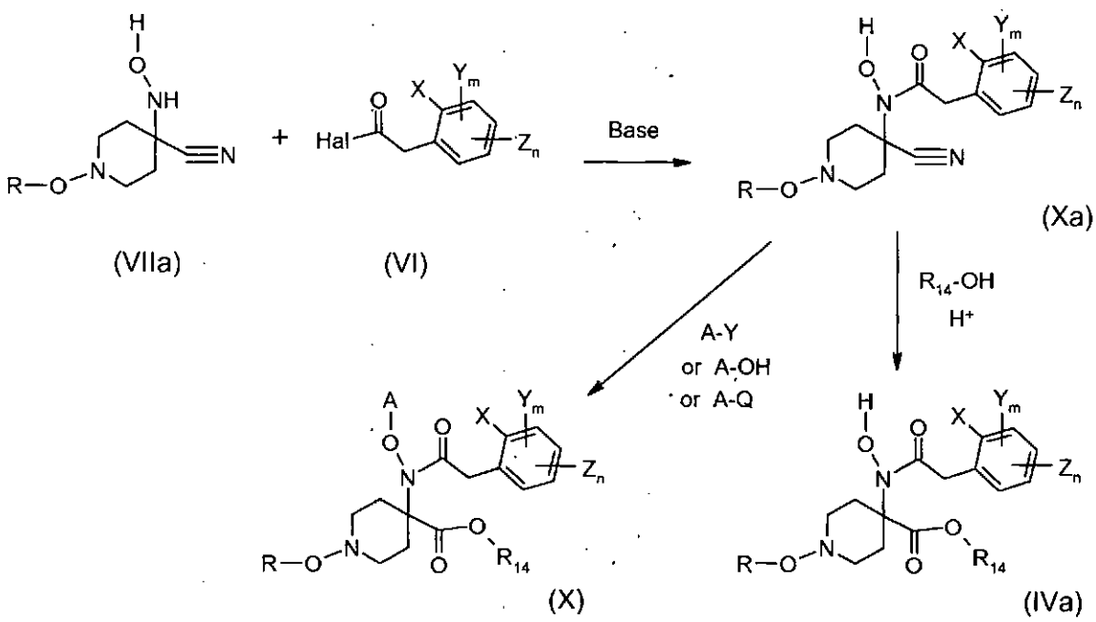
Compounds of the formula IX, where R is C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{1-6}cyanoalkyl, C_2-C_6alkenyl, C_3-C_6alkynyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl or a benzyl group, are known or can be obtained, for example, according to Major and Dursch, Journal of Organic Chemistry 26, 1867-74, (1961).



(VII) (X) (IV)

Alternatively, compounds of the general formula IV may be prepared by subjecting derivatives of the formula X to alcoholysis with $R_{14}OH$, preferably in a strong acidic media (especially sulfuric acic or hydrochlorid acid) by known methods described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.

Compounds of the formula X may be themselves prepared by reacting O-substituted α-hydroxylamino nitriles of the formula VII with phenylacetyl halides of the formula VI, preferably in the presence of a base in a suitable solvent by known methods described, for example, in WO 2000/068196 and JP 200107266.

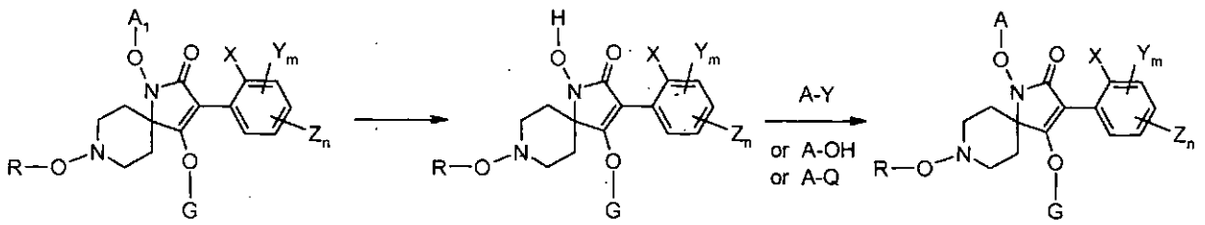


(VIIa) (VI) (Xa) (X) (IVa)

These reaction conditions do also apply for the particular situation where A is hydrogen, allowing to prepare compounds of the formula IVa from α-hydroxylamino nitriles of the formula VIIa via compounds of the formula Xa.

Compounds of formula X, in which R_{14} and A are as defined above, can moreover be obtained by treating compounds of formula Xa (A=H) with agents A-Y, A-OH, A-Q or 2,3-dihydro-furan or 3,4-dihydro-2H-pyran, wherein A, Y and Q are as defined above, under

the same conditions described above for the conversion of compounds of the formula IVa into compounds of the formula IV.



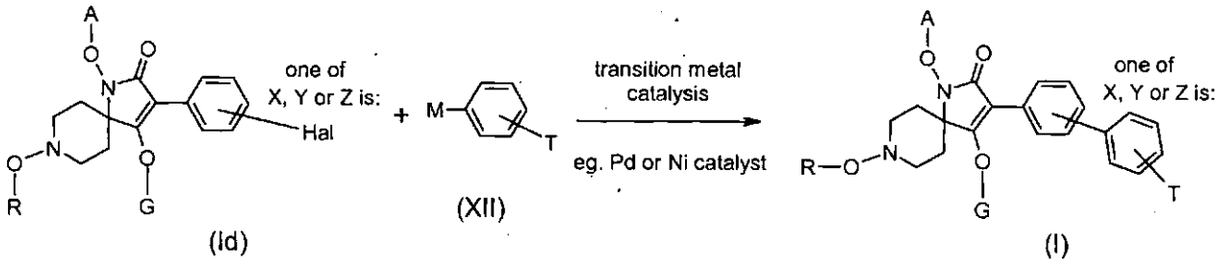
(Ib) (Ia) (I)

Compounds of the formula I may also be prepared by treatment of a compound of the formula Ia (A=H) with an alkylating, acylating or sulfonylating agent A-Y or A-Q, where A is the alkyl, acyl or sulfonyl group to be incorporated and wherein Y and Q represents a nucleofuge as defined above, in the presence of at least one equivalent of a base, and under the conditions for the transformation of a compound of the formula IVa into a compound of the formula IV described above.

Alternatively, compounds of the formula I may also be prepared by treatment of a compound of the formula Ia (A=H) with an alcohol A-OH, where A is the alkyl group to be incorporated, under the Mitsunobu reaction conditions for the transformation of a compound of the formula IVa into a compound of the formula IV described above.

Compounds of formula I, wherein A is tetrahydrofuran-2-yl or tetrahydropyran-2-yl may be prepared by treatment of a compound of formula Ia (A=H) with 2,3-dihydro-furan or 3,4-dihydro-2H-pyran preferably in the presence of an acid catalyst (especially p-toluene sulfonic acic or pyridinium p-toluenesulfonate), under known conditions described for example by Shanzer at al., J.Am.Chem.Soc. 129, 347-354, (2007).

Compounds of the formula Ia may be themselves prepared from compounds of the formula Ib incorporating a group A_1 which can easily be cleaved. A_1 represents a particular sub-group of the defined group A above. As an example, for the particular situation where A_1 is represented by a benzyl group, compounds of the formula Ia can be obtained by catalytic hydrogenation of compounds of formula Ib. Likewise, for the particular situation where A_1 is represented by a CH_2OMe group, compounds of the formula Ia can be obtained by treatment of compounds of formula Ib with, for example, trimethylsilyl iodide or trimethylsilyl bromide under known conditions.



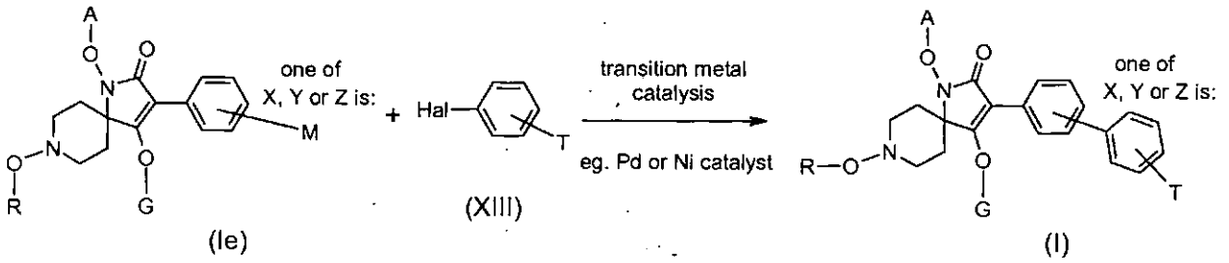
(Id) (XII) (I)

Hal is chlorine, bromine or iodine, or a pseudohalogen such as triflate

M is B, Sn, Mg, Zn, etc.. together with ligands and/or substituents

T is C_{1-4}alkyl, C_{1-4}haloalkyl, halogen or cyano

Compounds of the formula I, wherein X, Y or Z is phenyl or phenyl substituted by C_{1-4}alkyl, C_{1-4}haloalkyl, halogen or cyano, may be prepared by reacting a corresponding halogen precursor of the formula Id, wherein Hal is chlorine, bromine, iodine or a pseudohalogen such as C_{1-4}haloalkylsulfonate, especially triflate, with an appropriate organometallic phenyl species of the formula XII, wherein T is C_{1-4}alkyl, C_{1-4}haloalkyl, halogen or cyano and M is for example B, Sn, Si, Mg or Zn holding further ligands and/or substituents, by means of a transition metal-catalyzed reaction. The organometallic species of the formula XII is for example an aryl boronic acid T-Phenyl-$B(OH)_2$, or a suitable salt or ester thereof, which will react with a compound of the formula Id under palladium- or nickel-catalyzed conditions, such as for example the Suzuki-Miyaura conditions. A variety of metals, catalysts and ligands may be used in this reaction type. Reaction conditions and catalytic systems for such a transformation have been described, for example, in WO08/071405.



(Ie) (XIII) (I)

M is B, Sn, Mg, Zn, etc.. together with ligands and/or substituents

Hal is chlorine, bromine or iodine, or a pseudohalogen such as triflate

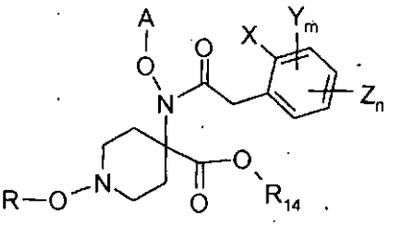
T is C_{1-4}alkyl, C_{1-4}haloalkyl, halogen or cyano

One person skilled in the art will recognize that the polarity at the two reacting centers in this cross-coupling process may be reversed. Compounds of the formula I, wherein X, Y or Z is phenyl or phenyl substituted by C_{1-4}alkyl, C_{1-4}haloalkyl, halogen or cyano, may be also prepared by reacting a corresponding organometallic species of the formula Ie, wherein M is for example B, Sn, Si, Mg or Zn holding further ligands and/or substituents, with an aryl halide of the formula XIII, wherein Hal is chlorine, bromine, iodine or a pseudohalogen

such as C_{1-4}haloalkylsulfonate, especially triflate, by means of a transition metal-catalyzed reaction and under similar conditions as described above.

The sulfur oxidation state of compounds of the formula I, II, III, IV and X, and of intermediates of the formula V, VII, VIII and XI, wherein A is incorporating such a S atom, like for example when A is C_{1-4}alkylthio(C_{1-4})alkyl, may be easily adapted from the sulfide oxidation state into the sulfoxide or sulfone level by means of an oxidation reaction involving reagents such as, for example, m-chloroperbenzoic acid (MCPBA), oxone, sodium periodate, sodium hypochlorite or tert-butyl hypochlorite amongst many others.

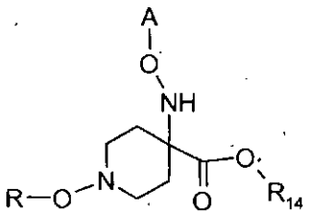
Compounds of the formula IV, V, VII and X, and salts thereof, are novel, have been specifically designed for the synthesis of the compounds of the formula I and as such form a further aspect of the invention. Thus compounds of the formula IV



(IV),

and salts thereof, wherein X, Y, Z, m, n, R and A have the meanings assigned to them above and wherein R_{14} is C_{1-6}alkyl;

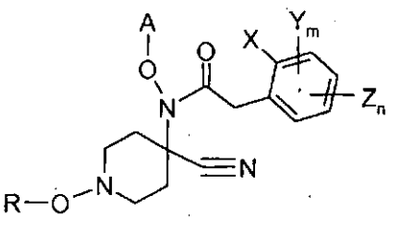
compounds of the formula V



(V),

and salts thereof, wherein R and A have the meanings assigned to them above and wherein R_{14} is C_1-C_6alkyl;

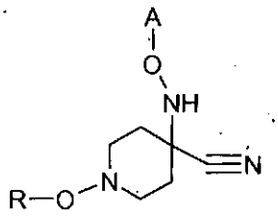
compounds of the formula X



(X),

and salts thereof, wherein X, Y, Z, m, n, R and A have the meanings assigned to them above and

compounds of the formula VII



(VII),

and salts thereof, wherein R and A have the meanings assigned to them above are novel.

The remaining starting compounds and intermediates of the reaction schemes are known or can be prepared according to methods known to a person skilled in the art.

The reactants can be reacted in the presence of a base. Examples of suitable bases are alkali metal or alkaline earth metal hydroxides, alkali metal or alkaline earth metal hydrides, alkali metal or alkaline earth metal amides, alkali metal or alkaline earth metal alkoxides, alkali metal or alkaline earth metal acetates, alkali metal or alkaline earth metal carbonates, alkali metal or alkaline earth metal dialkylamides or alkali metal or alkaline earth metal alkylsilylamides, alkylamines, alkylenediamines, free or N-alkylated saturated or unsaturated cycloalkylamines, basic heterocycles, ammonium hydroxides and carbocyclic amines. Examples which may be mentioned are sodium hydroxide, sodium hydride, sodium amide, sodium methoxide, sodium acetate, sodium carbonate, potassium tert-butoxide, potassium hydroxide, potassium carbonate, potassium hydride, lithium diisopropylamide, potassium bis(trimethylsilyl)amide, calcium hydride, triethylamine, diisopropylethylamine, triethylenediamine, cyclohexylamine, N-cyclohexyl-N,N-dimethylamine, N,N-diethylaniline, pyridine, 4-(N,N-dimethylamino)pyridine, quinuclidine, N-methylmorpholine, benzyltrimethylammonium hydroxide and 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene (DBU).

The reactants can be reacted with each other as such, i.e. without adding a solvent or diluent. In most cases, however, it is advantageous to add an inert solvent or diluent or a mixture of these. If the reaction is carried out in the presence of a base, bases which are employed in excess, such as triethylamine, pyridine, N-methylmorpholine or N,N-diethylaniline, may also act as solvents or diluents.

The reaction is advantageously carried out in a temperature range from approximately -80°C to approximately +140°C, preferably from approximately -30°C to approximately +100°C, in many cases in the range between ambient temperature and approximately +80°C.

A compound I can be converted in a manner known per se into another compound I by replacing one or more substituents of the starting compound I in the customary manner by (an)other substituent(s) according to the invention.

Depending on the choice of the reaction conditions and starting materials which are suitable in each case, it is possible, for example, in one reaction step only to replace one substituent by another substituent according to the invention, or a plurality of substituents can be replaced by other substituents according to the invention in the same reaction step.

Salts of compounds I can be prepared in a manner known per se. Thus, for example, acid addition salts of compounds I are obtained by treatment with a suitable acid or a suitable ion exchanger reagent and salts with bases are obtained by treatment with a suitable base or with a suitable ion exchanger reagent.

Salts of compounds I can be converted in the customary manner into the free compounds I, acid addition salts, for example, by treatment with a suitable basic compound or with a suitable ion exchanger reagent and salts with bases, for example, by treatment with a suitable acid or with a suitable ion exchanger reagent.

Salts of compounds I can be converted in a manner known per se into other salts of compounds I, acid addition salts, for example, into other acid addition salts, for example by treatment of a salt of inorganic acid such as hydrochloride with a suitable metal salt such as a sodium, barium or silver salt, of an acid, for example with silver acetate, in a suitable solvent in which an inorganic salt which forms, for example silver chloride, is insoluble and thus precipitates from the reaction mixture.

Depending on the procedure or the reaction conditions, the compounds I, which have salt-forming properties can be obtained in free form or in the form of salts.

The compounds I and, where appropriate, the tautomers thereof, in each case in free form or in salt form, can be present in the form of one of the isomers which are possible or as a mixture of these, for example in the form of pure isomers, such as antipodes and/or diastereomers, or as isomer mixtures, such as enantiomer mixtures, for example racemates, diastereomer mixtures or racemate mixtures, depending on the number, absolute and relative configuration of asymmetric carbon atoms which occur in the molecule and/or depending on the configuration of non-aromatic double bonds which occur in the molecule; the invention relates to the pure isomers and also to all isomer mixtures which are possible and is to be understood in each case in this sense hereinabove and hereinbelow, even when stereochemical details are not mentioned specifically in each case.

Diastereomer mixtures or racemate mixtures of compounds I, in free form or in salt form, which can be obtained depending on which starting materials and procedures have been chosen can be separated in a known manner into the pure diasteromers or racemates on the basis of the physicochemical differences of the components, for example by fractional crystallization, distillation and/or chromatography.

Enantiomer mixtures, such as racemates, which can be obtained in a similar manner can be resolved into the optical antipodes by known methods, for example by recrystallization from an optically active solvent, by chromatography on chiral adsorbents, for example high-performance liquid chromatography (HPLC) on acetyl celulose, with the aid of suitable microorganisms, by cleavage with specific, immobilized enzymes, via the formation of inclusion compounds, for example using chiral crown ethers, where only one enantiomer is complexed, or by conversion into diastereomeric salts, for example by reacting a basic end-product racemate with an optically active acid, such as a carboxylic acid, for example camphor, tartaric or malic acid, or sulfonic acid, for example camphorsulfonic acid, and separating the diastereomer mixture which can be obtained in this manner, for example by fractional crystallization based on their differing solubilities, to give the diastereomers, from which the desired enantiomer can be set free by the action of suitable agents, for example basic agents.

Pure diastereomers or enantiomers can be obtained according to the invention not only by separating suitable isomer mixtures, but also by generally known methods of diastereose-

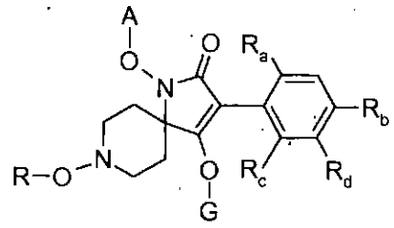
lective or enantioselective synthesis, for example by carrying out the process according to the invention with starting materials of a suitable stereochemistry.

It is advantageous to isolate or synthesize in each case the biologically more effective isomer, for example enantiomer or diastereomer, or isomer mixture, for example enantiomer mixture or diastereomer mixture, if the individual components have a different biological activity.

The compounds I and, where appropriate, the tautomers thereof, in each case in free form or in salt form, can, if appropriate, also be obtained in the form of hydrates and/or include other solvents, for example those which may have been used for the crystallization of compounds which are present in solid form.

The compounds according to the following Tables 1 to 102 below can be prepared according to the methods described above. The examples which follow are intended to illustrate the invention and show preferred compounds of formula I.

Table 1: This table discloses the 132 compounds T1.001 to T1.132 of the formula Ic:



(Ic),

wherein R is CH_3, A is hydrogen, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined below:

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.001	Br	H	H	H
T1.002	Cl	H	H	H
T1.003	CH_3	H	H	H
T1.004	CH_2CH_3	H	H	H
T1.005	OCH_3	H	H	H

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.006	Br	Cl	H	H
T1.007	Cl	Br	H	H
T1.008	Cl	Cl	H	H
T1.009	Cl	CH_3	H	H
T1.010	CH_3	Cl	H	H
T1.011	CH_3	CH_3	H	H
T1.012	Cl	H	Cl	H
T1.013	Cl	H	CH_3	H
T1.014	Cl	H	CH_2CH_3	H
T1.015	Cl	H	OCH_3	H
T1.016	CH_3	H	CH_3	H
T1.017	CH_3	H	CH_2CH_3	H
T1.018	CH_3	H	OCH_3	H
T1.019	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3	H
T1.020	CH_2CH_3	H	OCH_3	H
T1.021	OCH_3	H	OCH_3	H
T1.022	Br	H	H	Cl
T1.023	Br	H	H	CH_3
T1.024	Br	H	H	4-Cl-C_6H_4
T1.025	Cl	H	H	Cl
T1.026	Cl	H	H	CH_3
T1.027	Cl	H	H	4-Cl-C_6H_4
T1.028	CH_3	H	H	Br
T1.029	CH_3	H	H	Cl
T1.030	CH_3	H	H	CH_3
T1.031	CH_3	H	H	C_6H_5
T1.032	CH_3	H	H	4-Cl-C_6H_4
T1.033	CH_2CH_3	H	H	CH_3
T1.034	CH_2CH_3	H	H	4-Cl-C_6H_4
T1.035	OCH_3	H	H	CH_3
T1.036	OCH_3	H	H	4-Cl-C_6H_4
T1.037	Cl	H	Cl	Br
T1.038	CH_3	H	CH_3	Br
T1.039	CH_3	H	CH_3	Cl
T1.040	CH_3	H	CH_3	4-Cl-C_6H_4
T1.041	Br	Cl	H	CH_3
T1.042	Br	CH_3	H	CH_3

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.043	Cl	Cl	H	Cl
T1.044	Cl	Br	H	CH_3
T1.045	Cl	Cl	H	CH_3
T1.046	Cl	CH_3	H	Cl
T1.047	Cl	CH_3	H	CH_3
T1.048	CH_3	Br	H	CH_3
T1.049	CH_3	Cl	H	CH_3
T1.050	CH_3	CH_3	H	CH_3
T1.051	CH_3	CH_3	H	4-Cl-C_6H_4
T1.052	Br	Br	CH_3	H
T1.053	Br	Cl	CH_3	H
T1.054	Br	CH_3	Br	H
T1.055	Br	CH_3	Cl	H
T1.056	Cl	Br	CH_3	H
T1.057	Cl	Cl	Cl	H
T1.058	Cl	Cl	CH_3	H
T1.059	Cl	CH_3	Cl	H
T1.060	Cl	CH_3	CH_2CH_3	H
T1.061	Cl	CH_3	OCH_3	H
T1.062	Cl	4-Cl-C_6H_4	Cl	H
T1.063	Cl	4-Cl-C_6H_4	CH_3	H
T1.064	Cl	4-Cl-C_6H_4	CH_2CH_3	H
T1.065	Cl	4-Cl-C_6H_4	OCH_3	H
T1.066	CH_3	Br	CH_3	H
T1.067	CH_3	Cl	CH_3	H
T1.068	CH_3	CH_3	Br	H
T1.069	CH_3	CH_3	Cl	H
T1.070	CH_3	CH_3	CH_3	H
T1.071	CH_3	CH_3	CH_2CH_3	H
T1.072	CH_3	CH_3	OCH_3	H
T1.073	CH_3	4-Cl-C_6H_4	CH_3	H
T1.074	CH_3	4-Cl-C_6H_4	CH_2CH_3	H
T1.075	CH_3	4-Cl-C_6H_4	OCH_3	H
T1.076	CH_2CH_3	Br	Br	H
T1.077	CH_2CH_3	Br	Cl	H
T1.078	CH_2CH_3	Br	CH_3	H
T1.079	CH_2CH_3	Br	CH_2CH_3	H
T1.080	CH_2CH_3	Br	OCH_3	H

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.081	CH_2CH_3	Cl	Br	H
T1.082	CH_2CH_3	Cl	Cl	H
T1.083	CH_2CH_3	Cl	CH_3	H
T1.084	CH_2CH_3	Cl	CH_2CH_3	H
T1.085	CH_2CH_3	Cl	OCH_3	H
T1.086	CH_2CH_3	CH_3	Br	H
T1.087	CH_2CH_3	CH_3	Cl	H
T1.088	CH_2CH_3	CH_3	CH_2CH_3	H
T1.089	CH_2CH_3	CH_3	OCH_3	H
T1.090	CH_2CH_3	CH_2CH_3	CH_3	H
T1.091	CH_2CH_3	CH_2CH_3	CH_2CH_3	H
T1.092	CH_2CH_3	4-Cl-C_6H_4	Br	H
T1.093	CH_2CH_3	4-Cl-C_6H_4	CH_2CH_3	H
T1.094	CH_2CH_3	4-Cl-C_6H_4	OCH_3	H
T1.095	OCH_3	Br	CH_3	H
T1.096	OCH_3	Cl	CH_3	H
T1.097	OCH_3	CH_3	Br	H
T1.098	OCH_3	CH_3	Cl	H
T1.099	OCH_3	CH_3	OCH_3	H
T1.100	OCH_3	4-Cl-C_6H_4	OCH_3	H
T1.101	CH_3	CH_3	CH_3	F
T1.102	CH_3	CH_3	CH_3	Cl
T1.103	CH_3	CH_3	CH_3	Br
T1.104	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.105	CH_3	CH_3	CH_3	4-Cl-C_6H_4
T1.106	Cl	CH_3	CH_3	CH_3
T1.107	CH_3	Cl	CH_3	CH_3
T1.108	CH_3	CH_3	Cl	CH_3
T1.109	CH_2CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.110	OCH_3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.111	Cyclo-C3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.112	CH_3	CH_3	Cyclo-C3	H
T1.113	CH_3	F	H	Br
T1.114	CH_3	CH_3	H	Br
T1.115	CH_2CH_3	CH_3	H	CH_3
T1.116	OCH_3	CH_3	H	CH_3
T1.117	Cyclo-C3	CH_3	H	CH_3
T1.118	CH_2CH_3	Cl	H	CH_3

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.119	OCH_3	Cl	H	CH_3
T1.120	Cyclo-C3	Cl	H	CH_3
T1.121	Cl	H	CH_3	CH_3
T1.122	CH_3	H	CH_3	CH_3
T1.123	CH_2CH_3	H	CH_3	CH_3
T1.124	OCH_3	H	CH_3	CH_3
T1.125	Cyclo-C3	H	CH_3	CH_3
T1.126	F	H	Cl	CH_3
T1.127	Cl	H	F	CH_3
T1.128	H	CH_3	CH_3	CH_3
T1.129	Br	CH_3	CH_3	CH_3
T1.130	CH_3	H	Cl	CH_3
T1.131	CH_3	H	Br	CH_3
T1.132	Br	H	CH_3	CH_3

Cyclo-C3 means cyclopropyl.

Table 2: This table discloses the 132 compounds T2.001 to T2.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 3: This table discloses the 132 compounds T3.001 to T3.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 4: This table discloses the 132 compounds T4.001 to T4.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is n-C_3H_7, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 5: This table discloses the 132 compounds T5.001 to T5.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is i-C_3H_7, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 6: This table discloses the 132 compounds T6.001 to T6.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is n-C_4H_9, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 7: This table discloses the 132 compounds T7.001 to T7.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is i-C_4H_9, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 8: This table discloses the 132 compounds T8.001 to T8.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is t-C_4H_9, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 9: This table discloses the 132 compounds T9.001 to T9.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is cyclopropyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 10: This table discloses the 132 compounds T10.001 to T10.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is cyclopentyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 11: This table discloses the 132 compounds T11.001 to T11.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is cyclohexyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 12: This table discloses the 132 compounds T12.001 to T12.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is 2,2-$(CH_3)_2$-propyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 13: This table discloses the 132 compounds T13.001 to T13.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is allyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 14: This table discloses the 132 compounds T14.001 to T14.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2-CH=$C(CH_3)_2$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 15: This table discloses the 132 compounds T15.001 to T15.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2-CH=$C(Cl)_2$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 16: This table discloses the 132 compounds T16.001 to T16.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is propargyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 17: This table discloses the 132 compounds T17.001 to T17.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2C{\equiv}CCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 18: This table discloses the 132 compounds T18.001 to T18.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2-cyclopropyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 19: This table discloses the 132 compounds T19.001 to T19.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2CN, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 20: This table discloses the 132 compounds T20.001 to T20.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2OCH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 21: This table discloses the 132 compounds T21.001 to T21.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2OCH_2CH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 22: This table discloses the 132 compounds T22.001 to T22.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 23: This table discloses the 132 compounds T23.001 to T23.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 24: This table discloses the 132 compounds T24.001 to T24.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is oxetan-3-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 25: This table discloses the 132 compounds T25.001 to T25.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is tetrahydrofuran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 26: This table discloses the 132 compounds T26.001 to T26.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is tetrahydrofuran-3-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 27: This table discloses the 132 compounds T27.001 to T27.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is tetrahydropyran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 28: This table discloses the 132 compounds T28.001 to T28.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is tetrahydropyran-4-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 29: This table discloses the 132 compounds T29.001 to T29.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2CHF_2, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 30: This table discloses the 132 compounds T30.001 to T30.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2C(O)$-CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 31: This table discloses the 132 compounds T31.001 to T31.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2C(O)$-CH_2CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 32: This table discloses the 132 compounds T32.001 to T32.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH(CH_3)C(O)$-CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 33: This table discloses the 132 compounds T33.001 to T33.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $C(CH_3)_2C(O)$-CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 34: This table discloses the 132 compounds T34.001 to T34.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is benzyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 35: This table discloses the 132 compounds T35.001 to T35.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is C(O)-CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 36: This table discloses the 132 compounds T36.001 to T36.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is C(O)-OCH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 37: This table discloses the 132 compounds T37.001 to T37.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is C(O)-cyclopropyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 38: This table discloses the 132 compounds T37.001 to T37.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $C(O)$-$N(CH_3)_2$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 39: This table discloses the 132 compounds T39.001 to T39.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is hydrogen, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 40: This table discloses the 132 compounds T40.001 to T40.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 41: This table discloses the 132 compounds T41.001 to T41.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is CH_2OCH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 42: This table discloses the 132 compounds T42.001 to T42.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is $CH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 43: This table discloses the 132 compounds T43.001 to T43.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is propargyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 44: This table discloses the 132 compounds T44.001 to T44.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is hydrogen, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 45: This table discloses the 132 compounds T45.001 to T45.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 46: This table discloses the 132 compounds T46.001 to T46.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is CH_2OCH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 47: This table discloses the 132 compounds T47.001 to T47.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is $CH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 48: This table discloses the 132 compounds T48.001 to T48.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is propargyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 49: This table discloses the 132 compounds T49.001 to T49.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is hydrogen, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 50: This table discloses the 132 compounds T50.001 to T50.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 51: This table discloses the 132 compounds T51.001 to T51.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is CH_2OCH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 52: This table discloses the 132 compounds T52.001 to T52.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is $CH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 53: This table discloses the 132 compounds T53.001 to T53.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is propargyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 54: This table discloses the 132 compounds T54.001 to T54.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is hydrogen, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 55: This table discloses the 132 compounds T55.001 to T55.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 56: This table discloses the 132 compounds T56.001 to T56.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is CH_2OCH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 57: This table discloses the 132 compounds T57.001 to T57.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is $CH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 58: This table discloses the 132 compounds T58.001 to T58.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is propargyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 59: This table discloses the 132 compounds T59.001 to T59.132 of the formula Ic, wherein R is benzyl, A is hydrogen, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 60: This table discloses the 132 compounds T60.001 to T60.132 of the formula Ic, wherein R is benzyl, A is CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 61: This table discloses the 132 compounds T61.001 to T61.132 of the formula Ic, wherein R is benzyl, A is CH_2OCH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 62: This table discloses the 132 compounds T62.001 to T62.132 of the formula Ic, wherein R is benzyl, A is $CH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 63: This table discloses the 132 compounds T63.001 to T63.132 of the formula Ic, wherein R is benzyl, A is propargyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 64: This table discloses the 132 compounds T64.001 to T64.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is cyclobutyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 65: This table discloses the 132 compounds T65.001 to T65.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2CH_2CH_2OCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 66: This table discloses the 132 compounds T66.001 to T66.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2CH_2O(tetrahydrofuran-2-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 67: This table discloses the 132 compounds T67.001 to T67.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2CH_2O(tetrahydropyran-2-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 68: This table discloses the 132 compounds T68.001 to T68.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(oxetan-3-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 69: This table discloses the 132 compounds T69.001 to T69.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(3-methyl-oxetan-3-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 70: This table discloses the 132 compounds T70.001 to T70.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(tetrahydrofuran-2-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 71: This table discloses the 132 compounds T71.001 to T71.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(tetrahydrofuran-3-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 72: This table discloses the 132 compounds T72.001 to T72.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(tetrahydropyran-2-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 73: This table discloses the 132 compounds T73.001 to T73.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(tetrahydropyran-3-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 74: This table discloses the 132 compounds T74.001 to T74.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(tetrahydropyran-4-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 75: This table discloses the 132 compounds T75.001 to T75.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is CH_2CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 76: This table discloses the 132 compounds T76.001 to T76.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is allyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 77: This table discloses the 132 compounds T77.001 to T77.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is tetrahydrofuran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 78: This table discloses the 132 compounds T78.001 to T78.132 of the formula Ic, wherein R is hydrogen, A is tetrahydropyran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 79: This table discloses the 132 compounds T79.001 to T79.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is CH_2CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 80: This table discloses the 132 compounds T80.001 to T80.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is allyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 81: This table discloses the 132 compounds T81.001 to T81.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is tetrahydrofuran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 82: This table discloses the 132 compounds T82.001 to T82.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2CH_3, A is tetrahydropyran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 83: This table discloses the 132 compounds T83.001 to T83.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is CH_2CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 84: This table discloses the 132 compounds T84.001 to T84.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is allyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 85: This table discloses the 132 compounds T85.001 to T85.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is tetrahydrofuran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 86: This table discloses the 132 compounds T86.001 to T86.132 of the formula Ic, wherein R is CH_2OCH_3, A is tetrahydropyran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 87: This table discloses the 132 compounds T87.001 to T87.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is CH_2CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 88: This table discloses the 132 compounds T88.001 to T88.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is allyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 89: This table discloses the 132 compounds T89.001 to T89.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is tetrahydrofuran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 90: This table discloses the 132 compounds T90.001 to T90.132 of the formula Ic, wherein R is $CH_2CH_2OCH_3$, A is tetrahydropyran-2-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 91: This table discloses the 132 compounds T91.001 to T91.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2-cyclobutyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 92: This table discloses the 132 compounds T92.001 to T92.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2-cyclopentyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 93: This table discloses the 132 compounds T93.001 to T93.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2-cyclohexyl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 94: This table discloses the 132 compounds T94.001 to T94.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(3-ethyl-oxetan-3-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 95: This table discloses the 132 compounds T95.001 to T95.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(furan-2-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 96: This table discloses the 132 compounds T96.001 to T96.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(furan-3-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 97: This table discloses the 132 compounds T97.001 to T97.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is CH_2(tetrahydro-thiopyran-4-yl), G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 98: This table discloses the 132 compounds T98.001 to T98.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is C(O)-OCH_2CH_3, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 99: This table discloses the 132 compounds T99.001 to T99.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2CH_2SCH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 100: This table discloses the 132 compounds T100.001 to T100.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2CH_2S(O)CH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 101: This table discloses the 132 compounds T101.001 to T101.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

Table 102: This table discloses the 132 compounds T102.001 to T102.132 of the formula Ic, wherein R is CH_3, A is 1-methoxy-piperidin-4-yl, G is hydrogen and R_a, R_b, R_c and R_d are as defined in Table 1.

The compounds according to the invention are preventively and/or curatively valuable active ingredients in the field of pest control, even at low rates of application, which have a very favorable biocidal spectrum and are well tolerated by warm-blooded species, fish and plants. The active ingredients according to the invention act against all or individual developmental stages of normally sensitive or resistant pests, such as insects or representatives of the order Acarina. The insecticidal or acaricidal activity of the active ingredients according to the invention can manifest itself directly, i. e. in destruction of the pests, which takes place either immediately or only after some time has elapsed, for example during ecdysis, or indirectly, for example in a reduced oviposition and/or hatching rate, a good activity corresponding to a destruction rate (mortality) of at least 50 to 60%.

The compounds of formula I can be used to combat and control infestations of insect pests such as Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera and Isoptera and also other invertebrate pests, for example, acarine, nematode and mollusc pests. Insects, acarines, nematodes and molluscs are hereinafter collectively referred to as pests. The pests which may be combated and controlled by the use of the invention compounds include those pests associated with agriculture (which term includes the growing of crops for food and fibre products), horticulture and animal husbandry, companion animals, forestry and the storage of products of vegetable origin (such as fruit, grain and timber); those pests associated with the damage of man-made structures and the transmission of diseases of man and animals; and also nuisance pests (such as flies).

Examples of pest species which may be controlled by the compounds of formula I include: *Myzus persicae* (aphid), *Aphis gossypii* (aphid), *Aphis fabae* (aphid), *Lygus* spp. (capsids), *Dysdercus* spp. (capsids), *Nilaparvata lugens* (planthopper), *Nephotettixc incticeps*

(leafhopper), *Nezara* spp. (stinkbugs), *Euschistus* spp. (stinkbugs), *Leptocorisa* spp. (stinkbugs), *Frankliniella occidentalis* (thrip), Thrips spp. (thrips), *Leptinotarsa decemlineata* (Colorado potato beetle), *Anthonomus grandis* (boll weevil), *Aonidiella* spp. (scale insects), *Trialeurodes* spp. (white flies), *Bemisia tabaci* (white fly), *Ostrinia nubilalis* (European corn borer), *Spodoptera littoralis* (cotton leafworm), *Heliothis virescens* (tobacco budworm), *Helicoverpa armigera* (cotton bollworm), *Helicoverpa zea* (cotton bollworm), *Sylepta derogata* (cotton leaf roller), *Pieris brassicae* (white butterfly), *Plutella xylostella* (diamond back moth), *Agrotis* spp. (cutworms), *Chilo suppressalis* (rice stem borer), *Locusta migratoria* (locust), *Chortiocetes terminifera* (locust), *Diabrotica* spp. (rootworms), *Panonychus ulmi* (European red mite), *Panonychus citri* (citrus red mite), *Tetranychus urticae* (two-spotted spider mite), *Tetranychus cinnabarinus* (carmine spider mite), *Phyllocoptruta oleivora* (citrus rust mite), *Polyphagotarsonemus latus* (broad mite), *Brevipalpus* spp. (flat mites), *Boophilus microplus* (cattle tick), *Dermacentor variabilis* (American dog tick), *Ctenocephalides felis* (cat flea), *Liriomyza* spp. (leafminer), *Musca domestica* (housefly), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitoes), *Culex* spp. (mosquitoes), *Lucillia* spp. (blowflies), *Blattella germanica* (cockroach), *Periplaneta americana* (cockroach), *Blatta orientalis* (cockroach), termites of the Mastotermitidae (for example *Mastotermes* spp.), the Kalotermitidae (for example *Neotermes* spp.), the Rhinotermitidae (for example *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus*, and *R. santonensis*) and the Termitidae (for example *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (fire ant), *Monomorium pharaonis* (pharaoh's ant), *Damalinia* spp. and *Linognathus* spp. (biting and sucking lice), *Meloidogyne* spp. (root knot nematodes), *Globodera* spp. and *Heterodera* spp. (cyst nematodes), *Pratylenchus* spp. (lesion nematodes), *Rhodopholus* spp. (banana burrowing nematodes), *Tylenchulus* spp.(citrus nematodes), *Haemonchus contortus* (barber pole worm), *Caenorhabditis elegans* (vinegar eelworm), *Trichostrongylus* spp. (gastro intestinal nematodes) and *Deroceras reticulatum* (slug).

Further examples of the above mentioned pests are:

from the order *Acarina*, for example,

Acarus siro, Aceria sheldoni, Aculus schlechtendali, Amblyomma spp., Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., Bryobia praetiosa, Calipitrimerus spp., Chorioptes spp., Dermanyssus gallinae, Eotetranychus carpini, Eriophyes spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Oligonychus pratensis, Ornithodoros spp., Panonychus spp., Phyllocoptruta oleivora,

Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp. and Tetranychus spp.;

from the order *Anoplura*, for example,

Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Pemphigus spp. and Phylloxera spp.;

from the order *Coleoptera*, for example,

Agriotes spp., Anthonomus spp., Atomaria linearis, Chaetocnema tibialis, Cosmopolites spp., Curculio spp., Dermestes spp., Diabrotica spp., Epilachna spp., Eremnus spp., Leptinotarsa decemLineata, Lissorhoptrus spp., Melolontha spp., Orycaephilus spp., Otiorhynchus spp., Phlyctinus spp., Popillia spp., Psylliodes spp., Rhizopertha spp., Scarabeidae, Sitophilus spp., Sitotroga spp., Tenebrio spp., Tribolium spp. and Trogoderma spp.;

from the order *Diptera*, for example,

Aedes spp., Antherigona soccata, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomyia spp., Culex spp., Cuterebra spp., Dacus spp., Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastrophilus spp., Glossina spp., Hypoderma spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis pomonella, Sciara spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp. and Tipula spp.;

from the order *Heteroptera*, for example,

Cimex spp., Distantiella theobroma, Dysdercus spp., Euchistus spp., Eurygaster spp., Leptocorisa spp., Nezara spp., Piesma spp., Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophara spp. and Triatoma spp.;

from the order *Homoptera*, for example,

Aleurothrixus floccosus, Aleyrodes brassicae, Aonidiella spp., Aphididae, Aphis spp., Aspidiotus spp., Bemisia tabaci, Ceroplaster spp., Chrysomphalus aonidium, Chrysomphalus dictyospermi, Coccus hesperidum, Empoasca spp., Eriosoma larigerum, Erythroneura spp., Gascardia spp., Laodelphax spp., Lecanium corni, Lepidosaphes spp., Macrosiphus spp., Myzus spp., Nephotettix spp., Nilaparvata spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Planococcus spp., Pseudaulacaspis spp., Pseudococcus spp., Psylla spp., Pulvinaria aethiopica, Quadraspidiotus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza erytreae and Unaspis citri;

from the order *Hymenoptera*, for example,

Acromyrmex, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Solenopsis spp. and Vespa spp.;

from the order *Isoptera*, for example,

Reticulitermes spp.;

from the order *Lepidoptera*, for example,

Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amylois spp., Anticarsia gemmatalis, Archips spp., Argyrotaenia spp., Autographa spp., Busseola fusca, Cadra cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp., Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydia spp., Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Ephestia spp., Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Grapholita spp., Hedya nubiferana, Heliothis spp., Hellula undalis, Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Leucoptera scitella, Lithocollethis spp., Lobesia botrana, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Operophtera spp., Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Pectinophora gossypiela, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni and Yponomeuta spp.;

from the order *Mallophaga*, for example,

Damalinea spp. and Trichodectes spp.;

from the order *Orthoptera*, for example,

Blatta spp., Blattella spp., Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Periplaneta spp. and Schistocerca spp.;

from the order *Psocoptera*, for example,

Liposcelis spp.;

from the order *Siphonaptera*, for example,

Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp. and Xenopsylla cheopis;

from the order *Thysanoptera*, for example,

Frankliniella spp., Hercinothrips spp., Scirtothrips aurantii, Taeniothrips spp., Thrips palmi and Thrips tabaci; and

from the order *Thysanura*, for example,

Lepisma saccharina.

The active ingredients according to the invention can be used for controlling, i. e. containing or destroying, pests of the abovementioned type which occur in particular on plants, especially on useful plants and ornamentals in agriculture, in horticulture and in forests, or on organs, such as fruits, flowers, foliage, stalks, tubers or roots, of such plants, and in some cases even plant organs which are formed at a later point in time remain protected against these pests.

Suitable target crops are, in particular, cereals, such as wheat, barley, rye, oats, rice, maize or sorghum; beet, such as sugar or fodder beet; fruit, for example pomaceous fruit, stone fruit or soft fruit, such as apples, pears, plums, peaches, almonds, cherries or berries, for example strawberries, raspberries or blackberries; leguminous crops, such as beans, lentils, peas or soya; oil crops, such as oilseed rape, mustard, poppies, olives, sunflowers, coconut, castor, cocoa or ground nuts; cucurbits, such as pumpkins, cucumbers or melons; fibre plants, such as cotton, flax, hemp or jute; citrus fruit, such as oranges, lemons, grapefruit or tangerines; vegetables, such as spinach, lettuce, asparagus, cabbages, carrots, onions, tomatoes, potatoes or bell peppers; Lauraceae, such as avocado, Cinnamonium or camphor; and also tobacco, nuts, coffee, eggplants, sugarcane, tea, pepper, grapevines, hops, the plantain family, latex plants and ornamentals.

The term "crops" is to be understood as including also crops that have been rendered tolerant to herbicides like bromoxynil or classes of herbicides (such as, for example, HPPD inhibitors, ALS inhibitors, for example primisulfuron, prosulfuron and trifloxysulfuron, EPSPS (5-enol-pyrovyl-shikimate-3-phosphate-synthase) inhibitors, GS (glutamine synthetase) inhibitors) as a result of conventional methods of breeding or genetic engineering. An example of a crop that has been rendered tolerant to imidazolinones, e.g. imazamox, by conventional methods of breeding (mutagenesis) is Clearfield® summer rape (Canola). Examples of crops that have been rendered tolerant to herbicides or classes of herbicides by genetic engineering methods include glyphosate- and glufosinate-resistant maize varieties commercially available under the trade names RoundupReady® and LibertyLink®.

The term "crops" is to be understood as including also crop plants which have been so transformed by the use of recombinant DNA techniques that they are capable of synthesising one or more selectively acting toxins, such as are known, for example, from toxin-producing bacteria, especially those of the genus Bacillus.

Toxins that can be expressed by such transgenic plants include, for example, insecticidal proteins, for example insecticidal proteins from Bacillus cereus or Bacillus popliae; or insecticidal proteins from Bacillus thuringiensis, such as δ-endotoxins, e.g. CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) or Cry9c, or vegetative insecticidal proteins (VIP), e.g. VIP1, VIP2, VIP3 or VIP3A; or insecticidal proteins of bacteria colonising nematodes, for example Photorhabdus spp. or Xenorhabdus spp., such as Photorhabdus luminescens, Xenorhabdus nematophilus; toxins produced by animals, such as scorpion toxins, arachnid toxins, wasp toxins and other insect-specific neurotoxins; toxins produced by fungi, such as Streptomycetes toxins, plant lectins, such as pea lectins, barley lectins or snowdrop lectins; agglutinins; proteinase inhibitors, such as trypsine inhibitors, serine protease inhibitors, patatin, cystatin, papain inhibitors; ribosome-inactivating proteins (RIP), such as ricin, maize-RIP, abrin, luffin, saporin or bryodin; steroid metabolism enzymes, such as 3-hydroxysteroidoxidase, ecdysteroid-UDP-glycosyl-transferase, cholesterol oxidases, ecdysone inhibitors, HMG-COA-reductase, ion channel blockers, such as blockers of sodium or calcium channels, juvenile hormone esterase, diuretic hormone receptors, stilbene synthase, bibenzyl synthase, chitinases and glucanases.

In the context of the present invention there are to be understood by δ-endotoxins, for example CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) or Cry9c, or vegetative insecticidal proteins (VIP), for example VIP1, VIP2, VIP3 or VIP3A, expressly also hybrid toxins, truncated toxins and modified toxins. Hybrid toxins are produced recombinantly by a new combination of different domains of those proteins (see, for example, WO 02/15701). Truncated toxins, for example a truncated CryIA(b), are known. In the case of modified toxins, one or more amino acids of the naturally occurring toxin are replaced. In such amino acid replacements, preferably non-naturally present protease recognition sequences are inserted into the toxin, such as, for example, in the case of CryIIIA055, a cathepsin-D-recognition sequence is inserted into a CryIIIA toxin (see WO 03/018810).

Examples of such toxins or transgenic plants capable of synthesising such toxins are disclosed, for example, in EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 and WO 03/052073.

The processes for the preparation of such transgenic plants are generally known to the person skilled in the art and are described, for example, in the publications mentioned above. Cryl-type deoxyribonucleic acids and their preparation are known, for example, from WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 and WO 90/13651.

The toxin contained in the transgenic plants imparts to the plants tolerance to harmful insects. Such insects can occur in any taxonomic group of insects, but are especially commonly found in the beetles (Coleoptera), two-winged insects (Diptera) and butterflies (Lepidoptera).

Transgenic plants containing one or more genes that code for an insecticidal resistance and express one or more toxins are known and some of them are commercially available. Examples of such plants are: YieldGard® (maize variety that expresses a CryIA(b) toxin); YieldGard Rootworm® (maize variety that expresses a CryIIIB(b1) toxin); YieldGard Plus® (maize variety that expresses a CryIA(b) and a CryIIIB(b1) toxin); Starlink® (maize variety that expresses a Cry9(c) toxin); Herculex I® (maize variety that expresses a CryIF(a2) toxin and the enzyme phosphinothricine N-acetyltransferase (PAT) to achieve tolerance to the herbicide glufosinate ammonium); NuCOTN 33B® (cotton variety that expresses a CryIA(c) toxin); Bollgard I® (cotton variety that expresses a CryIA(c) toxin); Bollgard II® (cotton variety that expresses a CryIA(c) and a CryIIA(b) toxin); VIPCOT® (cotton variety that expresses a VIP toxin); NewLeaf® (potato variety that expresses a CryIIIA toxin); Nature-Gard® Agrisure® GT Advantage (GA21 glyphosate-tolerant trait), Agrisure® CB Advantage (Bt11 corn borer (CB) trait) and Protecta®.

Further examples of such transgenic crops are:

1. Bt11 Maize from Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, registration number C/FR/96/05/10. Genetically modified *Zea mays* which has been rendered resistant to attack by the European corn borer (*Ostrinia nubilalis* and *Sesamia nonagrioides*) by transgenic expression of a truncated CryIA(b) toxin. Bt11 maize also transgenically expresses the enzyme PAT to achieve tolerance to the herbicide glufosinate ammonium.

2. Bt176 Maize from Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, registration number C/FR/96/05/10. Genetically modified *Zea mays* which has been rendered resistant to attack by the European corn borer (*Ostrinia nubilalis* and *Sesamia nonagrioides*) by transgenic expression of a CrylA(b) toxin. Bt176 maize also transgenically expresses the enzyme PAT to achieve tolerance to the herbicide glufosinate ammonium.

3. MIR604 Maize from Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France, registration number C/FR/96/05/10. Maize which has been rendered insect-resistant by transgenic expression of a modified CryIIIA toxin. This toxin is Cry3A055 modified by insertion of a cathepsin-D-protease recognition sequence. The preparation of such transgenic maize plants is described in WO 03/018810.

4. MON 863 Maize from Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, registration number C/DE/02/9. MON *863* expresses a CryIIIB(b1) toxin and has resistance to certain Coleoptera insects.

5. IPC 531 Cotton from Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, registration number C/ES/96/02.

6. 1507 Maize from Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium, registration number C/NL/00/10. Genetically modified maize for the expression of the protein Cry1F for achieving resistance to certain Lepidoptera insects and of the PAT protein for achieving tolerance to the herbicide glufosinate ammonium.

7. NK603 × MON 810 Maize from Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, registration number C/GB/02/M3/03. Consists of conventionally bred hybrid maize varieties by crossing the genetically modified varieties NK603 and MON 810. NK603 × MON 810 Maize transgenically expresses the protein CP4 EPSPS, obtained from *Agrobacterium sp.* strain CP4, which imparts tolerance to the herbicide Roundup® (contains glyphosate), and also a CrylA(b) toxin obtained from *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* which brings about tolerance to certain Lepidoptera, include the European corn borer.

Transgenic crops of insect-resistant plants are also described in BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003.

The term "crops" is to be understood as including also crop plants which have been so transformed by the use of recombinant DNA techniques that they are capable of synthesising antipathogenic substances having a selective action, such as, for example, the so-called "pathogenesis-related proteins" (PRPs, see e.g. EP-A-0 392 225). Examples of such antipathogenic substances and transgenic plants capable of synthesising such antipathogenic substances are known, for example, from EP-A-0 392 225, WO 95/33818, and EP-A-0 353 191. The methods of producing such transgenic plants are generally known to the person skilled in the art and are described, for example, in the publications mentioned above.

Antipathogenic substances which can be expressed by such transgenic plants include, for example, ion channel blockers, such as blockers for sodium and calcium channels, for example the viral KP1, KP4 or KP6 toxins; stilbene synthases; bibenzyl synthases; chitinases; glucanases; the so-called "pathogenesis-related proteins" (PRPs; see e.g. EP-A-0 392 225); antipathogenic substances produced by microorganisms, for example peptide antibiotics or heterocyclic antibiotics (see e.g. WO 95/33818) or protein or polypeptide factors involved in plant pathogen defence (so-called "plant disease resistance genes", as described in WO 03/000906).

Further areas of use of the compounds and compositions according to the invention are the protection of stored goods and storerooms and the protection of raw materials, such as wood, textiles, floor coverings or buildings, and also in the hygiene sector, especially the protection of humans, domestic animals and productive livestock against pests of the mentioned type.

In the hygiene sector, the compounds and compositions according to the invention are active against ectoparasites such as hard ticks, soft ticks, mange mites, harvest mites, flies (biting and licking), parasitic fly larvae, lice, hair lice, bird lice and fleas.

Examples of such parasites are:

Of the order Anoplurida: Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp. and Phtirus spp., Solenopotes spp..

Of the order Mallophagida: Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp. and Felicola spp..

Of the order Diptera and the suborders Nematocerina and Brachycerina, for example 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. and Melophagus spp..

Of the order Siphonapterida, for example Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Of the order Heteropterida, for example Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Of the order Blattarida, for example Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattelagermanica and Supella spp..

Of the subclass Acaria (Acarida) and the orders Meta- and Meso-stigmata, for example 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. and Varroa spp..

Of the orders Actinedida (Prostigmata) and Acaridida (Astigmata), for example Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergatesspp., 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. and Laminosioptes spp..

The compounds and compositions according to the invention are also suitable for protecting against insect infestation in the case of materials such as wood, textiles, plastics, adhesives, glues, paints, paper and card, leather, floor coverings and buildings.

The compositions according to the invention can be used, for example, against the following pests: beetles such as Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinuspecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthesrugicollis, Xyleborus spec.,Tryptodendron spec., Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. and Dinoderus minutus; and also hymenopterans such as Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus and Urocerus augur, and termites such as Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis and Coptotermes formosanus, and bristletails such as Lepisma saccharina.

The invention therefore provides a method of combating and controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying an insecticidally, acaricidally, nematicidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula I, or a composition containing a compound of formula I, to a pest, a locus of pest, or to a plant susceptible to attack by a pest, The compounds of formula I are preferably used against insects or acarines.

The term "plant" as used herein includes seedlings, bushes and trees.

Besides displaying good insecticidal and acaricidal action and properties, the active ingredient according to the invention are characterized by good plant/crop compatibility. Under different methods of application, the compounds of the formula I, or compositions thereof according to the invention, demonstrate good plant/crop tolerance whereby plant/crop damage (phytotoxicity) is significantly reduced. The terms “crop” and "plant" are to be understood as defined above, whereas the term “methods of application” is referred to below.

The invention therefore also relates to pesticidal compositions such as emulsifiable concentrates, suspension concentrates, directly sprayable or dilutable solutions, spreadable pastes, dilute emulsions, soluble powders, dispersible powders, wettable powders, dusts, granules or encapsulations in polymeric substances, which comprise - at

least - one of the active ingredients according to the invention and which are to be selected to suit the intended aims and the prevailing circumstances.

In these compositions, the active ingredient is employed in pure form, a solid active ingredient for example in a specific particle size, or, preferably, together with - at least - one of the auxiliaries conventionally used in the art of formulation, such as extenders, for example solvents or solid carriers, or such as surface-active compounds (surfactants).

Examples of suitable solvents are: unhydrogenated or partially hydrogenated aromatic hydrocarbons, preferably the fractions C8 to C12 of alkylbenzenes, such as xylene mixtures, alkylated naphthalenes or tetrahydronaphthalene, aliphatic or cycloaliphatic hydrocarbons, such as paraffins or cyclohexane, alcohols such as ethanol, propanol or butanol, glycols and their ethers and esters such as propylene glycol, dipropylene glycol ether, ethylene glycol or ethylene glycol monomethyl ether or ethylene glycol monoethyl ether, ketones, such as cyclohexanone, isophorone or diacetone alcohol, strongly polar solvents, such as N-methylpyrrolid-2-one, dimethyl sulfoxide or N,N-dimethylformamide, water, unepoxidized or epoxidized vegetable oils, such as unexpodized or epoxidized rapeseed, castor, coconut or soya oil, and silicone oils.

Solid carriers which are used for example for dusts and dispersible powders are, as a rule, ground natural minerals such as calcite, talc, kaolin, montmorillonite or attapulgite. To improve the physical properties, it is also possible to add highly disperse silicas or highly disperse absorbtive polymers. Suitable particulate adsorptive carriers for granules are porous types, such as pumice, brick grit, sepiolite or bentonite, and suitable non-sorptive carrier materials are calcite or sand. In addition, a large number of granulated materials of inorganic or organic nature can be used, in particular dolomite or comminuted plant residues.

Suitable surface-active compounds are, depending on the type of the active ingredient to be formulated, non-ionic, cationic and/or anionic surfactants or surfactant mixtures which have good emulsifying, dispersing and wetting properties. The surfactants mentioned below are only to be considered as examples; a large number of further surfactants which are conventionally used in the art of formulation and suitable according to the invention are described in the relevant literature.

Suitable non-ionic surfactants are, especially, polyglycol ether derivatives of aliphatic or cycloaliphatic alcohols, of saturated or unsaturated fatty acids or of alkyl phenols which may contain approximately 3 to approximately 30 glycol ether groups and approximately 8 to approximately 20 carbon atoms in the (cyclo)aliphatic hydrocarbon radical or approximately 6 to approximately 18 carbon atoms in the alkyl moiety of the alkyl phenols. Also suitable are water-soluble polyethylene oxide adducts with polypropylene glycol, ethylenediaminopo¬lypropylene glycol or alkyl polypropylene glycol having 1 to approximately 10 carbon atoms in the alkyl chain and approximately 20 to approximately 250 ethylene glycol ether groups and approximately 10 to approximately 100 propylene glycol ether groups. Normally, the abovementioned compounds contain 1 to approximately 5 ethylene glycol units per propy¬lene glycol unit. Examples which may be mentioned are nonylphenoxypolyethoxyethanol, castor oil polyglycol ether, polypropylene glycol/polyethylene oxide adducts, tributylphenoxypolyethoxyethanol, polyethylene glycol or octylphenoxypolyethoxyethanol. Also suitable are fatty acid esters of polyoxyethylene sorbitan, such as polyoxyethylene sorbitan trioleate.

The cationic surfactants are, especially, quarternary ammonium salts which generally have at least one alkyl radical of approximately 8 to approximately 22 C atoms as substituents and as further substituents (unhalogenated or halogenated) lower alkyl or hydroxyalkyl or benzyl radicals. The salts are preferably in the form of halides, methylsulfates or ethylsulfates. Examples are stearyltrimethylammonium chloride and benzylbis(2-chloroethyl)ethyl¬ammonium bromide.

Examples of suitable anionic surfactants are water-soluble soaps or water-soluble synthetic surface-active compounds. Examples of suitable soaps are the alkali, alkaline earth or (unsubstituted or substituted) ammonium salts of fatty acids having approximately 10 to approximately 22 C atoms, such as the sodium or potassium salts of oleic or stearic acid, or of natural fatty acid mixtures which are obtainable for example from coconut or tall oil; mention must also be made of the fatty acid methyl taurates. However, synthetic surfactants are used more frequently, in particular fatty sulfonates, fatty sulfates, sulfonated benzimidazole derivatives or alkylaryl sulfonates. As a rule, the fatty sulfonates and fatty sulfates are present as alkali, alkaline earth or (substituted or unsubstituted) ammonium salts and they generally have an alkyl radical of approximately 8 to approximately 22 C atoms, alkyl also to be understood as including the alkyl moiety of acyl radicals; examples which may be mentioned are the sodium or calcium salts of

lignosulfonic acid, of the dodecylsulfuric ester or of a fatty alcohol sulfate mixture prepared from natural fatty acids. This group also includes the salts of the sulfuric esters and sulfonic acids of fatty alcohol/ethylene oxide adducts. The sulfonated benzimidazole derivatives preferably contain 2 sulfonyl groups and a fatty acid radical of approximately 8 to approximately 22 C atoms. Examples of alkylarylsulfonates are the sodium, calcium or triethanolammonium salts of decylbenzenesulfonic acid, of dibutylnaphthalenesulfonic acid or of a naphthalenesulfonic acid/formaldehyde condensate. Also possible are, furthermore, suitable phosphates, such as salts of the phosphoric ester of a p-nonylphenol/(4-14)ethylene oxide adduct, or phospholipids. Further suitable phosphates are tris-esters of phosphoric acid with aliphatic or aromatic alcohols and/or bis-esters of alkyl phosphonic acids with aliphatic or aromatic alcohols, which are a high performance oil-type adjuvant. These tris-esters have been described, for example, in WO0147356, WO0056146, EP-A-0579052 or EP-A-1018299 or are commercially available under their chemical name. Preferred tris-esters of phosphoric acid for use in the new compositions are tris-(2-ethylhexyl) phosphate, tris-n-octyl phosphate and tris-butoxyethyl phosphate, where tris-(2-ethylhexyl) phosphate is most preferred. Suitable bis-ester of alkyl phosphonic acids are bis-(2-ethylhexyl)-(2-ethylhexyl)-phosphonate, bis-(2-ethylhexyl)-(n-octyl)-phosphonate, dibutyl-butyl phosphonate and bis(2-ethylhexyl)-tripropylene-phosphonate, where bis-(2-ethylhexyl)-(n-octyl)-phosphonate is particularly preferred.

The compositions according to the invention can preferably additionally include an additive comprising an oil of vegetable or animal origin, a mineral oil, alkyl esters of such oils or mixtures of such oils and oil derivatives. The amount of oil additive used in the composition according to the invention is generally from 0.01 to 10 %, based on the spray mixture. For example, the oil additive can be added to the spray tank in the desired concentration after the spray mixture has been prepared. Preferred oil additives comprise mineral oils or an oil of vegetable origin, for example rapeseed oil such as ADIGOR® and MERO®, olive oil or sunflower oil, emulsified vegetable oil, such as AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.), alkyl esters of oils of vegetable origin, for example the methyl derivatives, or an oil of animal origin, such as fish oil or beef tallow. A preferred additive contains, for example, as active components essentially 80 % by weight alkyl esters of fish oils and 15 % by weight methylated rapeseed oil, and also 5 % by weight of customary emulsifiers and pH modifiers. Especially preferred oil additives comprise alkyl esters of C_8-C_{22} fatty acids, especially the methyl derivatives of C_{12}-C_{18} fatty acids, for example the methyl esters of lauric acid, palmitic acid and oleic acid, being important. Those esters are known as methyl

laurate (CAS-111-82-0), methyl palmitate (CAS-112-39-0) and methyl oleate (CAS-112-62-9). A preferred fatty acid methyl ester derivative is Emery® 2230 and 2231 (Cognis GmbH). Those and other oil derivatives are also known from the Compendium of Herbicide Adjuvants, 5th Edition, Southern Illinois University, 2000. Also, alkoxylated fatty acids can be used as additives in the inventive compositions as well as polymethylsiloxane based additives, which have been described in WO08/037373.

The application and action of the oil additives can be further improved by combining them with surface-active substances, such as non-ionic, anionic or cationic surfactants. Examples of suitable anionic, non-ionic and cationic surfactants are listed on pages 7 and 8 of WO 97/34485. Preferred surface-active substances are anionic surfactants of the dodecylbenzylsulfonate type, especially the calcium salts thereof, and also non-ionic surfactants of the fatty alcohol ethoxylate type. Special preference is given to ethoxylated C_{12}-C_{22} fatty alcohols having a degree of ethoxylation of from 5 to 40. Examples of commercially available surfactants are the Genapol types (Clariant AG). Also preferred are silicone surfactants, especially polyalkyl-oxide-modified heptamethyltrisiloxanes, which are commercially available e.g. as Silwet L-77®, and also perfluorinated surfactants. The concentration of surface-active substances in relation to the total additive is generally from 1 to 30 % by weight. Examples of oil additives that consist of mixtures of oils or mineral oils or derivatives thereof with surfactants are Edenor ME SU®, Turbocharge® (Syngenta AG, CH) and Actipron® (BP Oil UK Limited, GB).

The said surface-active substances may also be used in the formulations alone, that is to say without oil additives.

Furthermore, the addition of an organic solvent to the oil additive/surfactant mixture can contribute to a further enhancement of action. Suitable solvents are, for example, Solvesso® (ESSO) and Aromatic Solvent® (Exxon Corporation).The concentration of such solvents can be from 10 to 80 % by weight of the total weight. Such oil additives, which may be in admixture with solvents, are described, for example, in US-A-4 834 908. A commercially available oil additive disclosed therein is known by the name MERGE® (BASF Corporation). A further oil additive that is preferred according to the invention is SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada.)

In addition to the oil additives listed above, in order to enhance the activity of the compositions according to the invention it is also possible for formulations of alkylpyrrolidones, (e.g. Agrimax®) to be added to the spray mixture. Formulations of synthetic latices, such as, for example, polyacrylamide, polyvinyl compounds or poly-1-p-menthene (e.g. Bond®, Courier® or Emerald®) can also be used. Solutions that contain propionic acid, for example Eurogkem Pen-e-trate®, can also be mixed into the spray mixture as activity-enhancing agents.

As a rule, the compositions comprise 0.1 to 99%, especially 0.1 to 95%, of active ingredient of the formula I and 1 to 99.9%, especially 5 to 99.9%, of at least one solid or liquid adjuvant, it being possible as a rule for 0 to 25%, especially 0.1 to 20%, of the composition to be surfactants(% in each case meaning percent by weight). Whereas concentrated compositions tend to be preferred for commercial goods, the end consumer as a rule uses dilute compositions which have substantially lower concentrations of active ingredient. Preferred compositions are composed in particular as follows (% = percent by weight):

Emulsifiable concentrates:

active ingredient:	1 to 95%, preferably 5 to 50%, more preferably 5 to 20%
surfactant:	1 to 30%, preferably 10 to 20 %
solvent:	5 to 98%, preferably 70 to 85%

Dusts:

active ingredient:	0.1 to 10%, preferably 0.1 to 1%
solid carrier:	99.9 to 90%, preferably 99.9 to 99%

Suspension concentrates:

active ingredient:	5 to 75%, preferably 10 to 50%, more preferably 10 to 40%
water:	94 to 24%, preferably 88 to 30%
surfactant:	1 to 40%, preferably 2 to 30%

Oil-based suspension concentrates:

active ingredient:	2 to 75%, preferably 5 to 50%
oil:	94 to 24%, preferably 88 to 30%
surfactant:	1 to 40%, preferably 2 to 30%

Wettable powders:

active ingredient:	0.5 to 90%, preferably 1 to 80%, more preferably 25 to 75%
surfactant:	0.5 to 20%, preferably 1 to 15%
solid carrier:	5 to 99%, preferably 15 to 98%

Granulates:

active ingredient:	0.5 to 30%, preferably 3 to 25%, more preferably 3 to 15%
solid carrier:	99.5 to 70%, preferably 97 to 85%

Preferably, the term "active ingredient" refers to one of the compounds selected from Tables 1 to 102 shown above. It also refers to mixtures of the compound of formula I, in particular a compound selected from said Tables 1 to 102, with other insecticides, fungicides, herbicides, safeners, adjuvants and the like, which mixtures are specifically disclosed below.

The compositions can also comprise further solid or liquid auxiliaries, such as stabilizers, for example unepoxidized or epoxidized vegetable oils (for example epoxidized coconut oil, rapeseed oil or soya oil), antifoams, for example silicone oil, preservatives, viscosity regulators, binders and/or tackifiers; fertilizers, in particular nitrogen containing fertilizers such as ammonium nitrates and urea as described in WO08/017388, which can enhance the efficacy of the inventive compounds; or other active ingredients for achieving specific effects, for example ammonium or phosphonium salts, in particular halides, (hydrogen)sulphates, nitrates, (hydrogen)carbonates, citrates, tartrates, formiates and acetates, as described in WO07/068427 and WO07/068428, which also can enhance the efficacy of the inventive compounds and which can be used in combination with penetration enhancers such as alkoxalated fatty acids; bactericides, fungicides, nematocides, plant activators, molluscicides or herbicides.

The compositions according to the invention are prepared in a manner known per se, in the absence of auxiliaries for example by grinding, screening and/or compressing a solid active

ingredient and in the presence of at least one auxiliary for example by intimately mixing and/or grinding the active ingredient with the auxiliary (auxiliaries). These processes for the preparation of the compositions and the use of the compounds I for the preparation of these compositions are also a subject of the invention.

The application methods for the compositions, that is the methods of controlling pests of the abovementioned type, such as spraying, atomizing, dusting, brushing on, dressing, scattering or pouring - which are to be selected to suit the intended aims of the prevailing circumstances - and the use of the compositions for controlling pests of the abovementioned type are other subjects of the invention. Typical rates of concentration are between 0.1 and 1000 ppm, preferably between 0.1 and 500 ppm, of active ingredient. The rate of application per hectare is generally 1 to 2000 g of active ingredient per hectare, in particular 10 to 1000 g/ha, preferably 10 to 600 g/ha.

A preferred method of application in the field of crop protection is application to the foliage of the plants (foliar application), it being possible to select frequency and rate of application to match the danger of infestation with the pest in question. Alternatively, the active ingredient can reach the plants via the root system (systemic action), by drenching the locus of the plants with a liquid composition or by incorporating the active ingredient in solid form into the locus of the plants, for example into the soil, for example in the form of granules (soil application). In the case of paddy rice crops, such granules can be metered into the flooded paddy-field.

The compositions according to the invention are also suitable for the protection of plant propagation material, for example seeds, such as fruit, tubers or kernels, or nursery plants, against pests of the abovementioned type. The propagation material can be treated with the compositions prior to planting, for example seed can be treated prior to sowing. Alternatively, the compositions can be applied to seed kernels (coating), either by soaking the kernels in a liquid composition or by applying a layer of a solid composition. It is also possible to apply the compositions when the propagation material is planted to the site of application, for example into the seed furrow during drilling. These treatment methods for plant propagation material and the plant propagation material thus treated are further subjects of the invention.

Further methods of application of the compositions according to the invention comprise drip application onto the soil, dipping of parts of plants such as roots bulbs or tubers, drenching the soil, as well as soil injection. These methods are known in the art.

In order to apply a compound of formula I as an insecticide, acaricide, nematicide or molluscicide to a pest, a locus of pest, or to a plant susceptible to attack by a pest, a compound of formula I is usually formulated into a composition which includes, in addition to the compound of formula I, a suitable inert diluent or carrier and, optionally, a formulation adjuvant in form of a surface active agent (SFA) as described herein or, for example, in EP-B-1062217. SFAs are chemicals which are able to modify the properties of an interface (for example, liquid/solid, liquid/air or liquid/liquid interfaces) by lowering the interfacial tension and thereby leading to changes in other properties (for example dispersion, emulsification and wetting). It is preferred that all compositions (both solid and liquid formulations) comprise, by weight, 0.0001 to 95%, more preferably 1 to 85%, for example 5 to 60%, of a compound of formula I. The composition is generally used for the control of pests such that a compound of formula I is applied at a rate of from 0.1g to10kg per hectare, preferably from 1g to 6kg per hectare, more preferably from 1g to 1kg per hectare.

When used in a seed dressing, a compound of formula I is used at a rate of 0.0001g to 10g (for example 0.001g or 0.05g), preferably 0.005g to 10g, more preferably 0.005g to 4g, per kilogram of seed.

In another aspect the present invention provides an insecticidal, acaricidal, nematicidal or molluscicidal composition comprising an insecticidally, acaricidally, nematicidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula I and a suitable carrier or diluent therefor.

In a still further aspect the invention provides a method of combating and controlling pests at a locus which comprises treating the pests or the locus of the pests with an insecticidally, acaricidally, nematicidally or molluscicidally effective amount of a composition comprising a compound of formula I.

The compositions can be chosen from a number of formulation types, including dustable powders (DP), soluble powders (SP), water soluble granules (SG), water dispersible granules (WG), wettable powders (WP), granules (GR) (slow or fast release), soluble

concentrates (SL), oil miscible liquids (OL), ultra low volume liquids (UL), emulsifiable concentrates (EC), dispersible concentrates (DC), emulsions (both oil in water (EW) and water in oil (EO)), micro-emulsions (ME), suspension concentrates (SC), oil-based suspension concentrates (OD), aerosols, fogging/smoke formulations, capsule suspensions (CS) and seed treatment formulations. The formulation type chosen in any instance will depend upon the particular purpose envisaged and the physical, chemical and biological properties of the compound of formula I..

Dustable powders (DP) may be prepared by mixing a compound of formula I with one or more solid diluents (for example natural clays, kaolin, pyrophyllite, bentonite, alumina, montmorillonite, kieselguhr, chalk, diatomaceous earths, calcium phosphates, calcium and magnesium carbonates, sulphur, lime, flours, talc and other organic and inorganic solid carriers) and mechanically grinding the mixture to a fine powder.

Soluble powders (SP) may be prepared by mixing a compound of formula I with one or more water-soluble inorganic salts (such as sodium bicarbonate, sodium carbonate or magnesium sulphate) or one or more water-soluble organic solids (such as a polysaccharide) and, optionally, one or more wetting agents, one or more dispersing agents or a mixture of said agents to improve water dispersibility/solubility. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water soluble granules (SG).

Wettable powders (WP) may be prepared by mixing a compound of formula I with one or more solid diluents or carriers, one or more wetting agents and, preferably, one or more dispersing agents and, optionally, one or more suspending agents to facilitate the dispersion in liquids. The mixture is then ground to a fine powder. Similar compositions may also be granulated to form water dispersible granules (WG).

Granules (GR) may be formed either by granulating a mixture of a compound of formula I and one or more powdered solid diluents or carriers, or from pre-formed blank granules by absorbing a compound of formula I (or a solution thereof, in a suitable agent) in a porous granular material (such as pumice, attapulgite clays, fuller's earth, kieselguhr, diatomaceous earths or ground corn cobs) or by adsorbing a compound of formula I (or a solution thereof, in a suitable agent) on to a hard core material (such as sands, silicates, mineral carbonates, sulphates or phosphates) and drying if necessary. Agents which are

commonly used to aid absorption or adsorption include solvents (such as aliphatic and aromatic petroleum solvents, alcohols, ethers, ketones and esters) and sticking agents (such as polyvinyl acetates, polyvinyl alcohols, dextrins, sugars and vegetable oils). One or more other additives may also be included in granules (for example an emulsifying agent, wetting agent or dispersing agent).

Dispersible Concentrates (DC) may be prepared by dissolving a compound of formula I in water or an organic solvent, such as a ketone, alcohol or glycol ether. These solutions may contain a surface active agent (for example to improve water dilution or prevent crystallisation in a spray tank).

Emulsifiable concentrates (EC) or oil-in-water emulsions (EW) may be prepared by dissolving a compound of formula I in an organic solvent (optionally containing one or more wetting agents, one or more emulsifying agents or a mixture of said agents). Suitable organic solvents for use in ECs include aromatic hydrocarbons (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes, exemplified by SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 and SOLVESSO 200; SOLVESSO is a Registered Trade Mark), ketones (such as cyclohexanone or methylcyclohexanone) and alcohols (such as benzyl alcohol, furfuryl alcohol or butanol), N-alkylpyrrolidones (such as N-methylpyrrolidone or N-octylpyrrolidone), dimethyl amides of fatty acids (such as C_8-C_{10} fatty acid dimethylamide) and chlorinated hydrocarbons. An EC product may spontaneously emulsify on addition to water, to produce an emulsion with sufficient stability to allow spray application through appropriate equipment. Preparation of an EW involves obtaining a compound of formula I either as a liquid (if it is not a liquid at room temperature, it may be melted at a reasonable temperature, typically below 70°C) or in solution (by dissolving it in an appropriate solvent) and then emulsifiying the resultant liquid or solution into water containing one or more SFAs, under high shear, to produce an emulsion. Suitable solvents for use in EWs include vegetable oils, chlorinated hydrocarbons (such as chlorobenzenes), aromatic solvents (such as alkylbenzenes or alkylnaphthalenes) and other appropriate organic solvents which have a low solubility in water.

Microemulsions (ME) may be prepared by mixing water with a blend of one or more solvents with one or more SFAs, to produce spontaneously a thermodynamically stable isotropic liquid formulation. A compound of formula I is present initially in either the water or the solvent/SFA blend. Suitable solvents for use in MEs include those hereinbefore

described for use in in ECs or in EWs. An ME may be either an oil-in-water or a water-in-oil system (which system is present may be determined by conductivity measurements) and may be suitable for mixing water-soluble and oil-soluble pesticides in the same formulation. An ME is suitable for dilution into water, either remaining as a microemulsion or forming a conventional oil-in-water emulsion.

Suspension concentrates (SC) may comprise aqueous or non-aqueous suspensions of finely divided insoluble solid particles of a compound of formula I. SCs may be prepared by ball or bead milling the solid compound of formula I in a suitable medium, optionally with one or more dispersing agents, to produce a fine particle suspension of the compound. One or more wetting agents may be included in the composition and a suspending agent may be included to reduce the rate at which the particles settle. Alternatively, a compound of formula I may be dry milled and added to water, containing agents hereinbefore described, to produce the desired end product.

Oil-based suspension concentrate (OD) may be prepared similarly by suspending finely divided insoluble solid particles of a compound of formula I in an organic fluid (for example at least one mineral oil or vegetable oil). ODs may further comprise at least one penetration promoter (for example an alcohol ethoxylate or a related compound), at least one non-ionic surfactants and/or at least one anionic surfactant, and optionally at least one additive from the group of emulsifiers, foam-inhibiting agents, preservatives, anti-oxidants, dyestuffs, and/or inert filler materials. An OD is intended and suitable for dilution with water before use to produce a spray solution with sufficient stability to allow spray application through appropriate equipment.

Aerosol formulations comprise a compound of formula I and a suitable propellant (for example *n*-butane). A compound of formula I may also be dissolved or dispersed in a suitable medium (for example water or a water miscible liquid, such as *n*-propanol) to provide compositions for use in non-pressurised, hand-actuated spray pumps.

A compound of formula I may be mixed in the dry state with a pyrotechnic mixture to form a composition suitable for generating, in an enclosed space, a smoke containing the compound.

Capsule suspensions (CS) may be prepared in a manner similar to the preparation of EW formulations but with an additional polymerisation stage such that an aqueous dispersion of oil droplets is obtained, in which each oil droplet is encapsulated by a polymeric shell and contains a compound of formula I and, optionally, a carrier or diluent therefor. The polymeric shell may be produced by either an interfacial polycondensation reaction or by a coacervation procedure. The compositions may provide for controlled release of the compound of formula I and they may be used for seed treatment. A compound of formula I may also be formulated in a biodegradable polymeric matrix to provide a slow, controlled release of the compound.

A compound of formula I may also be formulated for use as a seed treatment, for example as a powder composition, including a powder for dry seed treatment (DS), a water soluble powder (SS) or a water dispersible powder for slurry treatment (WS), or as a liquid composition, including a flowable concentrate (FS), a solution (LS) or a capsule suspension (CS). The preparations of DS, SS, WS, FS and LS compositions are very similar to those of, respectively, DP, SP, WP, SC, OD and DC compositions described above. Compositions for treating seed may include an agent for assisting the adhesion of the composition to the seed (for example a mineral oil or a film-forming barrier).

A composition of the present invention may include one or more additives to improve the biological performance of the composition (for example by improving wetting, retention or distribution on surfaces; resistance to rain on treated surfaces; or uptake or mobility of a compound of formula I). Such additives include surface active agents (SFAs), spray additives based on oils, for example certain mineral oils, vegetable oils or natural plant oils (such as soy bean and rape seed oil), and blends of these with other bio-enhancing adjuvants (ingredients which may aid or modify the action of a compound of formula I). Increasing the effect of a compound of formula I may for example be achieved by adding ammonium and/or phosphonium salts, and/or optionally at least one penetration promotor such as fatty alcohol alkoxylates (for example rape oil methyl ester) or vegetable oil esters.

Wetting agents, dispersing agents and emulsifying agents may be surface active agents (SFAs) of the cationic, anionic, amphoteric or non-ionic type.

Suitable SFAs of the cationic type include quaternary ammonium compounds (for example cetyltrimethyl ammonium bromide), imidazolines and amine salts.

Suitable anionic SFAs include alkali metals salts of fatty acids, salts of aliphatic monoesters of sulphuric acid (for example sodium lauryl sulphate), salts of sulphonated aromatic compounds (for example sodium dodecylbenzenesulphonate, calcium dodecylbenzenesulphonate, butylnaphthalene sulphonate and mixtures of sodium di-*iso*propyl- and tri-*iso*propyl-naphthalene sulphonates), ether sulphates, alcohol ether sulphates (for example sodium laureth-3-sulphate), ether carboxylates (for example sodium laureth-3-carboxylate), phosphate esters (products from the reaction between one or more fatty alcohols and phosphoric acid (predominately mono-esters) or phosphorus pentoxide (predominately di-esters), for example the reaction between lauryl alcohol and tetraphosphoric acid; additionally these products may be ethoxylated), sulphosuccinamates, paraffin or olefine sulphonates, taurates and lignosulphonates.

Suitable SFAs of the amphoteric type include betaines, propionates and glycinates.

Suitable SFAs of the non-ionic type include condensation products of alkylene oxides, such as ethylene oxide, propylene oxide, butylene oxide or mixtures thereof, with fatty alcohols (such as oleyl alcohol or cetyl alcohol) or with alkylphenols (such as octylphenol, nonylphenol or octylcresol); partial esters derived from long chain fatty acids or hexitol anhydrides; condensation products of said partial esters with ethylene oxide; block polymers (comprising ethylene oxide and propylene oxide); alkanolamides; simple esters (for example fatty acid polyethylene glycol esters); amine oxides (for example lauryl dimethyl amine oxide); and lecithins.

Suitable suspending agents include hydrophilic colloids (such as polysaccharides, polyvinylpyrrolidone or sodium carboxymethylcellulose) and swelling clays (such as bentonite or attapulgite).

A compound of formula I may be applied by any of the known means of applying pesticidal compounds. For example, it may be applied, formulated or unformulated, to the pests or to a locus of the pests (such as a habitat of the pests, or a growing plant liable to infestation by the pests) or to any part of the plant, including the foliage, stems, branches or roots, to the seed before it is planted or to other media in which plants are growing or are to be planted (such as soil surrounding the roots, the soil generally, paddy water or hydroponic culture systems), directly or it may be sprayed on, dusted on, applied by dipping, applied as

a cream or paste formulation, applied as a vapour or applied through distribution or incorporation of a composition (such as a granular composition or a composition packed in a water-soluble bag) in soil or an aqueous environment.

A compound of formula I may also be injected into plants or sprayed onto vegetation using electrodynamic spraying techniques or other low volume methods, or applied by land or aerial irrigation systems.

Compositions for use as aqueous preparations (aqueous solutions or dispersions) are generally supplied in the form of a concentrate containing a high proportion of the active ingredient, the concentrate being added to water before use. These concentrates, which may include DCs, SCs, ODs, ECs, EWs, MEs SGs, SPs, WPs, WGs and CSs, are often required to withstand storage for prolonged periods and, after such storage, to be capable of addition to water to form aqueous preparations which remain homogeneous for a sufficient time to enable them to be applied by conventional spray equipment. Such aqueous preparations may contain varying amounts of a compound of formula I (for example 0.0001 to 10%, by weight) depending upon the purpose for which they are to be used.

A compound of formula I may be used in mixtures with fertilisers (for example nitrogen-, potassium- or phosphorus-containing fertilisers, and more particularly ammonium nitrate and/or urea fertilizers). Suitable formulation types include granules of fertiliser. The mixtures suitably contain up to 25% by weight of the compound of formula I.

The invention therefore also provides a fertiliser composition comprising a fertiliser and a compound of formula I.

The compositions of this invention may contain other compounds having biological activity, for example micronutrients or compounds having fungicidal activity or which possess plant growth regulating, herbicidal, safening, insecticidal, nematicidal or acaricidal activity.

The compound of formula I may be the sole active ingredient of the composition or it may be admixed with one or more additional active ingredients such as a pesticide (insect, acarine, mollusc and nematode pesticide), fungicide, synergist, herbicide, safener or plant growth regulator where appropriate. The activity of the compositions according to the

invention may thereby be broadened considerably and may have surprising advantages which can also be described, in a wider sense, as synergistic activity. An additional active ingredient may: provide a composition having a broader spectrum of activity or increased persistence at a locus; provide a composition demonstrating better plant/crop tolerance by reducing phytotoxicity; provide a composition controlling insects in their different development stages; synergise the activity or complement the activity (for example by increasing the speed of effect or overcoming repellency) of the compound of formula I; or help to overcome or prevent the development of resistance to individual components. The particular additional active ingredient will depend upon the intended utility of the composition. Examples of suitable pesticides include the following:

a) Pyrethroids, such as permethrin, cypermethrin, fenvalerate, esfenvalerate, deltamethrin, cyhalothrin (in particular lambda-cyhalothrin), bifenthrin, fenpropathrin, cyfluthrin, tefluthrin, fish safe pyrethroids (for example ethofenprox), natural pyrethrin, tetramethrin, s-bioallethrin, fenfluthrin, prallethrin or 5-benzyl-3-furylmethyl-(E)-(1R,3S)-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropane carboxylate;

b) Organophosphates, such as, profenofos, sulprofos, acephate, methyl parathion, azinphos-methyl, demeton-s-methyl, heptenophos, thiometon, fenamiphos, monocrotophos, profenofos, triazophos, methamidophos, dimethoate, phosphamidon, malathion, chlorpyrifos, phosalone, terbufos, fensulfothion, fonofos, phorate, phoxim, pirimiphos-methyl, pirimiphos-ethyl, fenitrothion, fosthiazate or diazinon;

c) Carbamates (including aryl carbamates), such as pirimicarb, triazamate, cloethocarb, carbofuran, furathiocarb, ethiofencarb, aldicarb, thiofurox, carbosulfan, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, methomyl or oxamyl;

d) Benzoyl ureas, such as diflubenzuron, triflumuron, hexaflumuron, flufenoxuron or chlorfluazuron;

e) Organic tin compounds, such as cyhexatin, fenbutatin oxide or azocyclotin;

f) Pyrazoles, such as tebufenpyrad and fenpyroximate;

g) Macrolides, such as avermectins or milbemycins, for example abamectin, emamectin benzoate, ivermectin, milbemycin, or spinosad, spinetoram or azadirachtin;

h) Hormones or pheromones;

i) Organochlorine compounds such as endosulfan, benzene hexachloride, DDT, chlordane or dieldrin;

j) Amidines, such as chlordimeform or amitraz;

k) Fumigant agents, such as chloropicrin, dichloropropane, methyl bromide or metam;

l) Neonicotinoid compounds such as imidacloprid, thiacloprid, acetamiprid, clothianidin, nitenpyram, dinotefuran or thiamethoxam;

m) Diacylhydrazines, such as tebufenozide, chromafenozide or methoxyfenozide;

n) Diphenyl ethers, such as diofenolan or pyriproxifen;

o) Indoxacarb;

p) Chlorfenapyr;

q) Pymetrozine or pyrifluquinazon;

r) Spirotetramat, spirodiclofen or spiromesifen;

s) Flubendiamide, chloranthraliniprole, or cyanthraniliprole;

t) Cyenopyrafen or cyflumetofen; or

u) Sulfoxaflor.

In addition to the major chemical classes of pesticide listed above, other pesticides having particular targets may be employed in the composition, if appropriate for the intended utility of the composition. For instance, selective insecticides for particular crops, for example stemborer specific insecticides (such as cartap) or hopper specific insecticides (such as buprofezin) for use in rice may be employed. Alternatively insecticides or acaricides specific for particular insect species/stages may also be included in the compositions (for example acaricidal ovo-larvicides, such as clofentezine, flubenzimine, hexythiazox or tetradifon; acaricidal motilicides, such as dicofol or propargite; acaricides, such as bromopropylate or chlorobenzilate; or growth regulators, such as hydramethylnon, cyromazine, methoprene, chlorfluazuron or diflubenzuron).

The following mixtures of the compounds of formula I with active ingredients are preferred, wherein, preferably, the term "COMPOUND OF FORMULA I" refers to a compound selected from the Tables 1 to 102:

an adjuvant selected from the group of substances consisting an oil of vegetable or animal origin, a mineral oil, alkyl esters of such oils or mixtures of such oils, and petroleum oils (alternative name) (628) + COMPOUND OF FORMULA I,

an acaricide selected from the group of substances consisting of 1,1-bis(4-chlorophenyl)-2-ethoxyethanol (IUPAC name) (910) + COMPOUND OF FORMULA I, 2,4-dichlorophenyl benzenesulfonate (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1059) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-fluoro-*N*-methyl-*N*-1-naphthylacetamide (IUPAC name) (1295) + COMPOUND OF FORMULA I, 4-chlorophenyl phenyl sulfone (IUPAC name) (981) + COMPOUND OF FORMULA I, abamectin (1) + COMPOUND OF FORMULA I,

acequinocyl (3) + COMPOUND OF FORMULA I, acetoprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, acrinathrin (9) + COMPOUND OF FORMULA I, aldicarb (16) + COMPOUND OF FORMULA I, aldoxycarb (863) + COMPOUND OF FORMULA I, alpha-cypermethrin (202) + COMPOUND OF FORMULA I, amidithion (870) + COMPOUND OF FORMULA I, amidoflumet [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, amidothioate (872) + COMPOUND OF FORMULA I, amiton (875) + COMPOUND OF FORMULA I, amiton hydrogen oxalate (875) + COMPOUND OF FORMULA I, amitraz (24) + COMPOUND OF FORMULA I, aramite (881) + COMPOUND OF FORMULA I, arsenous oxide (882) + COMPOUND OF FORMULA I, AVI 382 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, AZ 60541 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, azinphos-ethyl (44) + COMPOUND OF FORMULA I, azinphos-methyl (45) + COMPOUND OF FORMULA I, azobenzene (IUPAC name) (888) + COMPOUND OF FORMULA I, azocyclotin (46) + COMPOUND OF FORMULA I, azothoate (889) + COMPOUND OF FORMULA I, benomyl (62) + COMPOUND OF FORMULA I, benoxafos (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, benzoximate (71) + COMPOUND OF FORMULA I, benzyl benzoate (IUPAC name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, bifenazate (74) + COMPOUND OF FORMULA I, bifenthrin (76) + COMPOUND OF FORMULA I, binapacryl (907) + COMPOUND OF FORMULA I, brofenvalerate (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, bromocyclen (918) + COMPOUND OF FORMULA I, bromophos (920) + COMPOUND OF FORMULA I, bromophos-ethyl (921) + COMPOUND OF FORMULA I, bromopropylate (94) + COMPOUND OF FORMULA I, buprofezin (99) + COMPOUND OF FORMULA I, butocarboxim (103) + COMPOUND OF FORMULA I, butoxycarboxim (104) + COMPOUND OF FORMULA I, butylpyridaben (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, calcium polysulfide (IUPAC name) (111) + COMPOUND OF FORMULA I, camphechlor (941) + COMPOUND OF FORMULA I, carbanolate (943) + COMPOUND OF FORMULA I, carbaryl (115) + COMPOUND OF FORMULA I, carbofuran (118) + COMPOUND OF FORMULA I, carbophenothion (947) + COMPOUND OF FORMULA I, CGA 50'439 (development code) (125) + COMPOUND OF FORMULA I, chinomethionat (126) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorbenside (959) + COMPOUND OF FORMULA I, chlordimeform (964) + COMPOUND OF FORMULA I, chlordimeform hydrochloride (964) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfenapyr (130) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfenethol (968) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfenson (970) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfensulphide (971) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfenvinphos (131) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorobenzilate (975) + COMPOUND OF FORMULA I, chloromebuform (977) + COMPOUND OF FORMULA I,

chloromethiuron (978) + COMPOUND OF FORMULA I, chloropropylate (983) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorpyrifos (145) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorpyrifos-methyl (146) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorthiophos (994) + COMPOUND OF FORMULA I, cinerin I (696) + COMPOUND OF FORMULA I, cinerin II (696) + COMPOUND OF FORMULA I, cinerins (696) + COMPOUND OF FORMULA I, clofentezine (158) + COMPOUND OF FORMULA I, closantel (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, coumaphos (174) + COMPOUND OF FORMULA I, crotamiton (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, crotoxyphos (1010) + COMPOUND OF FORMULA I, cufraneb (1013) + COMPOUND OF FORMULA I, cyanthoate (1020) + COMPOUND OF FORMULA I, cyenopyrafen [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, cyflumetofen (CAS Reg. No.: 400882-07-7) + COMPOUND OF FORMULA I, cyhalothrin (196) + COMPOUND OF FORMULA I, cyhexatin (199) + COMPOUND OF FORMULA I, cypermethrin (201) + COMPOUND OF FORMULA I, DCPM (1032) + COMPOUND OF FORMULA I, DDT (219) + COMPOUND OF FORMULA I, demephion (1037) + COMPOUND OF FORMULA I, demephion-O (1037) + COMPOUND OF FORMULA I, demephion-S (1037) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton (1038) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-methyl (224) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-O (1038) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-O-methyl (224) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-S (1038) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-S-methyl (224) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-S-methylsulphon (1039) + COMPOUND OF FORMULA I, diafenthiuron (226) + COMPOUND OF FORMULA I, dialifos (1042) + COMPOUND OF FORMULA I, diazinon (227) + COMPOUND OF FORMULA I, dichlofluanid (230) + COMPOUND OF FORMULA I, dichlorvos (236) + COMPOUND OF FORMULA I, dicliphos (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, dicofol (242) + COMPOUND OF FORMULA I, dicrotophos (243) + COMPOUND OF FORMULA I, dienochlor (1071) + COMPOUND OF FORMULA I, diflovidazin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dimefox (1081) + COMPOUND OF FORMULA I, dimethoate (262) + COMPOUND OF FORMULA I, dinactin (alternative name) (653) + COMPOUND OF FORMULA I, dinex (1089) + COMPOUND OF FORMULA I, dinex-diclexine (1089) + COMPOUND OF FORMULA I, dinobuton (269) + COMPOUND OF FORMULA I, dinocap (270) + COMPOUND OF FORMULA I, dinocap-4 [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dinocap-6 [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dinocton (1090) + COMPOUND OF FORMULA I, dinopenton (1092) + COMPOUND OF FORMULA I, dinosulfon (1097) + COMPOUND OF FORMULA I, dinoterbon (1098) + COMPOUND OF FORMULA I, dioxathion (1102) +

COMPOUND OF FORMULA I, diphenyl sulfone (IUPAC name) (1103) + COMPOUND OF FORMULA I, disulfiram (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, disulfoton (278) + COMPOUND OF FORMULA I, DNOC (282) + COMPOUND OF FORMULA I, dofenapyn (1113) + COMPOUND OF FORMULA I, doramectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, endosulfan (294) + COMPOUND OF FORMULA I, endothion (1121) + COMPOUND OF FORMULA I, EPN (297) + COMPOUND OF FORMULA I, eprinomectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ethion (309) + COMPOUND OF FORMULA I, ethoate-methyl (1134) + COMPOUND OF FORMULA I, etoxazole (320) + COMPOUND OF FORMULA I, etrimfos (1142) + COMPOUND OF FORMULA I, fenazaflor (1147) + COMPOUND OF FORMULA I, fenazaquin (328) + COMPOUND OF FORMULA I, fenbutatin oxide (330) + COMPOUND OF FORMULA I, fenothiocarb (337) + COMPOUND OF FORMULA I, fenpropathrin (342) + COMPOUND OF FORMULA I, fenpyrad (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, fenpyroximate (345) + COMPOUND OF FORMULA I, fenson (1157) + COMPOUND OF FORMULA I, fentrifanil (1161) + COMPOUND OF FORMULA I, fenvalerate (349) + COMPOUND OF FORMULA I, fipronil (354) + COMPOUND OF FORMULA I, fluacrypyrim (360) + COMPOUND OF FORMULA I, fluazuron (1166) + COMPOUND OF FORMULA I, flubenzimine (1167) + COMPOUND OF FORMULA I, flucycloxuron (366) + COMPOUND OF FORMULA I, flucythrinate (367) + COMPOUND OF FORMULA I, fluenetil (1169) + COMPOUND OF FORMULA I, flufenoxuron (370) + COMPOUND OF FORMULA I, flumethrin (372) + COMPOUND OF FORMULA I, fluorbenside (1174) + COMPOUND OF FORMULA I, fluvalinate (1184) + COMPOUND OF FORMULA I, FMC 1137 (development code) (1185) + COMPOUND OF FORMULA I, formetanate (405) + COMPOUND OF FORMULA I, formetanate hydrochloride (405) + COMPOUND OF FORMULA I, formothion (1192) + COMPOUND OF FORMULA I, formparanate (1193) + COMPOUND OF FORMULA I, gamma-HCH (430) + COMPOUND OF FORMULA I, glyodin (1205) + COMPOUND OF FORMULA I, halfenprox (424) + COMPOUND OF FORMULA I, heptenophos (432) + COMPOUND OF FORMULA I, hexadecyl cyclopropanecarboxylate (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1216) + COMPOUND OF FORMULA I, hexythiazox (441) + COMPOUND OF FORMULA I, IKA 2002 (CAS Reg. No.: 211923-74-9) + COMPOUND OF FORMULA I, iodomethane (IUPAC name) (542) + COMPOUND OF FORMULA I, isocarbophos (alternative name) (473) + COMPOUND OF FORMULA I, isopropyl *O*-(methoxyaminothiophosphoryl)salicylate (IUPAC name) (473) + COMPOUND OF FORMULA I, ivermectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I,

jasmolin I (696) + COMPOUND OF FORMULA I, jasmolin II (696) + COMPOUND OF FORMULA I, jodfenphos (1248) + COMPOUND OF FORMULA I, lindane (430) + COMPOUND OF FORMULA I, lufenuron (490) + COMPOUND OF FORMULA I, malathion (492) + COMPOUND OF FORMULA I, malonoben (1254) + COMPOUND OF FORMULA I, mecarbam (502) + COMPOUND OF FORMULA I, mephosfolan (1261) + COMPOUND OF FORMULA I, mesulfen (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, methacrifos (1266) + COMPOUND OF FORMULA I, methamidophos (527) + COMPOUND OF FORMULA I, methidathion (529) + COMPOUND OF FORMULA I, methiocarb (530) + COMPOUND OF FORMULA I, methomyl (531) + COMPOUND OF FORMULA I, methyl bromide (537) + COMPOUND OF FORMULA I, metolcarb (550) + COMPOUND OF FORMULA I, mevinphos (556) + COMPOUND OF FORMULA I, mexacarbate (1290) + COMPOUND OF FORMULA I, milbemectin (557) + COMPOUND OF FORMULA I, milbemycin oxime (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, mipafox (1293) + COMPOUND OF FORMULA I, monocrotophos (561) + COMPOUND OF FORMULA I, morphothion (1300) + COMPOUND OF FORMULA I, moxidectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, naled (567) + COMPOUND OF FORMULA I, NC-184 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, NC-512 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, nifluridide (1309) + COMPOUND OF FORMULA I, nikkomycins (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, nitrilacarb (1313) + COMPOUND OF FORMULA I, nitrilacarb 1:1 zinc chloride complex (1313) + COMPOUND OF FORMULA I, NNI-0101 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, NNI-0250 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, omethoate (594) + COMPOUND OF FORMULA I, oxamyl (602) + COMPOUND OF FORMULA I, oxydeprofos (1324) + COMPOUND OF FORMULA I, oxydisulfoton (1325) + COMPOUND OF FORMULA I, pp'-DDT (219) + COMPOUND OF FORMULA I, parathion (615) + COMPOUND OF FORMULA I, permethrin (626) + COMPOUND OF FORMULA I, petroleum oils (alternative name) (628) + COMPOUND OF FORMULA I, phenkapton (1330) + COMPOUND OF FORMULA I, phenthoate (631) + COMPOUND OF FORMULA I, phorate (636) + COMPOUND OF FORMULA I, phosalone (637) + COMPOUND OF FORMULA I, phosfolan (1338) + COMPOUND OF FORMULA I, phosmet (638) + COMPOUND OF FORMULA I, phosphamidon (639) + COMPOUND OF FORMULA I, phoxim (642) + COMPOUND OF FORMULA I, pirimiphos-methyl (652) + COMPOUND OF FORMULA I, polychloroterpenes (traditional name) (1347) + COMPOUND OF FORMULA I, polynactins (alternative name) (653) + COMPOUND OF FORMULA I, proclonol (1350) + COMPOUND OF FORMULA I,

profenofos (662) + COMPOUND OF FORMULA I, promacyl (1354) + COMPOUND OF FORMULA I, propargite (671) + COMPOUND OF FORMULA I, propetamphos (673) + COMPOUND OF FORMULA I, propoxur (678) + COMPOUND OF FORMULA I, prothidathion (1360) + COMPOUND OF FORMULA I, prothoate (1362) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrethrin I (696) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrethrin II (696) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrethrins (696) + COMPOUND OF FORMULA I, pyridaben (699) + COMPOUND OF FORMULA I, pyridaphenthion (701) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrimidifen (706) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrimitate (1370) + COMPOUND OF FORMULA I, quinalphos (711) + COMPOUND OF FORMULA I, quintiofos (1381) + COMPOUND OF FORMULA I, R-1492 (development code) (1382) + COMPOUND OF FORMULA I, RA-17 (development code) (1383) + COMPOUND OF FORMULA I, rotenone (722) + COMPOUND OF FORMULA I, schradan (1389) + COMPOUND OF FORMULA I, sebufos (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, selamectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, SI-0009 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, sophamide (1402) + COMPOUND OF FORMULA I, spirodiclofen (738) + COMPOUND OF FORMULA I, spiromesifen (739) + COMPOUND OF FORMULA I, SSI-121 (development code) (1404) + COMPOUND OF FORMULA I, sulfiram (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sulfluramid (750) + COMPOUND OF FORMULA I, sulfotep (753) + COMPOUND OF FORMULA I, sulfur (754) + COMPOUND OF FORMULA I, SZI-121 (development code) (757) + COMPOUND OF FORMULA I, tau-fluvalinate (398) + COMPOUND OF FORMULA I, tebufenpyrad (763) + COMPOUND OF FORMULA I, TEPP (1417) + COMPOUND OF FORMULA I, terbam (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, tetrachlorvinphos (777) + COMPOUND OF FORMULA I, tetradifon (786) + COMPOUND OF FORMULA I, tetranactin (alternative name) (653) + COMPOUND OF FORMULA I, tetrasul (1425) + COMPOUND OF FORMULA I, thiafenox (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, thiocarboxime (1431) + COMPOUND OF FORMULA I, thiofanox (800) + COMPOUND OF FORMULA I, thiometon (801) + COMPOUND OF FORMULA I, thioquinox (1436) + COMPOUND OF FORMULA I, thuringiensin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, triamiphos (1441) + COMPOUND OF FORMULA I, triarathene (1443) + COMPOUND OF FORMULA I, triazophos (820) + COMPOUND OF FORMULA I, triazuron (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, trichlorfon (824) + COMPOUND OF FORMULA I, trifenofos (1455) + COMPOUND OF FORMULA I, trinactin (alternative name) (653) +

COMPOUND OF FORMULA I, vamidothion (847) + COMPOUND OF FORMULA I, vaniliprole [CCN] and YI-5302 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I,

an algicide selected from the group of substances consisting of bethoxazin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, copper dioctanoate (IUPAC name) (170) + COMPOUND OF FORMULA I, copper sulfate (172) + COMPOUND OF FORMULA I, cybutryne [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dichlone (1052) + COMPOUND OF FORMULA I, dichlorophen (232) + COMPOUND OF FORMULA I, endothal (295) + COMPOUND OF FORMULA I, fentin (347) + COMPOUND OF FORMULA I, hydrated lime [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, nabam (566) + COMPOUND OF FORMULA I, quinoclamine (714) + COMPOUND OF FORMULA I, quinonamid (1379) + COMPOUND OF FORMULA I, simazine (730) + COMPOUND OF FORMULA I, triphenyltin acetate (IUPAC name) (347) and triphenyltin hydroxide (IUPAC name) (347) + COMPOUND OF FORMULA I,

an anthelmintic selected from the group of substances consisting of abamectin (1) + COMPOUND OF FORMULA I, crufomate (1011) + COMPOUND OF FORMULA I, doramectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, emamectin (291) + COMPOUND OF FORMULA I, emamectin benzoate (291) + COMPOUND OF FORMULA I, eprinomectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ivermectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, milbemycin oxime (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, moxidectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, piperazine [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, selamectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, spinosad (737) and thiophanate (1435) + COMPOUND OF FORMULA I,

an avicide selected from the group of substances consisting of chloralose (127) + COMPOUND OF FORMULA I, endrin (1122) + COMPOUND OF FORMULA I, fenthion (346) + COMPOUND OF FORMULA I, pyridin-4-amine (IUPAC name) (23) and strychnine (745) + COMPOUND OF FORMULA I,

a bactericide selected from the group of substances consisting of 1-hydroxy-1*H*-pyridine-2-thione (IUPAC name) (1222) + COMPOUND OF FORMULA I, 4-(quinoxalin-2-ylamino)benzenesulfonamide (IUPAC name) (748) + COMPOUND OF FORMULA I, 8-hydroxyquinoline sulfate (446) + COMPOUND OF FORMULA I, bronopol (97) + COMPOUND OF FORMULA I, copper dioctanoate (IUPAC name) (170) + COMPOUND OF FORMULA I, copper hydroxide (IUPAC name) (169) + COMPOUND OF FORMULA I, cresol [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dichlorophen (232) + COMPOUND OF FORMULA I, dipyrithione (1105) + COMPOUND OF FORMULA I, dodicin (1112) +

COMPOUND OF FORMULA I, fenaminosulf (1144) + COMPOUND OF FORMULA I, formaldehyde (404) + COMPOUND OF FORMULA I, hydrargaphen (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, kasugamycin (483) + COMPOUND OF FORMULA I, kasugamycin hydrochloride hydrate (483) + COMPOUND OF FORMULA I, nickel bis(dimethyldithiocarbamate) (IUPAC name) (1308) + COMPOUND OF FORMULA I, nitrapyrin (580) + COMPOUND OF FORMULA I, octhilinone (590) + COMPOUND OF FORMULA I, oxolinic acid (606) + COMPOUND OF FORMULA I, oxytetracycline (611) + COMPOUND OF FORMULA I, potassium hydroxyquinoline sulfate (446) + COMPOUND OF FORMULA I, probenazole (658) + COMPOUND OF FORMULA I, streptomycin (744) + COMPOUND OF FORMULA I, streptomycin sesquisulfate (744) + COMPOUND OF FORMULA I, tecloftalam (766) + COMPOUND OF FORMULA I, and thiomersal (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I,

a biological agent selected from the group of substances consisting of *Adoxophyes orana* GV (alternative name) (12) + COMPOUND OF FORMULA I, *Agrobacterium radiobacter* (alternative name) (13) + COMPOUND OF FORMULA I, *Amblyseius* spp. (alternative name) (19) + COMPOUND OF FORMULA I, *Anagrapha falcifera* NPV (alternative name) (28) + COMPOUND OF FORMULA I, *Anagrus atomus* (alternative name) (29) + COMPOUND OF FORMULA I, *Aphelinus abdominalis* (alternative name) (33) + COMPOUND OF FORMULA I, *Aphidius colemani* (alternative name) (34) + COMPOUND OF FORMULA I, *Aphidoletes aphidimyza* (alternative name) (35) + COMPOUND OF FORMULA I, *Autographa californica* NPV (alternative name) (38) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus firmus* (alternative name) (48) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus sphaericus* Neide (scientific name) (49) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus thuringiensis* Berliner (scientific name) (51) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (scientific name) (51) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (scientific name) (51) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (scientific name) (51) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (scientific name) (51) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* (scientific name) (51) + COMPOUND OF FORMULA I, *Beauveria bassiana* (alternative name) (53) + COMPOUND OF FORMULA I, *Beauveria brongniartii* (alternative name) (54) + COMPOUND OF FORMULA I, *Chrysoperla carnea* (alternative name) (151) + COMPOUND OF FORMULA I, *Cryptolaemus montrouzieri* (alternative name) (178) + COMPOUND OF FORMULA I, *Cydia pomonella* GV (alternative name) (191) + COMPOUND OF FORMULA I, *Dacnusa sibirica* (alternative name) (212) + COMPOUND

OF FORMULA I, *Diglyphus isaea* (alternative name) (254) + COMPOUND OF FORMULA I, *Encarsia formosa* (scientific name) (293) + COMPOUND OF FORMULA I, *Eretmocerus eremicus* (alternative name) (300) + COMPOUND OF FORMULA I, *Helicoverpa zea* NPV (alternative name) (431) + COMPOUND OF FORMULA I, *Heterorhabditis bacteriophora* and *H. megidis* (alternative name) (433) + COMPOUND OF FORMULA I, *Hippodamia convergens* (alternative name) (442) + COMPOUND OF FORMULA I, *Leptomastix dactylopii* (alternative name) (488) + COMPOUND OF FORMULA I, *Macrolophus caliginosus* (alternative name) (491) + COMPOUND OF FORMULA I, *Mamestra brassicae* NPV (alternative name) (494) + COMPOUND OF FORMULA I, *Metaphycus helvolus* (alternative name) (522) + COMPOUND OF FORMULA I, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (scientific name) (523) + COMPOUND OF FORMULA I, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (scientific name) (523) + COMPOUND OF FORMULA I, *Neodiprion sertifer* NPV and *N. lecontei* NPV (alternative name) (575) + COMPOUND OF FORMULA I, *Orius* spp. (alternative name) (596) + COMPOUND OF FORMULA I, *Paecilomyces fumosoroseus* (alternative name) (613) + COMPOUND OF FORMULA I, *Phytoseiulus persimilis* (alternative name) (644) + COMPOUND OF FORMULA I, *Spodoptera exigua* multicapsid nuclear polyhedrosis virus (scientific name) (741) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema bibionis* (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema carpocapsae* (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema feltiae* (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema glaseri* (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema riobravé* (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema riobravis* (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema scapterisci* (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Steinernema* spp. (alternative name) (742) + COMPOUND OF FORMULA I, *Trichogramma* spp. (alternative name) (826) + COMPOUND OF FORMULA I, *Typhlodromus occidentalis* (alternative name) (844) and *Verticillium lecanii* (alternative name) (848) + COMPOUND OF FORMULA I,

a soil sterilant selected from the group of substances consisting of iodomethane (IUPAC name) (542) and methyl bromide (537) + COMPOUND OF FORMULA I,

a chemosterilant selected from the group of substances consisting of apholate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, bisazir (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, busulfan (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, diflubenzuron (250) + COMPOUND OF FORMULA I, dimatif (alternative name) [CCN] +

COMPOUND OF FORMULA I, hemel [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, hempa [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, metepa [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, methiotepa [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, methyl apholate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, morzid [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, penfluron (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, tepa [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, thiohempa (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, thiotepa (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, tretamine (alternative name) [CCN] and uredepa (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I,

an insect pheromone selected from the group of substances consisting of (*E*)-dec-5-en-1-yl acetate with (*E*)-dec-5-en-1-ol (IUPAC name) (222) + COMPOUND OF FORMULA I, (*E*)-tridec-4-en-1-yl acetate (IUPAC name) (829) + COMPOUND OF FORMULA I, (*E*)-6-methylhept-2-en-4-ol (IUPAC name) (541) + COMPOUND OF FORMULA I, (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-yl acetate (IUPAC name) (779) + COMPOUND OF FORMULA I, (*Z*)-dodec-7-en-1-yl acetate (IUPAC name) (285) + COMPOUND OF FORMULA I, (*Z*)-hexadec-11-enal (IUPAC name) (436) + COMPOUND OF FORMULA I, (*Z*)-hexadec-11-en-1-yl acetate (IUPAC name) (437) + COMPOUND OF FORMULA I, (*Z*)-hexadec-13-en-11-yn-1-yl acetate (IUPAC name) (438) + COMPOUND OF FORMULA I, (*Z*)-icos-13-en-10-one (IUPAC name) (448) + COMPOUND OF FORMULA I, (Z)-tetradec-7-en-1-al (IUPAC name) (782) + COMPOUND OF FORMULA I, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (IUPAC name) (783) + COMPOUND OF FORMULA I, (Z)-tetradec-9-en-1-yl acetate (IUPAC name) (784) + COMPOUND OF FORMULA I, (7*E*,9*Z*)-dodeca-7,9-dien-1-yl acetate (IUPAC name) (283) + COMPOUND OF FORMULA I, (9*Z*,11*E*)-tetradeca-9,11-dien-1-yl acetate (IUPAC name) (780) + COMPOUND OF FORMULA I, (9*Z*,12*E*)-tetradeca-9,12-dien-1-yl acetate (IUPAC name) (781) + COMPOUND OF FORMULA I, 14-methyloctadec-1-ene (IUPAC name) (545) + COMPOUND OF FORMULA I, 4-methylnonan-5-ol with 4-methylnonan-5-one (IUPAC name) (544) + COMPOUND OF FORMULA I, alpha-multistriatin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, brevicomin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, codlelure (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, codlemone (alternative name) (167) + COMPOUND OF FORMULA I, cuelure (alternative name) (179) + COMPOUND OF FORMULA I, disparlure (277) + COMPOUND OF FORMULA I, dodec-8-en-1-yl acetate (IUPAC name) (286) + COMPOUND OF FORMULA I, dodec-9-en-1-yl acetate (IUPAC name) (287) + COMPOUND OF FORMULA I, dodeca-8 + COMPOUND OF FORMULA I, 10-dien-1-yl acetate (IUPAC name) (284) + COMPOUND OF FORMULA I, dominicalure (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ethyl 4-

methyloctanoate (IUPAC name) (317) + COMPOUND OF FORMULA I, eugenol (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, frontalin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, gossyplure (alternative name) (420) + COMPOUND OF FORMULA I, grandlure (421) + COMPOUND OF FORMULA I, grandlure I (alternative name) (421) + COMPOUND OF FORMULA I, grandlure II (alternative name) (421) + COMPOUND OF FORMULA I, grandlure III (alternative name) (421) + COMPOUND OF FORMULA I, grandlure IV (alternative name) (421) + COMPOUND OF FORMULA I, hexalure [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ipsdienol (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ipsenol (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, japonilure (alternative name) (481) + COMPOUND OF FORMULA I, lineatin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, litlure (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, looplure (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, medlure [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, megatomoic acid (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, methyl eugenol (alternative name) (540) + COMPOUND OF FORMULA I, muscalure (563) + COMPOUND OF FORMULA I, octadeca-2,13-dien-1-yl acetate (IUPAC name) (588) + COMPOUND OF FORMULA I, octadeca-3,13-dien-1-yl acetate (IUPAC name) (589) + COMPOUND OF FORMULA I, orfralure (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, oryctalure (alternative name) (317) + COMPOUND OF FORMULA I, ostramone (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, siglure [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sordidin (alternative name) (736) + COMPOUND OF FORMULA I, sulcatol (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, tetradec-11-en-1-yl acetate (IUPAC name) (785) + COMPOUND OF FORMULA I, trimedlure (839) + COMPOUND OF FORMULA I, trimedlure A (alternative name) (839) + COMPOUND OF FORMULA I, trimedlure B_1 (alternative name) (839) + COMPOUND OF FORMULA I, trimedlure B_2 (alternative name) (839) + COMPOUND OF FORMULA I, trimedlure C (alternative name) (839) and trunc-call (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I,

an insect repellent selected from the group of substances consisting of 2-(octylthio)-ethanol (IUPAC name) (591) + COMPOUND OF FORMULA I, butopyronoxyl (933) + COMPOUND OF FORMULA I, butoxy(polypropylene glycol) (936) + COMPOUND OF FORMULA I, dibutyl adipate (IUPAC name) (1046) + COMPOUND OF FORMULA I, dibutyl phthalate (1047) + COMPOUND OF FORMULA I, dibutyl succinate (IUPAC name) (1048) + COMPOUND OF FORMULA I, diethyltoluamide [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dimethyl carbate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dimethyl

phthalate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ethyl hexanediol (1137) + COMPOUND OF FORMULA I, hexamide [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, methoquin-butyl (1276) + COMPOUND OF FORMULA I, methylneodecanamide [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, oxamate [CCN] and picaridin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I,

an insecticide selected from the group of substances consisting of 1-dichloro-1-nitroethane (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1058) + COMPOUND OF FORMULA I, 1,1-dichloro-2,2-bis(4-ethylphenyl)ethane (IUPAC name) (1056), + COMPOUND OF FORMULA I, 1,2-dichloropropane (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1062) + COMPOUND OF FORMULA I, 1,2-dichloropropane with 1,3-dichloropropene (IUPAC name) (1063) + COMPOUND OF FORMULA I, 1-bromo-2-chloroethane (IUPAC/Chemical Abstracts name) (916) + COMPOUND OF FORMULA I, 2,2,2-trichloro-1-(3,4-dichlorophenyl)ethyl acetate (IUPAC name) (1451) + COMPOUND OF FORMULA I, 2,2-dichlorovinyl 2-ethylsulfinylethyl methyl phosphate (IUPAC name) (1066) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-(1,3-dithiolan-2-yl)phenyl dimethylcarbamate (IUPAC/ Chemical Abstracts name) (1109) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-(2-butoxyethoxy)ethyl thiocyanate (IUPAC/Chemical Abstracts name) (935) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-(4,5-dimethyl-1,3-dioxolan-2-yl)phenyl methylcarbamate (IUPAC/ Chemical Abstracts name) (1084) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-(4-chloro-3,5-xylyloxy)ethanol (IUPAC name) (986) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-chlorovinyl diethyl phosphate (IUPAC name) (984) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-imidazolidone (IUPAC name) (1225) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-isovalerylindan-1,3-dione (IUPAC name) (1246) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-methyl(prop-2-ynyl)aminophenyl methylcarbamate (IUPAC name) (1284) + COMPOUND OF FORMULA I, 2-thiocyanatoethyl laurate (IUPAC name) (1433) + COMPOUND OF FORMULA I, 3-bromo-1-chloroprop-1-ene (IUPAC name) (917) + COMPOUND OF FORMULA I, 3-methyl-1-phenylpyrazol-5-yl dimethylcarbamate (IUPAC name) (1283) + COMPOUND OF FORMULA I, 4-methyl(prop-2-ynyl)amino-3,5-xylyl methylcarbamate (IUPAC name) (1285) + COMPOUND OF FORMULA I, 5,5-dimethyl-3-oxocyclohex-1-enyl dimethylcarbamate (IUPAC name) (1085) + COMPOUND OF FORMULA I, abamectin (1) + COMPOUND OF FORMULA I, acephate (2) + COMPOUND OF FORMULA I, acetamiprid (4) + COMPOUND OF FORMULA I, acethion (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, acetoprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, acrinathrin (9) + COMPOUND OF FORMULA I, acrylonitrile (IUPAC name) (861) + COMPOUND OF FORMULA I, alanycarb (15) + COMPOUND OF FORMULA I, aldicarb (16) + COMPOUND OF FORMULA I, aldoxycarb (863) + COMPOUND OF FORMULA I, aldrin (864) +

COMPOUND OF FORMULA I, allethrin (17) + COMPOUND OF FORMULA I, allosamidin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, allyxycarb (866) + COMPOUND OF FORMULA I, alpha-cypermethrin (202) + COMPOUND OF FORMULA I, alpha-ecdysone (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, alpha-endosulfan [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, aluminium phosphide (640) + COMPOUND OF FORMULA I, amidithion (870) + COMPOUND OF FORMULA I, amidothioate (872) + COMPOUND OF FORMULA I, aminocarb (873) + COMPOUND OF FORMULA I, amiton (875) + COMPOUND OF FORMULA I, amiton hydrogen oxalate (875) + COMPOUND OF FORMULA I, amitraz (24) + COMPOUND OF FORMULA I, anabasine (877) + COMPOUND OF FORMULA I, athidathion (883) + COMPOUND OF FORMULA I, AVI 382 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, AZ 60541 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, azadirachtin (alternative name) (41) + COMPOUND OF FORMULA I, azamethiphos (42) + COMPOUND OF FORMULA I, azinphos-ethyl (44) + COMPOUND OF FORMULA I, azinphos-methyl (45) + COMPOUND OF FORMULA I, azothoate (889) + COMPOUND OF FORMULA I, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxins (alternative name) (52) + COMPOUND OF FORMULA I, barium hexafluorosilicate (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, barium polysulfide (IUPAC/Chemical Abstracts name) (892) + COMPOUND OF FORMULA I, barthrin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, Bayer 22/190 (development code) (893) + COMPOUND OF FORMULA I, Bayer 22408 (development code) (894) + COMPOUND OF FORMULA I, bendiocarb (58) + COMPOUND OF FORMULA I, benfuracarb (60) + COMPOUND OF FORMULA I, bensultap (66) + COMPOUND OF FORMULA I, beta-cyfluthrin (194) + COMPOUND OF FORMULA I, beta-cypermethrin (203) + COMPOUND OF FORMULA I, bifenthrin (76) + COMPOUND OF FORMULA I, bioallethrin (78) + COMPOUND OF FORMULA I, bioallethrin *S*-cyclopentenyl isomer (alternative name) (79) + COMPOUND OF FORMULA I, bioethanomethrin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, biopermethrin (908) + COMPOUND OF FORMULA I, bioresmethrin (80) + COMPOUND OF FORMULA I, bis(2-chloroethyl) ether (IUPAC name) (909) + COMPOUND OF FORMULA I, bistrifluron (83) + COMPOUND OF FORMULA I, borax (86) + COMPOUND OF FORMULA I, brofenvalerate (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, bromfenvinfos (914) + COMPOUND OF FORMULA I, bromocyclen (918) + COMPOUND OF FORMULA I, bromo-DDT (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, bromophos (920) + COMPOUND OF FORMULA I, bromophos-ethyl (921) + COMPOUND OF FORMULA I, bufencarb (924) + COMPOUND OF FORMULA I, buprofezin (99) + COMPOUND OF FORMULA I, butacarb (926) +

COMPOUND OF FORMULA I, butathiofos (927) + COMPOUND OF FORMULA I, butocarboxim (103) + COMPOUND OF FORMULA I, butonate (932) + COMPOUND OF FORMULA I, butoxycarboxim (104) + COMPOUND OF FORMULA I, butylpyridaben (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, cadusafos (109) + COMPOUND OF FORMULA I, calcium arsenate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, calcium cyanide (444) + COMPOUND OF FORMULA I, calcium polysulfide (IUPAC name) (111) + COMPOUND OF FORMULA I, camphechlor (941) + COMPOUND OF FORMULA I, carbanolate (943) + COMPOUND OF FORMULA I, carbaryl (115) + COMPOUND OF FORMULA I, carbofuran (118) + COMPOUND OF FORMULA I, carbon disulfide (IUPAC/Chemical Abstracts name) (945) + COMPOUND OF FORMULA I, carbon tetrachloride (IUPAC name) (946) + COMPOUND OF FORMULA I, carbophenothion (947) + COMPOUND OF FORMULA I, carbosulfan (119) + COMPOUND OF FORMULA I, cartap (123) + COMPOUND OF FORMULA I, cartap hydrochloride (123) + COMPOUND OF FORMULA I, cevadine (alternative name) (725) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorantraniliprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, chlorbicyclen (960) + COMPOUND OF FORMULA I, chlordane (128) + COMPOUND OF FORMULA I, chlordecone (963) + COMPOUND OF FORMULA I, chlordimeform (964) + COMPOUND OF FORMULA I, chlordimeform hydrochloride (964) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorethoxyfos (129) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfenapyr (130) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfenvinphos (131) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorfluazuron (132) + COMPOUND OF FORMULA I, chlormephos (136) + COMPOUND OF FORMULA I, chloroform [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, chloropicrin (141) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorphoxim (989) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorprazophos (990) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorpyrifos (145) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorpyrifos-methyl (146) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorthiophos (994) + COMPOUND OF FORMULA I, chromafenozide (150) + COMPOUND OF FORMULA I, cinerin I (696) + COMPOUND OF FORMULA I, cinerin II (696) + COMPOUND OF FORMULA I, cinerins (696) + COMPOUND OF FORMULA I, cis-resmethrin (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, cismethrin (80) + COMPOUND OF FORMULA I, clocythrin (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, cloethocarb (999) + COMPOUND OF FORMULA I, closantel (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, clothianidin (165) + COMPOUND OF FORMULA I, copper acetoarsenite [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, copper arsenate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, copper oleate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, coumaphos (174) + COMPOUND OF FORMULA I, coumithoate (1006) + COMPOUND OF FORMULA I,

crotamiton (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, crotoxyphos (1010) + COMPOUND OF FORMULA I, crufomate (1011) + COMPOUND OF FORMULA I, cryolite (alternative name) (177) + COMPOUND OF FORMULA I, CS 708 (development code) (1012) + COMPOUND OF FORMULA I, cyanofenphos (1019) + COMPOUND OF FORMULA I, cyanophos (184) + COMPOUND OF FORMULA I, cyanthoate (1020) + COMPOUND OF FORMULA I, cyantraniliprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, cyclethrin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, cycloprothrin (188) + COMPOUND OF FORMULA I, cyfluthrin (193) + COMPOUND OF FORMULA I, cyhalothrin (196) + COMPOUND OF FORMULA I, cypermethrin (201) + COMPOUND OF FORMULA I, cyphenothrin (206) + COMPOUND OF FORMULA I, cyromazine (209) + COMPOUND OF FORMULA I, cythioate (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, *d*-limonene (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, *d*-tetramethrin (alternative name) (788) + COMPOUND OF FORMULA I, DAEP (1031) + COMPOUND OF FORMULA I, dazomet (216) + COMPOUND OF FORMULA I, DDT (219) + COMPOUND OF FORMULA I, decarbofuran (1034) + COMPOUND OF FORMULA I, deltamethrin (223) + COMPOUND OF FORMULA I, demephion (1037) + COMPOUND OF FORMULA I, demephion-O (1037) + COMPOUND OF FORMULA I, demephion-S (1037) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton (1038) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-methyl (224) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-O (1038) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-O-methyl (224) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-S (1038) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-S-methyl (224) + COMPOUND OF FORMULA I, demeton-S-methylsulphon (1039) + COMPOUND OF FORMULA I, diafenthiuron (226) + COMPOUND OF FORMULA I, dialifos (1042) + COMPOUND OF FORMULA I, diamidafos (1044) + COMPOUND OF FORMULA I, diazinon (227) + COMPOUND OF FORMULA I, dicapthon (1050) + COMPOUND OF FORMULA I, dichlofenthion (1051) + COMPOUND OF FORMULA I, dichlorvos (236) + COMPOUND OF FORMULA I, dicliphos (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, dicresyl (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dicrotophos (243) + COMPOUND OF FORMULA I, dicyclanil (244) + COMPOUND OF FORMULA I, dieldrin (1070) + COMPOUND OF FORMULA I, diethyl 5-methylpyrazol-3-yl phosphate (IUPAC name) (1076) + COMPOUND OF FORMULA I, diflubenzuron (250) + COMPOUND OF FORMULA I, dilor (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dimefluthrin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, dimefox (1081) + COMPOUND OF FORMULA I, dimetan (1085) + COMPOUND OF FORMULA I, dimethoate (262) + COMPOUND OF FORMULA I, dimethrin (1083) + COMPOUND OF FORMULA I, dimethylvinphos (265) +

COMPOUND OF FORMULA I, dimetilan (1086) + COMPOUND OF FORMULA I, dinex (1089) + COMPOUND OF FORMULA I, dinex-diclexine (1089) + COMPOUND OF FORMULA I, dinoprop (1093) + COMPOUND OF FORMULA I, dinosam (1094) + COMPOUND OF FORMULA I, dinoseb (1095) + COMPOUND OF FORMULA I, dinotefuran (271) + COMPOUND OF FORMULA I, diofenolan (1099) + COMPOUND OF FORMULA I, dioxabenzofos (1100) + COMPOUND OF FORMULA I, dioxacarb (1101) + COMPOUND OF FORMULA I, dioxathion (1102) + COMPOUND OF FORMULA I, disulfoton (278) + COMPOUND OF FORMULA I, dithicrofos (1108) + COMPOUND OF FORMULA I, DNOC (282) + COMPOUND OF FORMULA I, doramectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, DSP (1115) + COMPOUND OF FORMULA I, ecdysterone (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, EI 1642 (development code) (1118) + COMPOUND OF FORMULA I, emamectin (291) + COMPOUND OF FORMULA I, emamectin benzoate (291) + COMPOUND OF FORMULA I, EMPC (1120) + COMPOUND OF FORMULA I, empenthrin (292) + COMPOUND OF FORMULA I, endosulfan (294) + COMPOUND OF FORMULA I, endothion (1121) + COMPOUND OF FORMULA I, endrin (1122) + COMPOUND OF FORMULA I, EPBP (1123) + COMPOUND OF FORMULA I, EPN (297) + COMPOUND OF FORMULA I, epofenonane (1124) + COMPOUND OF FORMULA I, eprinomectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, esfenvalerate (302) + COMPOUND OF FORMULA I, etaphos (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ethiofencarb (308) + COMPOUND OF FORMULA I, ethion (309) + COMPOUND OF FORMULA I, ethiprole (310) + COMPOUND OF FORMULA I, ethoate-methyl (1134) + COMPOUND OF FORMULA I, ethoprophos (312) + COMPOUND OF FORMULA I, ethyl formate (IUPAC name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ethyl-DDD (alternative name) (1056) + COMPOUND OF FORMULA I, ethylene dibromide (316) + COMPOUND OF FORMULA I, ethylene dichloride (chemical name) (1136) + COMPOUND OF FORMULA I, ethylene oxide [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, etofenprox (319) + COMPOUND OF FORMULA I, etrimfos (1142) + COMPOUND OF FORMULA I, EXD (1143) + COMPOUND OF FORMULA I, famphur (323) + COMPOUND OF FORMULA I, fenamiphos (326) + COMPOUND OF FORMULA I, fenazaflor (1147) + COMPOUND OF FORMULA I, fenchlorphos (1148) + COMPOUND OF FORMULA I, fenethacarb (1149) + COMPOUND OF FORMULA I, fenfluthrin (1150) + COMPOUND OF FORMULA I, fenitrothion (335) + COMPOUND OF FORMULA I, fenobucarb (336) + COMPOUND OF FORMULA I, fenoxacrim (1153) + COMPOUND OF FORMULA I, fenoxycarb (340) + COMPOUND OF FORMULA I, fenpirithrin (1155) + COMPOUND OF FORMULA I,

fenpropathrin (342) + COMPOUND OF FORMULA I, fenpyrad (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, fensulfothion (1158) + COMPOUND OF FORMULA I, fenthion (346) + COMPOUND OF FORMULA I, fenthion-ethyl [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, fenvalerate (349) + COMPOUND OF FORMULA I, fipronil (354) + COMPOUND OF FORMULA I, flonicamid (358) + COMPOUND OF FORMULA I, flubendiamide (CAS. Reg. No.: 272451-65-7) + COMPOUND OF FORMULA I, flucofuron (1168) + COMPOUND OF FORMULA I, flucycloxuron (366) + COMPOUND OF FORMULA I, flucythrinate (367) + COMPOUND OF FORMULA I, fluenetil (1169) + COMPOUND OF FORMULA I, flufenerim [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, flufenoxuron (370) + COMPOUND OF FORMULA I, flufenprox (1171) + COMPOUND OF FORMULA I, flumethrin (372) + COMPOUND OF FORMULA I, fluvalinate (1184) + COMPOUND OF FORMULA I, FMC 1137 (development code) (1185) + COMPOUND OF FORMULA I, fonofos (1191) + COMPOUND OF FORMULA I, formetanate (405) + COMPOUND OF FORMULA I, formetanate hydrochloride (405) + COMPOUND OF FORMULA I, formothion (1192) + COMPOUND OF FORMULA I, formparanate (1193) + COMPOUND OF FORMULA I, fosmethilan (1194) + COMPOUND OF FORMULA I, fospirate (1195) + COMPOUND OF FORMULA I, fosthiazate (408) + COMPOUND OF FORMULA I, fosthietan (1196) + COMPOUND OF FORMULA I, furathiocarb (412) + COMPOUND OF FORMULA I, furethrin (1200) + COMPOUND OF FORMULA I, gamma-cyhalothrin (197) + COMPOUND OF FORMULA I, gamma-HCH (430) + COMPOUND OF FORMULA I, guazatine (422) + COMPOUND OF FORMULA I, guazatine acetates (422) + COMPOUND OF FORMULA I, GY-81 (development code) (423) + COMPOUND OF FORMULA I, halfenprox (424) + COMPOUND OF FORMULA I, halofenozide (425) + COMPOUND OF FORMULA I, HCH (430) + COMPOUND OF FORMULA I, HEOD (1070) + COMPOUND OF FORMULA I, heptachlor (1211) + COMPOUND OF FORMULA I, heptenophos (432) + COMPOUND OF FORMULA I, heterophos [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, hexaflumuron (439) + COMPOUND OF FORMULA I, HHDN (864) + COMPOUND OF FORMULA I, hydramethylnon (443) + COMPOUND OF FORMULA I, hydrogen cyanide (444) + COMPOUND OF FORMULA I, hydroprene (445) + COMPOUND OF FORMULA I, hyquincarb (1223) + COMPOUND OF FORMULA I, imidacloprid (458) + COMPOUND OF FORMULA I, imiprothrin (460) + COMPOUND OF FORMULA I, indoxacarb (465) + COMPOUND OF FORMULA I, iodomethane (IUPAC name) (542) + COMPOUND OF FORMULA I, IPSP (1229) + COMPOUND OF FORMULA I, isazofos (1231) + COMPOUND OF FORMULA I, isobenzan (1232) + COMPOUND OF FORMULA I, isocarbophos (alternative name) (473) + COMPOUND OF FORMULA I,

isodrin (1235) + COMPOUND OF FORMULA I, isofenphos (1236) + COMPOUND OF FORMULA I, isolane (1237) + COMPOUND OF FORMULA I, isoprocarb (472) + COMPOUND OF FORMULA I, isopropyl O-(methoxyaminothiophosphoryl)salicylate (IUPAC name) (473) + COMPOUND OF FORMULA I, isoprothiolane (474) + COMPOUND OF FORMULA I, isothioate (1244) + COMPOUND OF FORMULA I, isoxathion (480) + COMPOUND OF FORMULA I, ivermectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, jasmolin I (696) + COMPOUND OF FORMULA I, jasmolin II (696) + COMPOUND OF FORMULA I, jodfenphos (1248) + COMPOUND OF FORMULA I, juvenile hormone I (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, juvenile hormone II (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, juvenile hormone III (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, kelevan (1249) + COMPOUND OF FORMULA I, kinoprene (484) + COMPOUND OF FORMULA I, lambda-cyhalothrin (198) + COMPOUND OF FORMULA I, lead arsenate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, lepimectin (CCN) + COMPOUND OF FORMULA I, leptophos (1250) + COMPOUND OF FORMULA I, lindane (430) + COMPOUND OF FORMULA I, lirimfos (1251) + COMPOUND OF FORMULA I, lufenuron (490) + COMPOUND OF FORMULA I, lythidathion (1253) + COMPOUND OF FORMULA I, *m*-cumenyl methylcarbamate (IUPAC name) (1014) + COMPOUND OF FORMULA I, magnesium phosphide (IUPAC name) (640) + COMPOUND OF FORMULA I, malathion (492) + COMPOUND OF FORMULA I, malonoben (1254) + COMPOUND OF FORMULA I, mazidox (1255) + COMPOUND OF FORMULA I, mecarbam (502) + COMPOUND OF FORMULA I, mecarphon (1258) + COMPOUND OF FORMULA I, menazon (1260) + COMPOUND OF FORMULA I, mephosfolan (1261) + COMPOUND OF FORMULA I, mercurous chloride (513) + COMPOUND OF FORMULA I, mesulfenfos (1263) + COMPOUND OF FORMULA I, metaflumizone (CCN) + COMPOUND OF FORMULA I, metam (519) + COMPOUND OF FORMULA I, metam-potassium (alternative name) (519) + COMPOUND OF FORMULA I, metam-sodium (519) + COMPOUND OF FORMULA I, methacrifos (1266) + COMPOUND OF FORMULA I, methamidophos (527) + COMPOUND OF FORMULA I, methanesulfonyl fluoride (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1268) + COMPOUND OF FORMULA I, methidathion (529) + COMPOUND OF FORMULA I, methiocarb (530) + COMPOUND OF FORMULA I, methocrotophos (1273) + COMPOUND OF FORMULA I, methomyl (531) + COMPOUND OF FORMULA I, methoprene (532) + COMPOUND OF FORMULA I, methoquin-butyl (1276) + COMPOUND OF FORMULA I, methothrin (alternative name) (533) + COMPOUND OF FORMULA I, methoxychlor (534) + COMPOUND OF FORMULA I, methoxyfenozide

(535) + COMPOUND OF FORMULA I, methyl bromide (537) + COMPOUND OF FORMULA I, methyl isothiocyanate (543) + COMPOUND OF FORMULA I, methylchloroform (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, methylene chloride [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, metofluthrin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, metolcarb (550) + COMPOUND OF FORMULA I, metoxadiazone (1288) + COMPOUND OF FORMULA I, mevinphos (556) + COMPOUND OF FORMULA I, mexacarbate (1290) + COMPOUND OF FORMULA I, milbemectin (557) + COMPOUND OF FORMULA I, milbemycin oxime (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, mipafox (1293) + COMPOUND OF FORMULA I, mirex (1294) + COMPOUND OF FORMULA I, monocrotophos (561) + COMPOUND OF FORMULA I, morphothion (1300) + COMPOUND OF FORMULA I, moxidectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, naftalofos (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, naled (567) + COMPOUND OF FORMULA I, naphthalene (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1303) + COMPOUND OF FORMULA I, NC-170 (development code) (1306) + COMPOUND OF FORMULA I, NC-184 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, nicotine (578) + COMPOUND OF FORMULA I, nicotine sulfate (578) + COMPOUND OF FORMULA I, nifluridide (1309) + COMPOUND OF FORMULA I, nitenpyram (579) + COMPOUND OF FORMULA I, nithiazine (1311) + COMPOUND OF FORMULA I, nitrilacarb (1313) + COMPOUND OF FORMULA I, nitrilacarb 1:1 zinc chloride complex (1313) + COMPOUND OF FORMULA I, NNI-0101 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, NNI-0250 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, nornicotine (traditional name) (1319) + COMPOUND OF FORMULA I, novaluron (585) + COMPOUND OF FORMULA I, noviflumuron (586) + COMPOUND OF FORMULA I, *O*-5-dichloro-4-iodophenyl *O*-ethyl ethylphosphonothioate (IUPAC name) (1057) + COMPOUND OF FORMULA I, *O,O*-diethyl *O*-4-methyl-2-oxo-2*H*-chromen-7-yl phosphorothioate (IUPAC name) (1074) + COMPOUND OF FORMULA I, *O,O*-diethyl *O*-6-methyl-2-propylpyrimidin-4-yl phosphorothioate (IUPAC name) (1075) + COMPOUND OF FORMULA I, *O,O,O',O'*-tetrapropyl dithiopyrophosphate (IUPAC name) (1424) + COMPOUND OF FORMULA I, oleic acid (IUPAC name) (593) + COMPOUND OF FORMULA I, omethoate (594) + COMPOUND OF FORMULA I, oxamyl (602) + COMPOUND OF FORMULA I, oxydemeton-methyl (609) + COMPOUND OF FORMULA I, oxydeprofos (1324) + COMPOUND OF FORMULA I, oxydisulfoton (1325) + COMPOUND OF FORMULA I, pp'-DDT (219) + COMPOUND OF FORMULA I, para-dichlorobenzene [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, parathion (615) + COMPOUND OF FORMULA I, parathion-methyl (616) + COMPOUND OF FORMULA I, penfluron (alternative name)

[CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, pentachlorophenol (623) + COMPOUND OF FORMULA I, pentachlorophenyl laurate (IUPAC name) (623) + COMPOUND OF FORMULA I, permethrin (626) + COMPOUND OF FORMULA I, petroleum oils (alternative name) (628) + COMPOUND OF FORMULA I, PH 60-38 (development code) (1328) + COMPOUND OF FORMULA I, phenkapton (1330) + COMPOUND OF FORMULA I, phenothrin (630) + COMPOUND OF FORMULA I, phenthoate (631) + COMPOUND OF FORMULA I, phorate (636) + COMPOUND OF FORMULA I, phosalone (637) + COMPOUND OF FORMULA I, phosfolan (1338) + COMPOUND OF FORMULA I, phosmet (638) + COMPOUND OF FORMULA I, phosnichlor (1339) + COMPOUND OF FORMULA I, phosphamidon (639) + COMPOUND OF FORMULA I, phosphine (IUPAC name) (640) + COMPOUND OF FORMULA I, phoxim (642) + COMPOUND OF FORMULA I, phoxim-methyl (1340) + COMPOUND OF FORMULA I, pirimetaphos (1344) + COMPOUND OF FORMULA I, pirimicarb (651) + COMPOUND OF FORMULA I, pirimiphos-ethyl (1345) + COMPOUND OF FORMULA I, pirimiphos-methyl (652) + COMPOUND OF FORMULA I, polychlorodicyclopentadiene isomers (IUPAC name) (1346) + COMPOUND OF FORMULA I, polychloroterpenes (traditional name) (1347) + COMPOUND OF FORMULA I, potassium arsenite [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, potassium thiocyanate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, prallethrin (655) + COMPOUND OF FORMULA I, precocene I (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, precocene II (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, precocene III (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, primidophos (1349) + COMPOUND OF FORMULA I, profenofos (662) + COMPOUND OF FORMULA I, profluthrin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, promacyl (1354) + COMPOUND OF FORMULA I, promecarb (1355) + COMPOUND OF FORMULA I, propaphos (1356) + COMPOUND OF FORMULA I, propetamphos (673) + COMPOUND OF FORMULA I, propoxur (678) + COMPOUND OF FORMULA I, prothidathion (1360) + COMPOUND OF FORMULA I, prothiofos (686) + COMPOUND OF FORMULA I, prothoate (1362) + COMPOUND OF FORMULA I, protrifenbute [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, pymetrozine (688) + COMPOUND OF FORMULA I, pyraclofos (689) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrafluprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, pyrazophos (693) + COMPOUND OF FORMULA I, pyresmethrin (1367) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrethrin I (696) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrethrin II (696) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrethrins (696) + COMPOUND OF FORMULA I, pyridaben (699) + COMPOUND OF FORMULA I, pyridalyl (700) + COMPOUND OF FORMULA I, pyridaphenthion (701) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrifluquinazon

[CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, pyrimidifen (706) + COMPOUND OF FORMULA I, pyrimitate (1370) + COMPOUND OF FORMULA I, pyriprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, pyriproxyfen (708) + COMPOUND OF FORMULA I, quassia (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, quinalphos (711) + COMPOUND OF FORMULA I, quinalphos-methyl (1376) + COMPOUND OF FORMULA I, quinothion (1380) + COMPOUND OF FORMULA I, quintiofos (1381) + COMPOUND OF FORMULA I, R-1492 (development code) (1382) + COMPOUND OF FORMULA I, rafoxanide (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, resmethrin (719) + COMPOUND OF FORMULA I, rotenone (722) + COMPOUND OF FORMULA I, RU 15525 (development code) (723) + COMPOUND OF FORMULA I, RU 25475 (development code) (1386) + COMPOUND OF FORMULA I, ryania (alternative name) (1387) + COMPOUND OF FORMULA I, ryanodine (traditional name) (1387) + COMPOUND OF FORMULA I, sabadilla (alternative name) (725) + COMPOUND OF FORMULA I, schradan (1389) + COMPOUND OF FORMULA I, sebufos (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, selamectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, SI-0009 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, SI-0205 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, SI-0404 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, SI-0405 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, silafluofen (728) + COMPOUND OF FORMULA I, SN 72129 (development code) (1397) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium arsenite [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sodium cyanide (444) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium fluoride (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1399) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium hexafluorosilicate (1400) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium pentachlorophenoxide (623) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium selenate (IUPAC name) (1401) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium thiocyanate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sophamide (1402) + COMPOUND OF FORMULA I, spinetoram [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, spinosad (737) + COMPOUND OF FORMULA I, spiromesifen (739) + COMPOUND OF FORMULA I, spirotetramat [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sulcofuron (746) + COMPOUND OF FORMULA I, sulcofuron-sodium (746) + COMPOUND OF FORMULA I, sulfluramid (750) + COMPOUND OF FORMULA I, sulfotep (753) + COMPOUND OF FORMULA I, sulfoxaflor [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sulfuryl fluoride (756) + COMPOUND OF FORMULA I, sulprofos (1408) + COMPOUND OF FORMULA I, tar oils (alternative name) (758) + COMPOUND OF FORMULA I, tau-fluvalinate (398) + COMPOUND OF FORMULA I, tazimcarb (1412) + COMPOUND OF FORMULA I, TDE (1414) + COMPOUND OF FORMULA I,

tebufenozide (762) + COMPOUND OF FORMULA I, tebufenpyrad (763) + COMPOUND OF FORMULA I, tebupirimfos (764) + COMPOUND OF FORMULA I, teflubenzuron (768) + COMPOUND OF FORMULA I, tefluthrin (769) + COMPOUND OF FORMULA I, temephos (770) + COMPOUND OF FORMULA I, TEPP (1417) + COMPOUND OF FORMULA I, terallethrin (1418) + COMPOUND OF FORMULA I, terbam (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, terbufos (773) + COMPOUND OF FORMULA I, tetrachloroethane [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, tetrachlorvinphos (777) + COMPOUND OF FORMULA I, tetramethrin (787) + COMPOUND OF FORMULA I, tetramethylfluthrin (CAS. Reg. No.: 84937-88-2) + COMPOUND OF FORMULA I, theta-cypermethrin (204) + COMPOUND OF FORMULA I, thiacloprid (791) + COMPOUND OF FORMULA I, thiafenox (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, thiamethoxam (792) + COMPOUND OF FORMULA I, thicrofos (1428) + COMPOUND OF FORMULA I, thiocarboxime (1431) + COMPOUND OF FORMULA I, thiocyclam (798) + COMPOUND OF FORMULA I, thiocyclam hydrogen oxalate (798) + COMPOUND OF FORMULA I, thiodicarb (799) + COMPOUND OF FORMULA I, thiofanox (800) + COMPOUND OF FORMULA I, thiometon (801) + COMPOUND OF FORMULA I, thionazin (1434) + COMPOUND OF FORMULA I, thiosultap (803) + COMPOUND OF FORMULA I, thiosultap-sodium (803) + COMPOUND OF FORMULA I, thuringiensin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, tolfenpyrad (809) + COMPOUND OF FORMULA I, tralomethrin (812) + COMPOUND OF FORMULA I, transfluthrin (813) + COMPOUND OF FORMULA I, transpermethrin (1440) + COMPOUND OF FORMULA I, triamiphos (1441) + COMPOUND OF FORMULA I, triazamate (818) + COMPOUND OF FORMULA I, triazophos (820) + COMPOUND OF FORMULA I, triazuron (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, trichlorfon (824) + COMPOUND OF FORMULA I, trichlormetaphos-3 (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, trichloronat (1452) + COMPOUND OF FORMULA I, trifenofos (1455) + COMPOUND OF FORMULA I, triflumuron (835) + COMPOUND OF FORMULA I, trimethacarb (840) + COMPOUND OF FORMULA I, triprene (1459) + COMPOUND OF FORMULA I, vamidothion (847) + COMPOUND OF FORMULA I, vaniliprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, veratridine (alternative name) (725) + COMPOUND OF FORMULA I, veratrine (alternative name) (725) + COMPOUND OF FORMULA I, XMC (853) + COMPOUND OF FORMULA I, xylylcarb (854) + COMPOUND OF FORMULA I, YI-5302 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, zeta-cypermethrin (205) + COMPOUND OF FORMULA I, zetamethrin (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, zinc phosphide (640) + COMPOUND OF FORMULA I,

zolaprofos (1469) and ZXI 8901 (development code) (858) + COMPOUND OF FORMULA I,

a molluscicide selected from the group of substances consisting of bis(tributyltin) oxide (IUPAC name) (913) + COMPOUND OF FORMULA I, bromoacetamide [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, calcium arsenate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, cloethocarb (999) + COMPOUND OF FORMULA I, copper acetoarsenite [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, copper sulfate (172) + COMPOUND OF FORMULA I, fentin (347) + COMPOUND OF FORMULA I, ferric phosphate (IUPAC name) (352) + COMPOUND OF FORMULA I, metaldehyde (518) + COMPOUND OF FORMULA I, methiocarb (530) + COMPOUND OF FORMULA I, niclosamide (576) + COMPOUND OF FORMULA I, niclosamide-olamine (576) + COMPOUND OF FORMULA I, pentachlorophenol (623) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium pentachlorophenoxide (623) + COMPOUND OF FORMULA I, tazimcarb (1412) + COMPOUND OF FORMULA I, thiodicarb (799) + COMPOUND OF FORMULA I, tralopyril [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, tributyltin oxide (913) + COMPOUND OF FORMULA I, trifenmorph (1454) + COMPOUND OF FORMULA I, trimethacarb (840) + COMPOUND OF FORMULA I, triphenyltin acetate (IUPAC name) (347) and triphenyltin hydroxide (IUPAC name) (347) + COMPOUND OF FORMULA I,

a nematicide selected from the group of substances consisting of AKD-3088 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, 1,2-dibromo-3-chloropropane (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1045) + COMPOUND OF FORMULA I, 1,2-dichloropropane (IUPAC/ Chemical Abstracts name) (1062) + COMPOUND OF FORMULA I, 1,2-dichloropropane with 1,3-dichloropropene (IUPAC name) (1063) + COMPOUND OF FORMULA I, 1,3-dichloropropene (233) + COMPOUND OF FORMULA I, 3,4-dichlorotetrahydrothiophene 1,1-dioxide (IUPAC/Chemical Abstracts name) (1065) + COMPOUND OF FORMULA I, 3-(4-chlorophenyl)-5-methylrhodanine (IUPAC name) (980) + COMPOUND OF FORMULA I, 5-methyl-6-thioxo-1,3,5-thiadiazinan-3-ylacetic acid (IUPAC name) (1286) + COMPOUND OF FORMULA I, 6-isopentenylaminopurine (alternative name) (210) + COMPOUND OF FORMULA I, abamectin (1) + COMPOUND OF FORMULA I, acetoprole [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, alanycarb (15) + COMPOUND OF FORMULA I, aldicarb (16) + COMPOUND OF FORMULA I, aldoxycarb (863) + COMPOUND OF FORMULA I, AZ 60541 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, benclothiaz [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, benomyl (62) + COMPOUND OF FORMULA I, butylpyridaben (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, cadusafos (109) + COMPOUND OF FORMULA I, carbofuran (118) +

COMPOUND OF FORMULA I, carbon disulfide (945) + COMPOUND OF FORMULA I, carbosulfan (119) + COMPOUND OF FORMULA I, chloropicrin (141) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorpyrifos (145) + COMPOUND OF FORMULA I, cloethocarb (999) + COMPOUND OF FORMULA I, cytokinins (alternative name) (210) + COMPOUND OF FORMULA I, dazomet (216) + COMPOUND OF FORMULA I, DBCP (1045) + COMPOUND OF FORMULA I, DCIP (218) + COMPOUND OF FORMULA I, diamidafos (1044) + COMPOUND OF FORMULA I, dichlofenthion (1051) + COMPOUND OF FORMULA I, dicliphos (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, dimethoate (262) + COMPOUND OF FORMULA I, doramectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, emamectin (291) + COMPOUND OF FORMULA I, emamectin benzoate (291) + COMPOUND OF FORMULA I, eprinomectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, ethoprophos (312) + COMPOUND OF FORMULA I, ethylene dibromide (316) + COMPOUND OF FORMULA I, fenamiphos (326) + COMPOUND OF FORMULA I, fenpyrad (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, fensulfothion (1158) + COMPOUND OF FORMULA I, fluensulfone (CAS. Reg. No.: 318290-98-1) + COMPOUND OF FORMULA I, fosthiazate (408) + COMPOUND OF FORMULA I, fosthietan (1196) + COMPOUND OF FORMULA I, furfural (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, GY-81 (development code) (423) + COMPOUND OF FORMULA I, heterophos [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, imicyafos [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, iodomethane (IUPAC name) (542) + COMPOUND OF FORMULA I, isamidofos (1230) + COMPOUND OF FORMULA I, isazofos (1231) + COMPOUND OF FORMULA I, ivermectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, kinetin (alternative name) (210) + COMPOUND OF FORMULA I, mecarphon (1258) + COMPOUND OF FORMULA I, metam (519) + COMPOUND OF FORMULA I, metam-potassium (alternative name) (519) + COMPOUND OF FORMULA I, metam-sodium (519) + COMPOUND OF FORMULA I, methyl bromide (537) + COMPOUND OF FORMULA I, methyl isothiocyanate (543) + COMPOUND OF FORMULA I, milbemycin oxime (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, moxidectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, *Myrothecium verrucaria* composition (alternative name) (565) + COMPOUND OF FORMULA I, NC-184 (compound code) + COMPOUND OF FORMULA I, oxamyl (602) + COMPOUND OF FORMULA I, phorate (636) + COMPOUND OF FORMULA I, phosphamidon (639) + COMPOUND OF FORMULA I, phosphocarb [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sebufos (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, selamectin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, spinosad (737) + COMPOUND OF

FORMULA I, terbam (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, terbufos (773) + COMPOUND OF FORMULA I, tetrachlorothiophene (IUPAC/ Chemical Abstracts name) (1422) + COMPOUND OF FORMULA I, thiafenox (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, thionazin (1434) + COMPOUND OF FORMULA I, triazophos (820) + COMPOUND OF FORMULA I, triazuron (alternative name) + COMPOUND OF FORMULA I, xylenols [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, YI-5302 (compound code) and zeatin (alternative name) (210) + COMPOUND OF FORMULA I,

a nitrification inhibitor selected from the group of substances consisting of potassium ethylxanthate [CCN] and nitrapyrin (580) + COMPOUND OF FORMULA I,

a plant activator selected from the group of substances consisting of acibenzolar (6) + COMPOUND OF FORMULA I, acibenzolar-*S*-methyl (6) + COMPOUND OF FORMULA I, probenazole (658) and *Reynoutria sachalinensis* extract (alternative name) (720) + COMPOUND OF FORMULA I,

a rodenticide selected from the group of substances consisting of 2-isovalerylindan-1,3-dione (IUPAC name) (1246) + COMPOUND OF FORMULA I, 4-(quinoxalin-2-ylamino)benzenesulfonamide (IUPAC name) (748) + COMPOUND OF FORMULA I, alpha-chlorohydrin [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, aluminium phosphide (640) + COMPOUND OF FORMULA I, antu (880) + COMPOUND OF FORMULA I, arsenous oxide (882) + COMPOUND OF FORMULA I, barium carbonate (891) + COMPOUND OF FORMULA I, bisthiosemi (912) + COMPOUND OF FORMULA I, brodifacoum (89) + COMPOUND OF FORMULA I, bromadiolone (91) + COMPOUND OF FORMULA I, bromethalin (92) + COMPOUND OF FORMULA I, calcium cyanide (444) + COMPOUND OF FORMULA I, chloralose (127) + COMPOUND OF FORMULA I, chlorophacinone (140) + COMPOUND OF FORMULA I, cholecalciferol (alternative name) (850) + COMPOUND OF FORMULA I, coumachlor (1004) + COMPOUND OF FORMULA I, coumafuryl (1005) + COMPOUND OF FORMULA I, coumatetralyl (175) + COMPOUND OF FORMULA I, crimidine (1009) + COMPOUND OF FORMULA I, difenacoum (246) + COMPOUND OF FORMULA I, difethialone (249) + COMPOUND OF FORMULA I, diphacinone (273) + COMPOUND OF FORMULA I, ergocalciferol (301) + COMPOUND OF FORMULA I, flocoumafen (357) + COMPOUND OF FORMULA I, fluoroacetamide (379) + COMPOUND OF FORMULA I, flupropadine (1183) + COMPOUND OF FORMULA I, flupropadine hydrochloride (1183) + COMPOUND OF FORMULA I, gamma-HCH (430) + COMPOUND OF FORMULA I, HCH (430) + COMPOUND OF FORMULA I, hydrogen cyanide (444) + COMPOUND OF FORMULA I, iodomethane (IUPAC name) (542) + COMPOUND OF FORMULA I, lindane (430) + COMPOUND OF FORMULA I,

magnesium phosphide (IUPAC name) (640) + COMPOUND OF FORMULA I, methyl bromide (537) + COMPOUND OF FORMULA I, norbormide (1318) + COMPOUND OF FORMULA I, phosacetim (1336) + COMPOUND OF FORMULA I, phosphine (IUPAC name) (640) + COMPOUND OF FORMULA I, phosphorus [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, pindone (1341) + COMPOUND OF FORMULA I, potassium arsenite [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, pyrinuron (1371) + COMPOUND OF FORMULA I, scilliroside (1390) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium arsenite [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, sodium cyanide (444) + COMPOUND OF FORMULA I, sodium fluoroacetate (735) + COMPOUND OF FORMULA I, strychnine (745) + COMPOUND OF FORMULA I, thallium sulfate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, warfarin (851) and zinc phosphide (640) + COMPOUND OF FORMULA I,

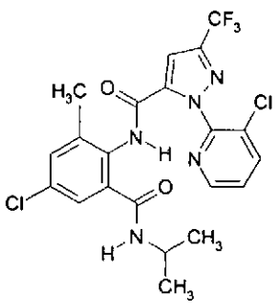
a synergist selected from the group of substances consisting of 2-(2-butoxyethoxy)-ethyl piperonylate (IUPAC name) (934) + COMPOUND OF FORMULA I, 5-(1,3-benzodioxol-5-yl)-3-hexylcyclohex-2-enone (IUPAC name) (903) + COMPOUND OF FORMULA I, farnesol with nerolidol (alternative name) (324) + COMPOUND OF FORMULA I, MB-599 (development code) (498) + COMPOUND OF FORMULA I, MGK 264 (development code) (296) + COMPOUND OF FORMULA I, piperonyl butoxide (649) + COMPOUND OF FORMULA I, piprotal (1343) + COMPOUND OF FORMULA I, propyl isomer (1358) + COMPOUND OF FORMULA I, S421 (development code) (724) + COMPOUND OF FORMULA I, sesamex (1393) + COMPOUND OF FORMULA I, sesasmolin (1394) and sulfoxide (1406) + COMPOUND OF FORMULA I,

an animal repellent selected from the group of substances consisting of anthraquinone (32) + COMPOUND OF FORMULA I, chloralose (127) + COMPOUND OF FORMULA I, copper naphthenate [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I, copper oxychloride (171) + COMPOUND OF FORMULA I, diazinon (227) + COMPOUND OF FORMULA I, dicyclopentadiene (chemical name) (1069) + COMPOUND OF FORMULA I, guazatine (422) + COMPOUND OF FORMULA I, guazatine acetates (422) + COMPOUND OF FORMULA I, methiocarb (530) + COMPOUND OF FORMULA I, pyridin-4-amine (IUPAC name) (23) + COMPOUND OF FORMULA I, thiram (804) + COMPOUND OF FORMULA I, trimethacarb (840) + COMPOUND OF FORMULA I, zinc naphthenate [CCN] and ziram (856) + COMPOUND OF FORMULA I,

a virucide selected from the group of substances consisting of imanin (alternative name) [CCN] and ribavirin (alternative name) [CCN] + COMPOUND OF FORMULA I,

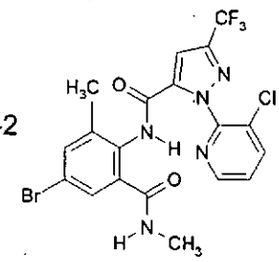
a wound protectant selected from the group of substances consisting of mercuric oxide (512) + COMPOUND OF FORMULA I, octhilinone (590) and thiophanate-methyl (802) + COMPOUND OF FORMULA I,

an insecticide selected from the group consisting of the compound of the formula A-1



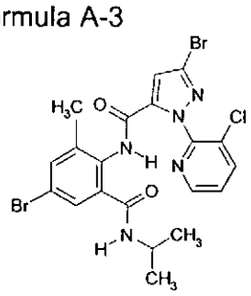
(A-1) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-2



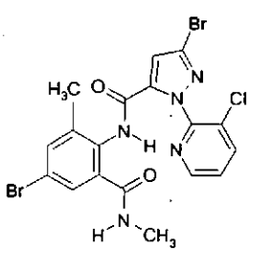
(A-2) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-3



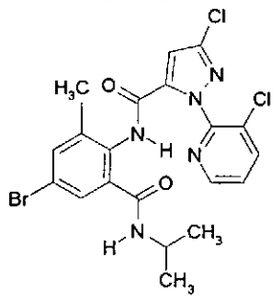
(A-3) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-4



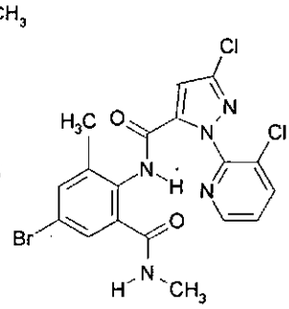
(A-4) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-5



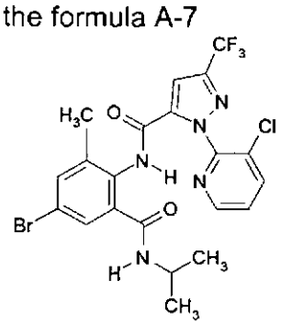
(A-5) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-6



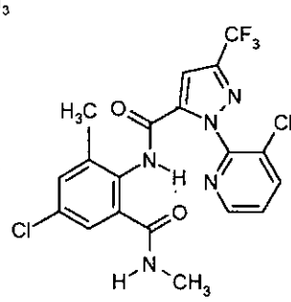
(A-6) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-7



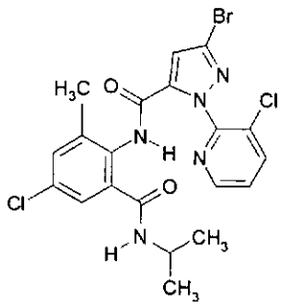
(A-7) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-8



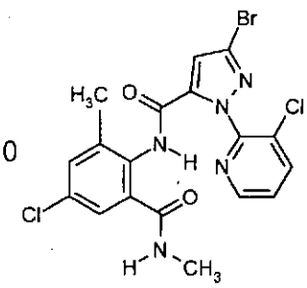
(A-8) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-9



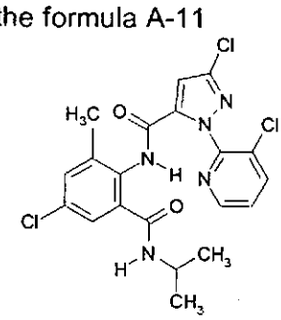
(A-9) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-10



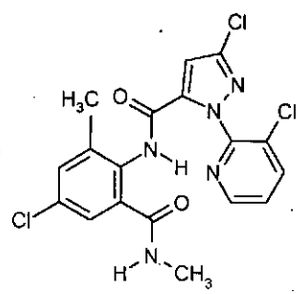
(A-10) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-11



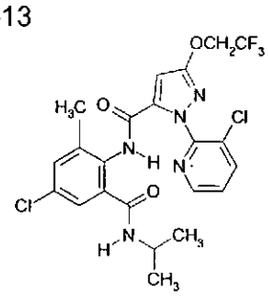
(A-11) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-12



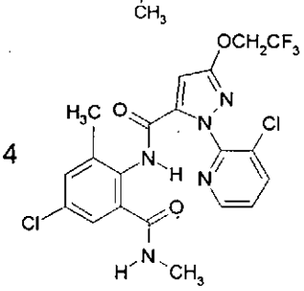
(A-12) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-13



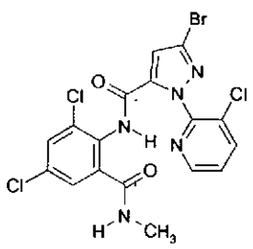
(A-13) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-14



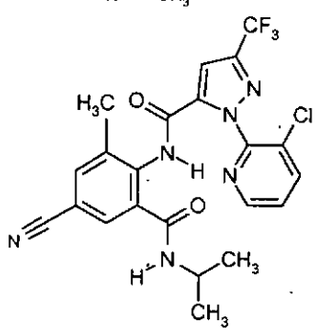
(A-14) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-15

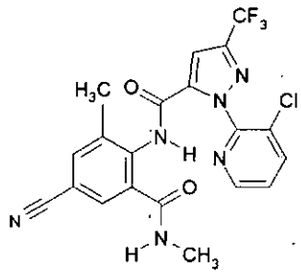


(A-15) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-16

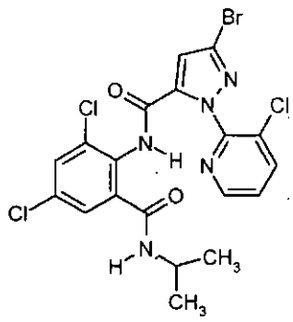


(A-16) + COMPOUND OF FORMULA I,



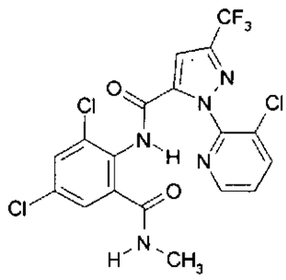
(A-17) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-17

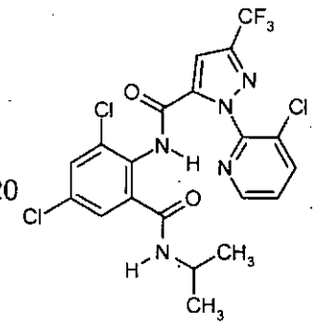


the formula A-18 (A-18) + COMPOUND OF FORMULA I,

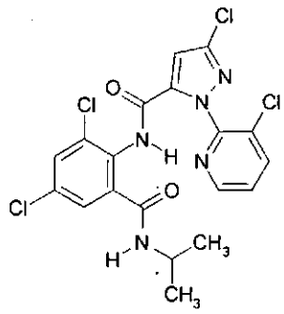
the formula A-19



(A-19) + COMPOUND OF FORMULA I,



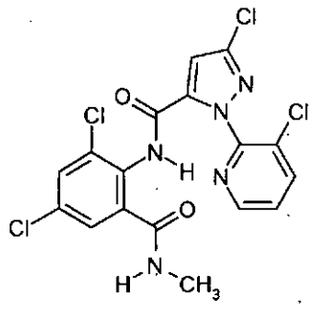
the formula A-20 (A-20) + COMPOUND OF FORMULA I,



(A-21) + COMPOUND OF FORMULA I,

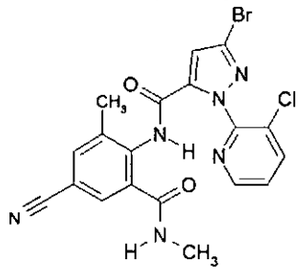
the formula A-21

the formula A-22



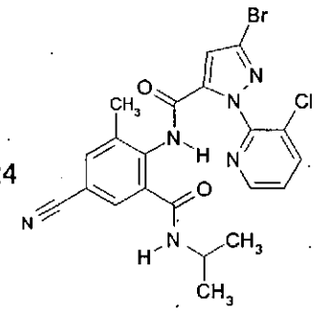
(A-22) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-23

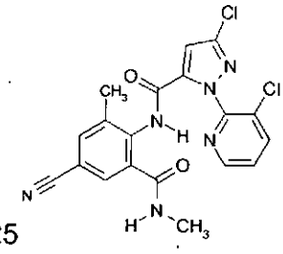


(A-23) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-24

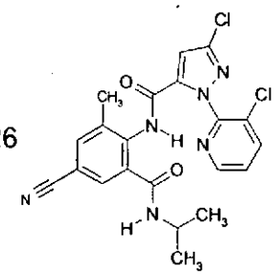


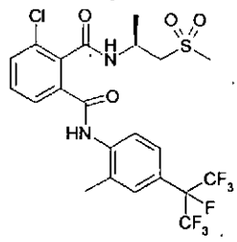
(A-24) + COMPOUND OF FORMULA I,



(A-25) + COMPOUND OF FORMULA I,

the formula A-25

the formula A-26  (A-26) + COMPOUND OF FORMULA I,

and the formula A-27  (A-27) + COMPOUND OF FORMULA I.

The references in brackets behind the active ingredients, e.g. *[3878-19-1]* refer to the Chemical Abstracts Registry number. The compounds of the formula A-1 to A-26 are described in WO 03/015518 or in WO 04/067528. The compound of the formula A-27 is described in WO 06/022225 and in WO 07/112844. The above described mixing partners are known. Where the active ingredients are included in "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. TomLin; The British Crop Protection Council], they are described therein under the entry number given in round brackets hereinabove for the particular compound; for example, the compound "abamectin" is described under entry number (1). Where "[CCN]" is added hereinabove to the particular compound, the compound in question is included in the "Compendium of Pesticide Common Names", which is accessible on the internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]; for example, the compound "acetoprole" is described under the internet address http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.htmL.

Most of the active ingredients described above are referred to hereinabove by a so-called "common name", the relevant "ISO common name" or another "common name" being used in individual cases. If the designation is not a "common name", the nature of the designation used instead is given in round brackets for the particular compound; in that case, the IUPAC name, the IUPAC/Chemical Abstracts name, a "chemical name", a "traditional name", a "compound name" or a "develoment code" is used or, if neither one of those designations nor a "common name" is used, an "alternative name" is employed. "CAS Reg. No" means the Chemical Abstracts Registry Number.

The compounds of formula I according to the invention can also be used in combination with one or more fungicides. In particular, in the following mixtures of the compounds of formula I with fungicides, the term COMPOUND OF FORMULA I preferably refers to a compound selected from one of the Tables 1 to 102:

COMPOUND OF FORMULA I + (*E*)-*N*-methyl-2-[2-(2,5-dimethylphenoxymethyl)phenyl]-2-methoxy-iminoacetamide (SSF-129), COMPOUND OF FORMULA I + 4-bromo-2-cyano-*N*,*N*-dimethyl-6-trifluoromethylbenzimidazole-1-sulphonamide, COMPOUND OF FORMULA I + α-[*N*-(3-chloro-2,6-xylyl)-2-methoxyacetamido]-γ -butyrolactone, COMPOUND OF FORMULA I + 4-chloro-2-cyano-*N*,*N*-dimethyl-5-*p*-tolylimidazole-1-sulfonamide (IKF-916, cyamidazosulfamid), COMPOUND OF FORMULA I + 3-5-dichloro-*N*-(3-chloro-1-ethyl-1-methyl-2-oxopropyl)-4-methylbenzamide (RH-7281, zoxamide), COMPOUND OF FORMULA I + *N*-allyl-4,5,-dimethyl-2-trimethylsilylthiophene-3-carboxamide (MON65500), COMPOUND OF FORMULA I + *N*-(1-cyano-1,2-dimethylpropyl)-2-(2,4-dichlorophenoxy)propionamide (AC382042), COMPOUND OF FORMULA I + *N*-(2-methoxy-5-pyridyl)-cyclopropane carboxamide, COMPOUND OF FORMULA I + acibenzolar, COMPOUND OF FORMULA I + alanycarb, COMPOUND OF FORMULA I + aldimorph, COMPOUND OF FORMULA I + amisulbrom, COMPOUND OF FORMULA I + anilazine, COMPOUND OF FORMULA I + azaconazole, COMPOUND OF FORMULA I + azoxystrobin, COMPOUND OF FORMULA I + benalaxyl, COMPOUND OF FORMULA I + benalaxyl-M, COMPOUND OF FORMULA I + benomyl, COMPOUND OF FORMULA I + benthiavalicarb, COMPOUND OF FORMULA I + biloxazol, COMPOUND OF FORMULA I + bitertanol, COMPOUND OF FORMULA I + bixafen, COMPOUND OF FORMULA I + blasticidin S, COMPOUND OF FORMULA I + boscalid, COMPOUND OF FORMULA I + bromuconazole, COMPOUND OF FORMULA I + bupirimate, COMPOUND OF FORMULA I + captafol, COMPOUND OF FORMULA I + captan, COMPOUND OF FORMULA I + carbendazim, COMPOUND OF FORMULA I + carbendazim chlorhydrate, COMPOUND OF FORMULA I + carboxin, COMPOUND OF FORMULA I + carpropamid, carvone, COMPOUND OF FORMULA I + CGA41396, COMPOUND OF FORMULA I + CGA41397, COMPOUND OF FORMULA I + chinomethionate, COMPOUND OF FORMULA I + chlazafenone, COMPOUND OF FORMULA I + chlorothalonil, COMPOUND OF FORMULA I + chlorozolinate, COMPOUND OF FORMULA I + clozylacon, COMPOUND OF FORMULA I + copper containing compounds such as copper oxychloride, copper oxyquinolate, copper sulphate, copper tallate and Bordeaux mixture, COMPOUND OF FORMULA I + cyazofamid, COMPOUND OF FORMULA I + cyflufenamid, COMPOUND OF

FORMULA I + cymoxanil, COMPOUND OF FORMULA I + cyproconazole, COMPOUND OF FORMULA I + cyprodinil, COMPOUND OF FORMULA I + debacarb, COMPOUND OF FORMULA I + di-2-pyridyl disulphide 1,1'-dioxide, COMPOUND OF FORMULA I + dichlofluanid, COMPOUND OF FORMULA I + diclomezine, COMPOUND OF FORMULA I + dicloran, COMPOUND OF FORMULA I + diethofencarb, COMPOUND OF FORMULA I + difenoconazole, COMPOUND OF FORMULA I + difenzoquat, COMPOUND OF FORMULA I + diflumetorim, COMPOUND OF FORMULA I + *O,O*-di-*iso*-propyl-*S*-benzyl thiophosphate, COMPOUND OF FORMULA I + dimefluazole, COMPOUND OF FORMULA I + dimetconazole, COMPOUND OF FORMULA I + dimethomorph, COMPOUND OF FORMULA I + dimethirimol, COMPOUND OF FORMULA I + dimoxystrobin, COMPOUND OF FORMULA I + diniconazole, COMPOUND OF FORMULA I + dinocap, COMPOUND OF FORMULA I + dithianon, COMPOUND OF FORMULA I + dodecyl dimethyl ammonium chloride, COMPOUND OF FORMULA I + dodemorph, COMPOUND OF FORMULA I + dodine, COMPOUND OF FORMULA I + doguadine, COMPOUND OF FORMULA I + edifenphos, COMPOUND OF FORMULA I + epoxiconazole, COMPOUND OF FORMULA I + ethirimol, COMPOUND OF FORMULA I + ethyl(*Z*)-*N*-benzyl-*N*([methyl(methyl-thioethylideneaminooxycarbonyl)amino]thio)-β-alaninate, COMPOUND OF FORMULA I + etridiazole, COMPOUND OF FORMULA I + famoxadone, COMPOUND OF FORMULA I + fenamidone (RPA407213), COMPOUND OF FORMULA I + fenarimol, COMPOUND OF FORMULA I + fenbuconazole, COMPOUND OF FORMULA I + fenfuram, COMPOUND OF FORMULA I + fenhexamid (KBR2738), COMPOUND OF FORMULA I + fenoxanil, COMPOUND OF FORMULA I + fenpiclonil, COMPOUND OF FORMULA I + fenpropidin, COMPOUND OF FORMULA I + fenpropimorph, COMPOUND OF FORMULA I + fenpyrazamine/ipfenpyrazolone, COMPOUND OF FORMULA I + fentin acetate, COMPOUND OF FORMULA I + fentin hydroxide, COMPOUND OF FORMULA I + ferbam, COMPOUND OF FORMULA I + ferimzone, COMPOUND OF FORMULA I + fluazinam, COMPOUND OF FORMULA I + fludioxonil, COMPOUND OF FORMULA I + flumetover, COMPOUND OF FORMULA I + flumorph, COMPOUND OF FORMULA I + fluopicolide, COMPOUND OF FORMULA I + fluopyram, COMPOUND OF FORMULA I + fluoxastrobin, COMPOUND OF FORMULA I + fluoroimide, COMPOUND OF FORMULA I + fluquinconazole, COMPOUND OF FORMULA I + flusilazole, COMPOUND OF FORMULA I + flutianil, COMPOUND OF FORMULA I + flutolanil, COMPOUND OF FORMULA I + flutriafol, COMPOUND OF FORMULA I + fluxapyroxad, COMPOUND OF FORMULA I + folpet, COMPOUND OF FORMULA I + fuberidazole, COMPOUND OF FORMULA I + furalaxyl, COMPOUND OF FORMULA I + furametpyr, COMPOUND OF FORMULA I +

guazatine, COMPOUND OF FORMULA I + hexaconazole, COMPOUND OF FORMULA I + hydroxyisoxazole, COMPOUND OF FORMULA I + hymexazole, COMPOUND OF FORMULA I + imazalil, COMPOUND OF FORMULA I + imibenconazole, COMPOUND OF FORMULA I + iminoctadine, COMPOUND OF FORMULA I + iminoctadine triacetate, COMPOUND OF FORMULA I + ipconazole, COMPOUND OF FORMULA I + iprobenfos, COMPOUND OF FORMULA I + iprodione, COMPOUND OF FORMULA I + iprovalicarb (SZX0722), COMPOUND OF FORMULA I + isopropanyl butyl carbamate, COMPOUND OF FORMULA I + isoprothiolane, COMPOUND OF FORMULA I + isopyrazam, COMPOUND OF FORMULA I + isotianil, COMPOUND OF FORMULA I + kasugamycin, COMPOUND OF FORMULA I + kresoxim-methyl, COMPOUND OF FORMULA I + LY186054, COMPOUND OF FORMULA I + LY211795, COMPOUND OF FORMULA I + LY248908, COMPOUND OF FORMULA I + mancozeb, COMPOUND OF FORMULA I + mandipropamid, COMPOUND OF FORMULA I + maneb, COMPOUND OF FORMULA I + mefenoxam, COMPOUND OF FORMULA I + mepanipyrim, COMPOUND OF FORMULA I + mepronil, COMPOUND OF FORMULA I + meptyldinocap, COMPOUND OF FORMULA I + metalaxyl, COMPOUND OF FORMULA I + metconazole, COMPOUND OF FORMULA I + metiram, COMPOUND OF FORMULA I + metiram-zinc, COMPOUND OF FORMULA I + metominostrobin, COMPOUND OF FORMULA I + metrafenone, COMPOUND OF FORMULA I + myclobutanil, COMPOUND OF FORMULA I + nepasozin, COMPOUND OF FORMULA I + nickel dimethyldithiocarbamate, COMPOUND OF FORMULA I + nicobifen, COMPOUND OF FORMULA I + nitrothal-*iso*propyl, COMPOUND OF FORMULA I + nuarimol, COMPOUND OF FORMULA I + ofurace, COMPOUND OF FORMULA I + organomercury compounds, COMPOUND OF FORMULA I + orysastrobin, COMPOUND OF FORMULA I + oxadixyl, COMPOUND OF FORMULA I + oxasulfuron, COMPOUND OF FORMULA I + oxolinic acid, COMPOUND OF FORMULA I + oxpoconazole, COMPOUND OF FORMULA I + oxycarboxin, COMPOUND OF FORMULA I + pefurazoate, COMPOUND OF FORMULA I + penconazole, COMPOUND OF FORMULA I + pencycuron, COMPOUND OF FORMULA I + penthiopyrad, COMPOUND OF FORMULA I + phenazin oxide, COMPOUND OF FORMULA I + phosetyl-Al, COMPOUND OF FORMULA I + phosphorus acids, COMPOUND OF FORMULA I + phthalide, COMPOUND OF FORMULA I + picoxystrobin (ZA1963), COMPOUND OF FORMULA I + polyoxin D, COMPOUND OF FORMULA I + polyram, COMPOUND OF FORMULA I + probenazole, COMPOUND OF FORMULA I + prochloraz, COMPOUND OF FORMULA I + procymidone, COMPOUND OF FORMULA I + propamocarb, COMPOUND OF FORMULA I + propiconazole, COMPOUND OF FORMULA I + propineb, COMPOUND OF FORMULA I + propionic acid, COMPOUND OF FORMULA I

+ proquinazid, COMPOUND OF FORMULA I + prothioconazole, COMPOUND OF FORMULA I + pyraclostrobin, COMPOUND OF FORMULA I + pyrazophos, COMPOUND OF FORMULA I + pyribencarb, COMPOUND OF FORMULA I + pyrifenox, COMPOUND OF FORMULA I + pyrimethanil, COMPOUND OF FORMULA I + pyroquilon, COMPOUND OF FORMULA I + pyroxyfur, COMPOUND OF FORMULA I + pyrrolnitrin, COMPOUND OF FORMULA I + quaternary ammonium compounds, COMPOUND OF FORMULA I + quinomethionate, COMPOUND OF FORMULA I + quinoxyfen, COMPOUND OF FORMULA I + quintozene, COMPOUND OF FORMULA I + sedaxane, COMPOUND OF FORMULA I + sipconazole (F-155), COMPOUND OF FORMULA I + sodium pentachlorophenate, COMPOUND OF FORMULA I + spiroxamine, COMPOUND OF FORMULA I + streptomycin, COMPOUND OF FORMULA I + sulphur, COMPOUND OF FORMULA I + tebuconazole, COMPOUND OF FORMULA I + tecloftalam, COMPOUND OF FORMULA I + tecnazene, COMPOUND OF FORMULA I + tetraconazole, COMPOUND OF FORMULA I + thiabendazole, COMPOUND OF FORMULA I + thifluzamid, COMPOUND OF FORMULA I + 2-(thiocyanomethylthio)benzothiazole, COMPOUND OF FORMULA I + thiophanate-methyl, COMPOUND OF FORMULA I + thiram, COMPOUND OF FORMULA I + tiadinil, COMPOUND OF FORMULA I + timibenconazole, COMPOUND OF FORMULA I + tolclofos-methyl, COMPOUND OF FORMULA I + tolylfluanid, COMPOUND OF FORMULA I + triadimefon, COMPOUND OF FORMULA I + triadimenol, COMPOUND OF FORMULA I + triazbutil, COMPOUND OF FORMULA I + triazoxide, COMPOUND OF FORMULA I + tricyclazole, COMPOUND OF FORMULA I + tridemorph, COMPOUND OF FORMULA I + trifloxystrobin, COMPOUND OF FORMULA I + triforine, COMPOUND OF FORMULA I + triflumizole, COMPOUND OF FORMULA I + triticonazole, COMPOUND OF FORMULA I + validamycin A, COMPOUND OF FORMULA I + valiphenal, COMPOUND OF FORMULA I + vapam, COMPOUND OF FORMULA I + vinclozolin, COMPOUND OF FORMULA I + zineb and COMPOUND OF FORMULA I + ziram.

The compounds of formula I may be mixed with soil, peat or other rooting media for the protection of plants against seed-borne, soil-borne or foliar fungal diseases.

The compounds of formula I according to the invention can also be used in combination with one or more other synergists. In particular, the following mixtures of the COMPOUND OF FORMULA I, where this term preferably refers to a compound selected from one of the Tables 1 to 102, are important:

COMPOUND OF FORMULA I + piperonyl butoxide, COMPOUND OF FORMULA I + sesamex, COMPOUND OF FORMULA I + safroxan and COMPOUND OF FORMULA I + dodecyl imidazole.

The compounds of formula I according to the invention can also be used in combination with one or more other herbicides. In particular, the following mixtures of the compound of formula I, where this term preferably refers to a compound selected from one of the Tables 1 to 102, are important:

compound of formula I + acetochlor, compound of formula I + acifluorfen, compound of formula I + acifluorfen-sodium, compound of formula I + aclonifen, compound of formula I + acrolein, compound of formula I + alachlor, compound of formula I + alloxydim, compound of formula I + allyl alcohol, compound of formula I + ametryn, compound of formula I + amicarbazone, compound of formula I + amidosulfuron, compound of formula I + aminocyclopyrachlor, compound of formula I + aminopyralid, compound of formula I + amitrole, compound of formula I + ammonium sulfamate, compound of formula I + anilofos, compound of formula I + asulam, compound of formula I + atraton, compound of formula I + atrazine, compound of formula I + azimsulfuron, compound of formula I + BCPC, compound of formula I + beflubutamid, compound of formula I + benazolin, compound of formula I + bencarbazone, compound of formula I + benfluralin, compound of formula I + benfuresate, compound of formula I + bensulfuron, compound of formula I + bensulfuron-methyl, compound of formula I + bensulide, compound of formula I + bentazone, compound of formula I + benzfendizone, compound of formula I + benzobicyclon, compound of formula I + benzofenap, compound of the formula I + bicyclopyrone, compound of formula I + bifenox, compound of formula I + bilanafos, compound of formula I + bispyribac, compound of formula I + bispyribac-sodium, compound of formula I + borax, compound of formula I + bromacil, compound of formula I + bromobutide, compound of formula I + bromoxynil, compound of formula I + butachlor, compound of formula I + butafenacil, compound of formula I + butamifos, compound of formula I + butralin, compound of formula I + butroxydim, compound of formula I + butylate, compound of formula I + cacodylic acid, compound of formula I + calcium chlorate, compound of formula I + cafenstrole, compound of formula I + carbetamide, compound of formula I + carfentrazone, compound of formula I + carfentrazone-ethyl, compound of formula I + CDEA, compound of formula I + CEPC, compound of formula I + chlorflurenol, compound of formula I + chlorflurenol-methyl, compound of formula I + chloridazon, compound of formula I + chlorimuron, compound of formula I + chlorimuron-ethyl, compound of formula I

+ chloroacetic acid, compound of formula I + chlorotoluron, compound of formula I + chlorpropham, compound of formula I + chlorsulfuron, compound of formula I + chlorthal, compound of formula I + chlorthal-dimethyl, compound of formula I + cinidon-ethyl, compound of formula I + cinmethylin, compound of formula I + cinosulfuron, compound of formula I + cisanilide, compound of formula I + clethodim, compound of formula I + clodinafop, compound of formula I + clodinafop-propargyl, compound of formula I + clomazone, compound of formula I + clomeprop, compound of formula I + clopyralid, compound of formula I + cloransulam, compound of formula I + cloransulam-methyl, compound of formula I + CMA, compound of formula I + 4-CPB, compound of formula I + CPMF, compound of formula I + 4-CPP, compound of formula I + CPPC, compound of formula I + cresol, compound of formula I + cumyluron, compound of formula I + cyanamide, compound of formula I + cyanazine, compound of formula I + cycloate, compound of formula I + cyclosulfamuron, compound of formula I + cycloxydim, compound of formula I + cyhalofop, compound of formula I + cyhalofop-butyl, compound of formula I + 2,4-D, compound of formula I + 3,4-DA, compound of formula I + daimuron, compound of formula I + dalapon, compound of formula I + dazomet, compound of formula I + 2,4-DB, compound of formula I + 3,4-DB, compound of formula I + 2,4-DEB, compound of formula I + desmedipham, compound of formula I + dicamba, compound of formula I + dichlobenil, compound of formula I + ortho-dichlorobenzene, compound of formula I + para-dichlorobenzene, compound of formula I + dichlorprop, compound of formula I + dichlorprop-P, compound of formula I + diclofop, compound of formula I + diclofop-methyl, compound of formula I + diclosulam, compound of formula I + difenzoquat, compound of formula I + difenzoquat metilsulfate, compound of formula I + diflufenican, compound of formula I + diflufenzopyr, compound of formula I + dimefuron, compound of formula I + dimepiperate, compound of formula I + dimethachlor, compound of formula I + dimethametryn, compound of formula I + dimethenamid, compound of formula I + dimethenamid-P, compound of formula I + dimethipin, compound of formula I + dimethylarsinic acid, compound of formula I + dinitramine, compound of formula I + dinoterb, compound of formula I + diphenamid, compound of formula I + diquat, compound of formula I + diquat dibromide, compound of formula I + dithiopyr, compound of formula I + diuron, compound of formula I + DNOC, compound of formula I + 3,4-DP, compound of formula I + DSMA, compound of formula I + EBEP, compound of formula I + endothal, compound of formula I + EPTC, compound of formula I + esprocarb, compound of formula I + ethalfluralin, compound of formula I + ethametsulfuron, compound of formula I + ethametsulfuron-methyl, compound of formula I + ethofumesate, compound of formula I +

ethoxyfen, compound of formula I + ethoxysulfuron, compound of formula I + etobenzanid, compound of formula I + fenoxaprop-P, compound of formula I + fenoxaprop-P-ethyl, compound of formula I + fentrazamide, compound of formula I + ferrous sulfate, compound of formula I + flamprop-M, compound of formula I + flazasulfuron, compound of formula I + florasulam, compound of formula I + fluazifop, compound of formula I + fluazifop-butyl, compound of formula I + fluazifop-P, compound of formula I + fluazifop-P-butyl, compound of formula I + flucarbazone, compound of formula I + flucarbazone-sodium, compound of formula I + flucetosulfuron, compound of formula I + fluchloralin, compound of formula I + flufenacet, compound of formula I + flufenpyr, compound of formula I + flufenpyr-ethyl, compound of formula I + flumetsulam, compound of formula I + flumiclorac, compound of formula I + flumiclorac-pentyl, compound of formula I + flumioxazin, compound of formula I + fluometuron, compound of formula I + fluoroglycofen, compound of formula I + fluoroglycofen-ethyl, compound of formula I + flupropanate, compound of formula I + flupyrsulfuron, compound of formula I + flupyrsulfuron-methyl-sodium, compound of formula I + flurenol, compound of formula I + fluridone, compound of formula I + flurochloridone, compound of formula I + fluroxypyr, compound of formula I + flurtamone, compound of formula I + fluthiacet, compound of formula I + fluthiacet-methyl, compound of formula I + fomesafen, compound of formula I + foramsulfuron, compound of formula I + fosamine, compound of formula I + glufosinate, compound of formula I + glufosinate-ammonium, compound of formula I + glufosinate-P, compound of formula I + glyphosate, compound of formula I + glyphosate-trimesium, compound of formula I + halosulfuron, compound of formula I + halosulfuron-methyl, compound of formula I + haloxyfop, compound of formula I + haloxyfop-P, compound of formula I + HC-252, compound of formula I + hexazinone, compound of formula I + imazamethabenz, compound of formula I + imazamethabenz-methyl, compound of formula I + imazamox, compound of formula I + imazapic, compound of formula I + imazapyr, compound of formula I + imazaquin, compound of formula I + imazethapyr, compound of formula I + imazosulfuron, compound of formula I + indanofan, compound of formula I + indaziflam, compound of formula I + iodomethane, compound of formula I + iodosulfuron, compound of formula I + iodosulfuron-methyl-sodium, compound of formula I + ioxynil, compound of formula I + ipfencarbazone, compound of formula I + isoproturon, compound of formula I + isouron, compound of formula I + isoxaben, compound of formula I + isoxachlortole, compound of formula I + isoxaflutole, compound of formula I + karbutilate, compound of formula I + lactofen, compound of formula I + lenacil, compound of formula I + linuron, compound of formula I + MAA, compound of formula I + MAMA, compound of formula I + MCPA,

compound of formula I + MCPA-thioethyl, compound of formula I + MCPB, compound of formula I + mecoprop, compound of formula I + mecoprop-P, compound of formula I + mefenacet, compound of formula I + mefluidide, compound of formula I + mesosulfuron, compound of formula I + mesosulfuron-methyl, compound of formula I + mesotrione, compound of formula I + metam, compound of formula I + metamifop, compound of formula I + metamitron, compound of formula I + metazachlor, compound of formula I + methabenzthiazuron, compound of formula I + methylarsonic acid, compound of formula I + methyldymron, compound of formula I + methyl isothiocyanate, compound of formula I + metobenzuron, compound of formula I + metolachlor, compound of formula I + S-metolachlor, compound of formula I + metosulam, compound of formula I + metoxuron, compound of formula I + metribuzin, compound of formula I + metsulfuron, compound of formula I + metsulfuron-methyl, compound of formula I + MK-616, compound of formula I + molinate, compound of formula I + monolinuron, compound of formula I + MSMA, compound of formula I + naproanilide, compound of formula I + napropamide, compound of formula I + naptalam, compound of formula I + neburon, compound of formula I + nicosulfuron, compound of formula I + nonanoic acid, compound of formula I + norflurazon, compound of formula I + oleic acid (fatty acids), compound of formula I + orbencarb, compound of formula I + orthosulfamuron, compound of formula I + oryzalin, compound of formula I + oxadiargyl, compound of formula I + oxadiazon, compound of formula I + oxasulfuron, compound of formula I + oxaziclomefone, compound of formula I + oxyfluorfen, compound of formula I + paraquat, compound of formula I + paraquat dichloride, compound of formula I + pebulate, compound of formula I + pendimethalin, compound of formula I + penoxsulam, compound of formula I + pentachlorophenol, compound of formula I + pentanochlor, compound of formula I + pentoxazone, compound of formula I + pethoxamid, compound of formula I + petrolium oils, compound of formula I + phenmedipham, compound of formula I + phenmedipham-ethyl, compound of formula I + picloram, compound of formula I + picolinafen, compound of formula I + pinoxaden, compound of formula I + piperophos, compound of formula I + potassium arsenite, compound of formula I + potassium azide, compound of formula I + pretilachlor, compound of formula I + primisulfuron, compound of formula I + primisulfuron-methyl, compound of formula I + prodiamine, compound of formula I + profluazol, compound of formula I + profoxydim, compound of formula I + prometon, compound of formula I + prometryn, compound of formula I + propachlor, compound of formula I + propanil, compound of formula I + propaquizafop, compound of formula I + propazine, compound of formula I + propham, compound of formula I + propisochlor, compound of formula I +

propoxycarbazone, compound of formula I + propoxycarbazone-sodium, compound of formula I + propyrisulfuron, compound of formula I + propyzamide, compound of formula I + prosulfocarb, compound of formula I + prosulfuron, compound of formula I + pyraclonil, compound of formula I + pyraflufen, compound of formula I + pyraflufen-ethyl, compound of the formula I + pyrasulfotole, compound of formula I + pyrazolynate, compound of formula I + pyrazosulfuron, compound of formula I + pyrazosulfuron-ethyl, compound of formula I + pyrazoxyfen, compound of formula I + pyribenzoxim, compound of formula I + pyributicarb, compound of formula I + pyridafol, compound of formula I + pyridate, compound of formula I + pyriftalid, compound of formula I + pyriminobac, compound of formula I + pyriminobac-methyl, compound of formula I + pyrimisulfan, compound of formula I + pyrithiobac, compound of formula I + pyrithiobac-sodium, compound of formula I + pyroxsulam, compound of formula I + pyroxasulfone, compound of formula I + quinclorac, compound of formula I + quinmerac, compound of formula I + quinoclamine, compound of formula I + quizalofop, compound of formula I + quizalofop-P, compound of formula I + rimsulfuron, compound of formula I + saflufenacil, compound of formula I + sethoxydim, compound of formula I + siduron, compound of formula I + simazine, compound of formula I + simetryn, compound of formula I + SMA, compound of formula I + sodium arsenite, compound of formula I + sodium azide, compound of formula I + sodium chlorate, compound of formula I + sulcotrione, compound of formula I + sulfentrazone, compound of formula I + sulfometuron, compound of formula I + sulfometuron-methyl, compound of formula I + sulfosate, compound of formula I + sulfosulfuron, compound of formula I + sulfuric acid, compound of formula I + tar oils, compound of formula I + 2,3,6-TBA, compound of formula I + TCA, compound of formula I + TCA-sodium, compound of formula I + tebuthiuron, compound of formula I + tefuryltrione, compound of formula I + tembotrione, compound of formula I + tepraloxydim, compound of formula I + terbacil, compound of formula I + terbumeton, compound of formula I + terbuthylazine, compound of formula I + terbutryn, compound of formula I + thenylchlor, compound of formula I + thiazopyr, compound of formula I + thiencarbazone, compound of formula I + thifensulfuron, compound of formula I + thifensulfuron-methyl, compound of formula I + thiobencarb, compound of formula I + tiocarbazil, compound of formula I + topramezone, compound of formula I + tralkoxydim, compound of formula I + tri-allate, compound of formula I + triasulfuron, compound of formula I + triaziflam, compound of formula I + tribenuron, compound of formula I + tribenuron-methyl, compound of formula I + tricamba, compound of formula I + triclopyr, compound of formula I + trietazine, compound of formula I + trifloxysulfuron, compound of formula I + trifloxysulfuron-sodium, compound of

formula I + trifluralin, compound of formula I + triflusulfuron, compound of formula I + triflusulfuron-methyl, compound of formula I + trihydroxytriazine, compound of formula I + tritosulfuron, compound of formula I + [3-[2-chloro-4-fluoro-5-(1-methyl-6-trifluoromethyl-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahydropyrimidin-3-yl)phenoxy]-2-pyridyloxy]acetic acid ethyl ester (CAS RN 353292-31-6), compound of formula I + 4-[(4,5-dihydro-3-methoxy-4-methyl-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ylcarbonylsulfamoyl]-5-methylthiophene-3-carboxylic acid (BAY636), compound of formula I + BAY747 (CAS RN 335104-84-2), compound of formula I + topramezone (CAS RN 210631-68-8), compound of formula I + 4-hydroxy-3-[[2-[(2-methoxyethoxy)methyl]-6-(trifluoromethyl)-3-pyridinyl]carbonyl]-bicyclo[3.2.1]oct-3-en-2-one (CAS RN 352010-68-5), and compound of formula I + 4-hydroxy-3-[[2-(3-methoxypropyl)-6-(difluoromethyl)-3-pyridinyl]carbonyl]-bicyclo[3.2.1]oct-3-en-2-one.

The compounds of formula (I) according to the invention can also be used in combination with safeners. Preferably, in these mixtures, the compound of the formula (I) is one of those compounds listed in Tables 1 to 102 above. The following mixtures with safeners, especially, come into consideration:
compound of formula (I) + cloquintocet-mexyl, compound of formula (I) + cloquintocet acid and salts thereof, compound of formula (I) + fenchlorazole-ethyl, compound of formula (I) + fenchlorazole acid and salts thereof, compound of formula (I) + mefenpyr-diethyl, compound of formula (I) + mefenpyr diacid, compound of formula (I) + isoxadifen-ethyl, compound of formula (I) + isoxadifen acid, compound of formula (I) + furilazole, compound of formula (I) + furilazole R isomer, compound of formula (I) + benoxacor, compound of formula (I) + dichlormid, compound of formula (I) + AD-67, compound of formula (I) + oxabetrinil, compound of formula (I) + cyometrinil, compound of formula (I) + cyometrinil Z-isomer, compound of formula (I) + fenclorim, compound of formula (I) + cyprosulfamide, compound of formula (I) + naphthalic anhydride, compound of formula (I) + flurazole, compound of formula (I) + N-(2-methoxybenzoyl)-4-[(methylaminocarbonyl)amino]benzenesulfonamide, compound of formula (I) + CL 304,415, compound of formula (I) + dicyclonon, compound of formula (I) + fluxofenim, compound of formula (I) + DKA-24, compound of formula (I) + R-29148 and compound of formula (I) + PPG-1292. A safening effect can also be observed for the mixtures compound of the formula (I) + dymron, compound of the formula (I) + MCPA, compound of the formula (I) + mecoprop and compound of the formula (I) + mecoprop-P.

The mixing partners of the compound of formula I may also be in the form of esters or salts, as mentioned e.g. in The Pesticide Manual; 12th Edition (BCPC), 2000.

In the above different lists of active ingredients to be mixed with a COMPOUND OF FORMULA I, the compound of the formula I is preferably a compound of Tables 1 to 102; and more preferably, a compound selected from T2.011, T2.016, T2.023, T2.026, T2.030, T2.042, T2.047, T2.049, T2.050, T2.066, T2.067, T2.068, T2.069, T2.070, T2.071, T2.072, T2.104, T2.116, T2.117, T2.118, T2.120, T2.121, T2.125, T2.130, T2.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T3.011, T3.016, T3.023, T3.026, T3.030, T3.042, T3.047, T3.049, T3.050, T3.066, T3.067, T3.068, T3.069, T3.070, T3.071, T3.072, T3.104, T3.116, T3.117, T3.118, T3.120, T3.121, T3.125, T3.130, T3.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T13.011, T13.016, T13.023, T13.026, T13.030, T13.042, T13.047, T13.049, T13.050, T13.066, T13.067, T13.068, T13.069, T13.070, T13.071, T13.072, T13.104, T13.116, T13.117, T13.118, T13.120, T13.121, T13.125, T13.130, T13.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T20.011, T20.016, T20.023, T20.026, T20.030, T20.042, T20.047, T20.049, T20.050, T20.066, T20.067, T20.068, T20.069, T20.070, T20.071, T20.072, T20.104, T20.116, T20.117, T20.118, T20.120, T20.121, T20.125, T20.130, T20.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T22.011, T22.016, T22.023, T22.026, T22.030, T22.042, T22.047, T22.049, T22.050, T22.066, T22.067, T22.068, T22.069, T22.070, T22.071, T22.072, T22.104, T22.116, T22.117, T22.118, T22.120, T22.121, T22.125, T22.130, T22.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T25.011, T25.016, T25.023, T25.026, T25.030, T25.042, T25.047, T25.049, T25.050, T25.066, T25.067, T25.068, T25.069, T25.070, T25.071, T25.072, T25.104, T25.116, T25.117, T25.118, T25.120, T25.121, T25.125, T25.130, T25.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T27.011, T27.016, T27.023, T27.026, T27.030, T27.042, T27.047, T27.049, T27.050, T27.066, T27.067, T27.068, T27.069, T27.070, T27.071, T27.072, T27.104, T27.116, T27.117, T27.118, T27.120, T27.121, T27.125, T27.130, T27.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T70.011, T70.016, T70.023, T70.026, T70.030, T70.042, T70.047, T70.049, T70.050, T70.066, T70.067, T70.068, T70.069, T70.070, T70.071, T70.072, T70.104, T70.116, T70.117, T70.118, T70.120, T70.121, T70.125, T70.130, T70.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T71.011, T71.016, T71.023, T71.026, T71.030, T71.042, T71.047, T71.049,

T71.050, T71.066, T71.067, T71.068, T71.069, T71.070, T71.071, T71.072, T71.104, T71.116, T71.117, T71.118, T71.120, T71.121, T71.125, T71.130, T71.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T74.011, T74.016, T74.023, T74.026, T74.030, T74.042, T74.047, T74.049, T74.050, T74.066, T74.067, T74.068, T74.069, T74.070, T74.071, T74.072, T74.104, T74.116, T74.117, T74.118, T74.120, T74.121, T74.125, T74.130, T74.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T95.011, T95.016, T95.023, T95.026, T95.030, T95.042, T95.047, T95.049, T95.050, T95.066, T95.067, T95.068, T95.069, T95.070, T95.071, T95.072, T95.104, T95.116, T95.117, T95.118, T95.120, T95.121, T95.125, T95.130, T95.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr; or a compound selected from T96.011, T96.016, T96.023, T96.026, T96.030, T96.042, T96.047, T96.049, T96.050, T96.066, T96.067, T96.068, T96.069, T96.070, T96.071, T96.072, T96.104, T96.116, T96.117, T96.118, T96.120, T96.121, T96.125, T96.130, T96.131, whereby G can be hydrogen, C(O)OEt or C(O)OiPr;

and even more preferably, a compound of Tables P1 to P2.

In the above-mentioned mixtures of compounds of formula I, in particular a compound selected from said Tables 1 to 102, with other insecticides, fungicides, herbicides, safeners, adjuvants and the like, the mixing ratios can vary over a large range and are, preferably

100:1 to 1:6000, especially 50:1 to 1:50, more especially 20:1 to 1:20, even more especially 10:1 to 1:10. Those mixing ratios are understood to include, on the one hand, ratios by weight and also, on other hand, molar ratios.

The mixtures can advantageously be used in the above-mentioned formulations (in which case "active ingredient" relates to the respective mixture of compound of formula I with the mixing partner).

Some mixtures may comprise active ingredients which have significantly different physical, chemical or biological properties such that they do not easily lend themselves to the same conventional formulation type. In these circumstances other formulation types may be prepared. For example, where one active ingredient is a water insoluble solid and the other a water insoluble liquid, it may nevertheless be possible to disperse each active ingredient in the same continuous aqueous phase by dispersing the solid active ingredient as a suspension (using a preparation analogous to that of an SC) but dispersing the liquid

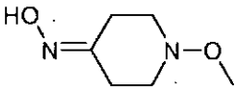
active ingredient as an emulsion (using a preparation analogous to that of an EW). The resultant composition is a suspoemulsion (SE) formulation.

The mixtures comprising a compound of formula I selected from Tables 1 to 102 and one or more active ingredients as described above can be applied, for example, in a single "ready-mix" form, in a combined spray mixture composed from separate formulations of the single active ingredient components, such as a "tank-mix", and in a combined use of the single active ingredients when applied in a sequential manner, i.e. one after the other with a reasonably short period, such as a few hours or days. The order of applying the compounds of formula I selected from Tables 1 to 102 and the active ingredients as described above is not essential for working the present invention.

The invention is illustrated by the following preparation examples. The H-NMR data of certain compounds of this invention shows line broadening at room temperature, suggesting the existence of plural conformational isomers due to, for example keto-enol tautomerism, hindered rotation, ring inversion in the piperidine moitey or nitrogen inversion at the piperidine N-OR center. Broad signals have been labeled with 'br' accordingly.

EXAMPLE 1: Preparation of Carbonic acid 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-8-methoxy-1-methoxy-methoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester ethyl ester (compound P1.2)

Step 1: Preparation of 1-methoxy-piperidin-4-one oxime

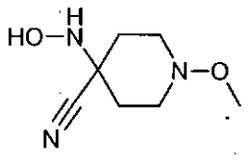


To a solution of 1-methoxy-piperidin-4-one [prepared according to Journal of Organic Chemistry (1961), 26, 1867-74] (258 g, 2.0 mol) and triethylamine (305.2 ml, 221.9 g, 4.4 mol) in methanol (3000 ml) was added hydroxylamine hydrochloride (277.6 g, 4.0 mol), and the reaction mixture heated at reflux for 1.5 hours. The solvent was evaporated, the residue diluted with diethyl ether and the suspension filtered. The filtrate was washed with water and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. Yield: 286.25 g of 1-methoxy-piperidin-4-one oxime as a colorless, viscous oil. This material was used without further purification in the next step.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 2.2-3.45 (br signals, total 8H), 3.55 (s, 3H), 8.65 (br s, 1H).

LC/MS (ES+): 145 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile (compound P4.1)

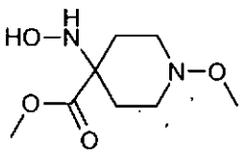


To a suspension of 1-methoxy-piperidin-4-one oxime (240 g, 1.66 mol) and potassium dihydrogen phosphate (792.9 g, 5.83 mol) in water (200 ml) at 0-5°C was added a solution of potassium cyanide (195.1 g, 3.0 mol) in water (200 ml) dropewise (caution!). The reaction mixture was stirred at room temperature overnight (stoppered flask), treated with another portion of potassium dihydrogen phosphate (79.3 g, 0.58 mol) and further stirred at room temperature over another night. The mixture was flushed with nitrogen, the semi-solid removed by filtration and dissolved in ethyl acetate. The aqueous layer was extracted twice with ethyl acetate, all organic layers combined, washed with water and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was triturated with cold diethyl ether, filtered and dried. Yield: 230.8 g of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile as a tan solid, mp 130-131°C.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.55-2.35 (br signals, total 4H), 2.60-3.45 (br signals, total 4H), 3.52 (s, 3H), 5.19 (br s, 1H) , 5.42 (br s, 1H).

IR (CN): ν 2227.8 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 172 $(M+H)^+$.

Step 3: Preparation of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound 4.3)



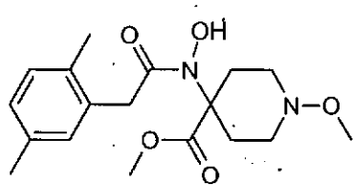
To a suspension of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile (230 g, 1.34 mol) in dichloromethane (2400 ml) at room temperature was added concentrated sulfuric acid (358 ml, 658.8 g, 6.72 mol) dropewise, and the reaction mixture was stirred at 40°C for one

hour. Methanol (925.1 ml, 731.7 g, 22.8 mol) was added at 40°C dropewise, and the mixture stirred at 40°C for 4 hours. The dichloromethane was distilled off allowing to heat the reaction mixture at 60°C for 24 hours. The reaction mixture was poured on ice (3kg) and neutralized by careful addition of concentrated aqueous sodium hydroxide first, followed by saturated aqueous sodium hydrogen carbonate. The aqueous phase was saturated with sodium chloride, extracted with *ter*-butyl methyl ether (10x 300 ml), the combined organic layers washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated to afford a first crop of product (163.8 g). Further extraction of the aqueous layer with ethyl acetate delivered another 35 g of crude product. Yield: 198.8 g of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester as a red-brown, viscous oil. This material was used without further purification in the next step.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.50-2.40 (br signals, total 4H), 2.76 (br m, 2H), 3.01-3.32 (br m, 2H), 3.52 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.58 (br s, 2H).

IR (COOMe): ν 1731.3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 205 $(M+H)^+$

Step 4: Preparation of 4-{[2-(2,5-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.1)



To a solution of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (50 g, 244.8 mmol) in tetrahydrofuran (500 ml) at 0°C was added sodium hydrogen carbonate (34.96 g, 416.2 mmol), followed by a solution of (2,5-dimethyl-phenyl)-acetyl chloride [prepared by treatment (2,5-dimethyl-phenyl)-acetic acid with oxalyl chloride in dichloromethane under standard conditions] (44.72g, 244.8 mmol) in tetrahydrofuran (500 ml) dropwise. The reaction mixture was stirred at 0°C for one hour and at room temperature for two hours. The solvent was evaporated, the residue diluted with water and ethyl acetate and the layers separated. The aqueous phase was extracted with ethyl acetate (6x 250 ml), the combined organic layers washed with an aqueous sodium hydrogen carbonate solution and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The crude product was triturated with a cold diethyl ether/hexane 1:1 solution, filtered and dried to afford 36.4 g as a white solid. The mother liquor was concentrated and purified by

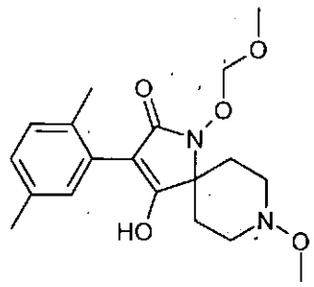
chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 1:1) to further afford 4.2 g of product. Yield: 40.6 g of 4-{[2-(2,5-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.1), mp 137-139°C.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.99-3.32 (br signals, total 8H), 2.23 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 3.83 (s, 2H), 6.43 (br s, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.99 (s, 1H), 7.06 (d, 1H).

LC/MS (ES+): 351 $(M+H)^+$

Step 5: Preparation of 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.2)

[two-steps (hydroxamic acid O-alkylation and cyclisation), one-pot procedure]



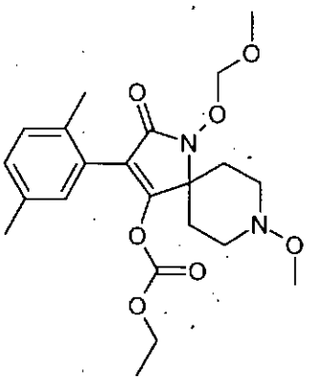
To a solution of 4-{[2-(2,5-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (35 g, 100.0 mmol) in dimethylformamide (300 ml) at 0°C was added sodium hydride (5.02 g, 55% w/w dispersion in mineral oil, 115.0 mmol) in 5 portions. The reaction mixture was stirred at 0°C for 30 minutes, treated with chloromethyl methyl ether (8.96 ml, 9.5 g, 118.0 mmol) dropwise, and further stirred at 0°C for one hour and at room temperature for 1.5 hours. To the mixture recooled at 0°C was added sodium methoxide (8.1 g, 150 mmol) in one portion, and stirring continued at room temperature for 2.5 hours. The reaction mixture was poured on ice water (500 ml), acidified to pH 5-6 with an aqueous HCl solution and thoroughly extracted with ethyl acetate. The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The crude oily product was triturated with a cold diethyl ether/hexane 1:1 solution, filtered and dried to afford 15.8 g as a white solid. The mother liquor was concentrated and purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 2:1) to further afford 2.1 g of product. Yield: 17.9 g of 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.2), mp 136-138°C.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.44-2.72 (br signals, total 4H), 2.27 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.78-3.48 (br signals, total 4H), 3.59 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 4.41 (s, 1H), 5.12 (br m, 2H), 6.76 (s, 1H),

7.02 (d, 1H), 7.10 (d, 1H) (mixture of keto-enol tautomers, signals of major diketo-form isomer shown).

LC/MS (ES+): 363 $(M+H)^+$, LC/MS (ES-): 361 $(M-H)^-$

Step 6: Preparation of carbonic acid 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-8-methoxy-1-methoxy-methoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester ethyl ester (title compound P1.2)



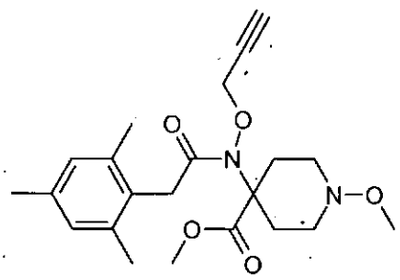
To a solution of 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (9.0 g, 24.83 mmol), triethylamine (6.9 ml, 5.0 g, 49.66 mmol) and 4-dimethylaminopyridine (100 mg, 0.82 mmol) in tetrahydrofuran (250 ml) at 0°C was added a solution of ethyl chloroformate (3.09 ml, 3.5 g, 32.28 mmol) in tetrahydrofuran (20 ml) dropwise. The suspension was stirred at 0°C for one hour, and at room temperature for one hour. The reaction mixture was evaporated, diluted with ethyl acetate and filtered to remove salts. The filtrate was washed with a saturated aqueous sodium hydrogen carbonate solution (2x 100 ml) and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The oily residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 1:1). Yield: 9.63 g of carbonic acid 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-8-methoxy-1-methoxy-methoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester ethyl ester (title compound P1.2) as a white solid, mp 109-111°C.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.06 (t, 3H), 1.75-2.05 (br m, 2H), 2.20 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.47 (br m, 2H), 2.89 (br m, 1H), 3.15-3.45 (br m, 3H), 3.59 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 3.99 (q, 2H), 5.07 (br s, 2H), 6.96 (s, 1H), 7.03 (d, 1H), 7.09 (d, 1H).

LC/MS (ES+): 435 $(M+H)^+$

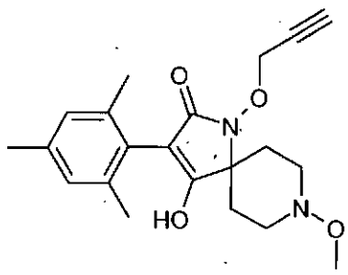
EXAMPLE 2: Preparation of 4-Hydroxy-8-methoxy-1-prop-2-ynyloxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.8)
(stepwise hydroxamic acid O-alkylation and cyclisation)

Step 1: Preparation of 1-methoxy-4-{prop-2-ynyloxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.4)



To a solution of 4-{hydroxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.3 obtained in analogy to preparation example 1, step 4) (500 mg, 1.37 mmol) in tetrahydrofuran (3 ml) at 0°C was added sodium hydride (66 mg, 55% w/w dispersion in mineral oil, 1.51 mmol) in 2 portions. The reaction mixture was stirred at 0°C for one hour, treated with propargyl bromide (202 mg, 1.65 mmol) dropwise, and further stirred at room temperature overnight. The reaction mixture was evaporated, diluted with ethyl acetate and filtered to remove salts. The filtrate was washed twice with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The oily residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 1:2). Yield: 321 mg of 1-methoxy-4-{prop-2-ynyloxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.4) as a colorless gum.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.90-3.34 (br signals, total 8H), 2.21 (s, 6H), 2.24 (s, 3H), 2.68 (t, 1H), 3.53 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.77 (d, 1H), 4.03 (m, 1H), 4.65-4.89 (br m, 2H), 6.84 (s, 2H).
LC/MS (ES+): 403 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 4-hydroxy-8-methoxy-1-prop-2-ynyloxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (title compound P2.8)



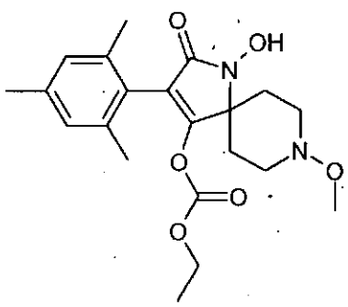
To a solution of 1-methoxy-4-{prop-2-ynyloxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (150 mg, 0.41 mmol) in dimethylformamide (2 ml) at 0°C was added sodium methoxide (33 mg, 0.62 mmol) in one portion and stirring continued at room temperature for 4 hours. The reaction mixture was poured on ice water, acidified to pH 5-6 with an aqueous HCl solution, saturated with sodium chloride and thoroughly extracted with ethyl acetate. The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 2:1). Yield: 14 mg of 4-hydroxy-8-methoxy-1-prop-2-ynyloxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (title compound P2.8) as a tan solid.

^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.97-2.08 (m, 2H), 2.10 (s, 6H), 2.25 (s, 3H), 2.23-2.32 (m, 2H), 3.04 (br s, 1H), 3.20 (m, 2H), 3.38 (m, 2H), 3.54 (s, 3H), 4.76 (br s, 2H), 6.89 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 371 $(M+H)^+$

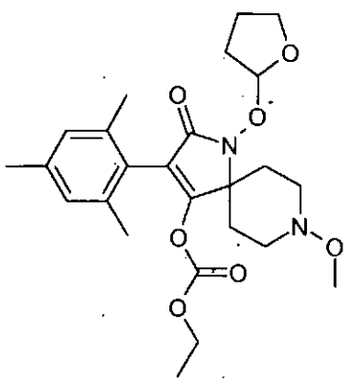
EXAMPLE 3: Preparation of Carbonic acid ethyl ester 8-methoxy-2-oxo-1-(tetrahydro-furan-2-yloxy)-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.9)

Step 1: Preparation of carbonic acid ethyl ester 1-hydroxy-8-methoxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.11)



To a solution of carbonic acid ethyl ester 8-methoxy-1-methoxymethoxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.7 obtained in analogy to preparation example 1, step 6) (1.0 g, 2.23 mmol) in bromotrimethylsilane (4.33 ml, 5.12 g, 33.44 mmol) under argon atmosphere was added 3Å molecular sieves (0.5 g) and the reaction mixture was stirred at 75°C overnight. The mixture was diluted with dichloromethane, filtered, the filtrate evaporated, the residue triturated with cold diethyl ether, filtered and dried. The crude product was purified by chromatography on silica gel (gradient dichloromethane → dichloromethane/methanol 20:1 → 10:1). Yield: 580 mg of carbonic acid ethyl ester 1-hydroxy-8-methoxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.11) as a white solid, mp 154-155°C.
^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.03 (t, 3H), 2.03 (br m, 2H), 2.13 (s, 6H), 2.22 (br m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.94 (br m, 1H), 3.28 (br m, 2H), 3.44 (br m, 1H), 3.54 (s, 3H), 4.00 (q, 2H), 6.87 (s, 2H).
LC/MS (ES+): 405 $(M+H)^+$

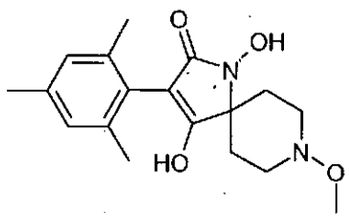
Step 2: Preparation of carbonic acid ethyl ester 8-methoxy-2-oxo-1-(tetrahydro-furan-2-yloxy)-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (title compound P1.9)



To a solution of carbonic acid ethyl ester 1-hydroxy-8-methoxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (150 mg, 0.37 mmol) in dichloromethane (3 ml) under argon atmosphere was added 2,3-dihydro-furan (56 µl, 52 mg, 0.74 mmol) and a catalytic amount of p-toluenesulfonic acid monohydrate (2 mg). The reaction mixture was stirred at room temperature for 4 hours, diluted with dichloromethane, washed twice with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 2:1). Yield: 114 mg of carbonic acid

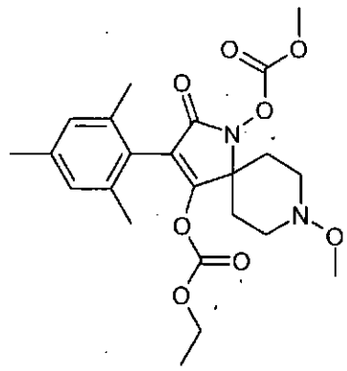
ethyl ester 8-methoxy-2-oxo-1-(tetrahydro-furan-2-yloxy)-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (title compound P1.9) as a colorless gum.
^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.02 (t, 3H), 1.70-2.22 (br signals, total 6H), 2.12 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.31-2.68 (br m, 2H), 2.86 (br m, 1H), 3.20 (br m, 1H), 3.39 (br m, 2H), 3.54 (s, 3H), 3.96 (m, 1H), 4.00 (q, 2H), 4.18 (q, 1H), 5.62 (br s, 1H), 6.88 (s, 2H).
LC/MS (ES+): 475 $(M+H)^+$

EXAMPLE 4: Preparation of 1,4-Dihydroxy-8-methoxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.4)



To a solution of 4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.6 obtained in analogy to preparation example 1, step 5) (500 mg, 1.33 mmol) in dichloromethane (10 ml) under argon atmosphere at 0°C was added 3Å molecular sieves (0.5 g), followed by bromotrimethylsilane (1.72 ml, 2.03 g, 13.28 mmol) dropewise and the reaction mixture was stirred at 0°C for one hour and at room temperature for 48 hours. The mixture was poured on cold water, the water layer saturated with sodium chloride and thoroughly extracted with dichloromethane. The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate). Yield: 40 mg of 1,4-dihydroxy-8-methoxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (title compound P2.4) as a white solid, mp 152-154°C.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.82-2.58 (br signals, total 4H), 2.12 (s, 6H), 2.27 (s, 3H), 2.93-3.46 (br signals, total 4H), 3.57 (br s, 3H), 6.89 (s, 2H), 9.97 (br s, 1H).
LC/MS (ES+): 333 $(M+H)^+$

EXAMPLE 5: Preparation of Carbonic acid ethyl ester 8-methoxy-1-methoxycarbonyloxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.13)



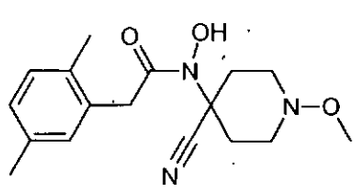
To a solution of carbonic acid ethyl ester 1-hydroxy-8-methoxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (preparation example 3, step 1; compound P1.11) (140 mg, 0.33 mmol), triethylamine (93 µl, 68 mg, 0.67 mmol) and 4-dimethylaminopyridine (2 mg) in tetrahydrofuran (3 ml) at 0°C was added a solution of methyl chloroformate (33 µl, 41 mg, 0.43 mmol) in tetrahydrofuran (2 ml) dropwise. The suspension was stirred at 0°C for one hour, and at room temperature for one hour. The reaction mixture was evaporated, diluted with ethyl acetate and filtered to remove salts. The filtrate was washed with a saturated aqueous sodium hydrogen carbonate solution (2x 15 ml) and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The oily residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 1:2). Yield: 30 mg of carbonic acid ethyl ester 8-methoxy-1-methoxycarbonyloxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (title compound P1.13) as a colorless gum.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.06 (t, 3H), 2.16 (s, 6H), 2.20 (m, 4H), 2.25 (s, 3H), 2.75-3.16 (br m, total 2H), 3.34 (br m, 2H), 3.55 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 3.99 (q, 2H), 6.85 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 463 $(M+H)^+$

EXAMPLE 6: Alternative preparation of 4-{[2-(2,5-Dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.1)

Step 1: Preparation of N-(4-cyano-1-methoxy-piperidin-4-yl)-2-(2,5-dimethyl-phenyl)-N-hydroxy-acetamide (compound P3.2)

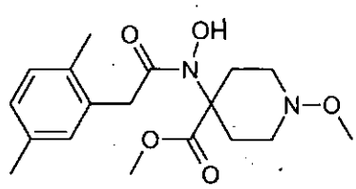


To a solution of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile (preparation example 1, step 2) (4.0 g, 23.4 mmol) and sodium hydrogen carbonate (3.0 g, 35.7 mmol) in ethyl acetate (35 ml) and water (25 ml) at 0°C was added a solution of (2,5-dimethyl-phenyl)-acetyl chloride (4.2 g, 23.0 mmol) in ethyl acetate (35 ml) dropwise over one hour. The reaction mixture was stirred at 0°C for one hour and at room temperature for two hours. The layers of the biphasic system were separated, the aqueous phase extracted with ethyl acetate (3x), the combined organic layers washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The oily residue was purified by chromatography on silica gel (gradient ethyl acetate/hexane 1:2 → 1:1 → 2:1). Yield: 1.55 g of N-(4-cyano-1-methoxy-piperidin-4-yl)-2-(2,5-dimethyl-phenyl)-N-hydroxy-acetamide (compound P3.2) as a white solid, mp 153-156°C.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 2.11 (br m, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.56 (br m, 2H), 2.77 (br m, 1H), 3.10 (br m, 2H), 3.31 (br m, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.77 (s, 2H), 6.83 (br s, 1H), 6.97 (s, 1H), 6.98 (d, 1H), 7.06 (d, 1H).

IR (CN): ν 2238.0 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 318 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 4-{[2-(2,5-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (title compound P3.1)

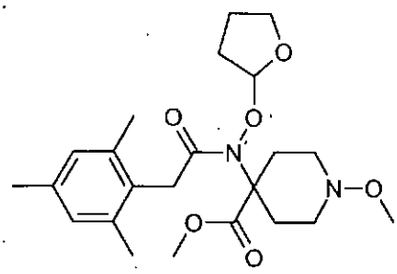


To a solution of N-(4-cyano-1-methoxy-piperidin-4-yl)-2-(2,5-dimethyl-phenyl)-N-hydroxy-acetamide (1.5 g, 4.73 mmol) in methanol (15 ml) at 0°C was added concentrated sulfuric acid (1.26 ml, 2.3 g, 23.64 mmol) slowly dropwise and the reaction mixture was stirred at reflux for 40 hours. The mixture was poured on ice (50 g), neutralized carefully with a saturated aqueous sodium hydrogen carbonate solution and extracted with ethyl acetate (5x). The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The oily residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 2:1) to afford 136 mg of an off-white solid. This material was triturated with a *tert*-butyl methyl ether/hexane 1:4 solution (2-3 ml), filtered and dried. Yield: 82 mg of 4-

{[2-(2,5-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (title compound P3.1) as a white solid, mp 140-142°C.
The spectral data were identical to those described above under preparation example 1, step 4.

EXAMPLE 7: Preparation of 4-Hydroxy-8-methoxy-1-(tetrahydro-furan-2-yloxy)-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.18)
(stepwise hydroxamic acid O-tetrahydrofuranyation and cyclisation)

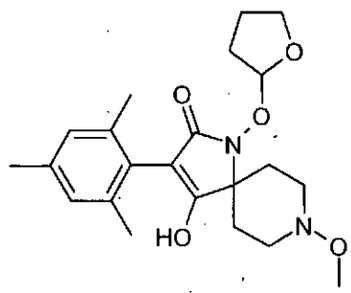
Step 1: Preparation of 1-methoxy-4-{(tetrahydro-furan-2-yloxy)-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.6)



To a solution of 4-{hydroxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.3 obtained in analogy to preparation example 1, step 4) (70 g, 192.1 mmol) in dichloromethane (1500 ml) under argon atmosphere was added 2,3-dihydro-furan (29.1 ml, 26.9 g, 384.1 mmol) and a catalytic amount of p-toluenesulfonic acid monohydrate (1.94 g, 19.2 mmol). The reaction mixture was stirred at reflux for 7 hours, filtered and concentrated. The residue was triturated with hexane, filtered and the solid dried *in vacuo*. Yield: 70.0 g of 1-methoxy-4-{(tetrahydro-furan-2-yloxy)-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.6) as a solid, mp 107-109°C. This material was used without further purification in the next step.

^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.79-2.36 (br signals, total 6H), 2.15 (br s, 6H), 2.21 (s, 3H), 2.42 (m, 1H), 2.65 (m, 1H), 2.80 (m, 1H), 3.10 (m, 1H), 3.26 (br m, 2H), 3.53 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.77 (m, 1H), 4.01 (m, 1H), 4.10 (m, 2H), 5.68 (br m, 1H), 6.80 (s, 2H).
LC/MS (ES+): 435 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 4-hydroxy-8-methoxy-1-(tetrahydro-furan-2-yloxy)-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (title compound P2.18)



To a solution of 1-methoxy-4-{(tetrahydro-furan-2-yloxy)-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (70 g, 161.1 mmol) in dimethylformamide (350 ml) at 10°C was added sodium methoxide (26.9 g, 483.3 mmol) in four portions and stirring continued at 10°C for 30 minutes, then at room temperature for 2 hours. The reaction mixture was poured on cold saturated aqueous ammonium chloride and thoroughly extracted with ethyl acetate (6x 100 ml). The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate, concentrated and dried *in vacuo*. The residue was triturated with hexane, filtered and the solid dried. Yield: 51.0 g of 4-hydroxy-8-methoxy-1-(tetrahydro-furan-2-yloxy)-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (title compound P2.18) as a tan solid, mp 144-146°C.

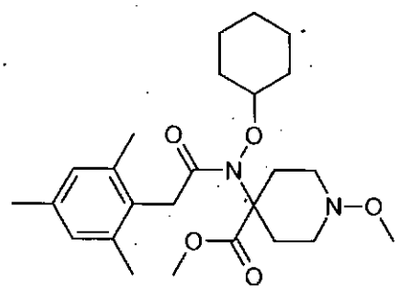
^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.75-2.19 (br signals, total 6H), 2.11 (s, 6H), 2.24 (s, 3H), 2.28-2.55 (m, 2H), 3.13-3.30 (m, 2H), 3.30-3.48 (m, 2H), 3.54 (s, 3H), 3.92 (m, 1H), 4.17 (m, 1H), 5.58 (m, 1H), 6.87 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 403 $(M+H)^+$

EXAMPLE 8: Preparation of 1-Cyclohexyloxy-4-hydroxy-8-methoxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.26)

(stepwise hydroxamic acid O-alkylation via Mitsunobu and cyclisation)

Step 1: Preparation of 4-{cyclohexyloxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.8)

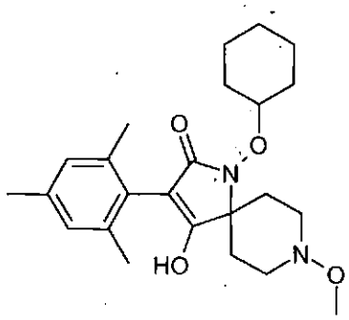


To a solution of triphenylphosphine (0.81 g, 3.09 mmol) in THF (20 ml) at 0°C was added diisopropyl azodicarboxylate (0.64 ml, 0.66 g, 3.10 mmol) dropwise and the resulting precipitate was stirred at 0°C for 30 minutes. 4-{Hydroxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.3 obtained in analogy to preparation example 1, step 4) (1.0 g, 2.74 mmol) was further added in one portion, followed by a solution of cyclohexanol (0.33 ml, 0.31 g, 3.10 mmol) in THF (2 ml) dropwise at 0°C. The reaction mixture was stirred at room temperature for two hours and concentrated *in vacuo*. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/cyclohexane 1:3). Yield: 690 mg of 4-{cyclohexyloxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.8) as a colorless gum.

^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.17-1.59 (br signals, total 7H), 1.68 (m, 1H), 1.91 (m, 2H), 2.03 (m, 1H), 2.17 (br s, 6H), 2.21 (s, 3H), 2.32 (m, 2H), 2.44 (m, 1H), 2.69 (m, 1H), 3.09 (m, 1H), 3.25 (m, 2H), 3.51 (s, 3H), 3.61 (s, 3H), 3.69 (m, 1H), 3.92-4.12 (m, 2H), 6.80 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 447 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 1-cyclohexyloxy-4-hydroxy-8-methoxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (title compound P2.26)



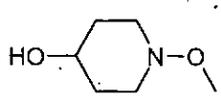
To a solution of 4-{cyclohexyloxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (600 mg, 1.34 mmol) in dimethylformamide (10 ml) at 0°C was added sodium methoxide (217 mg, 4.02 mmol) in one portion and the mixture was stirred at room temperature overnight. The reaction mixture was poured on cold saturated aqueous ammonium chloride and thoroughly extracted with ethyl acetate (4x 25 ml). The combined organic layers were washed with water and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/cyclohexane 1:1). Yield: 329 mg of 1-cyclohexyloxy-4-hydroxy-8-methoxy-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (title compound P2.26) as a slight tan foam. Trituration with hexane gave a white solid, mp 115-118°C.

^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.20-1.38 (m, 3H), 1.47 (m, 2H), 1.58 (m, 1H), 1.85 (m, 4H), 2.06 (m, 2H), 2.11 (s, 6H), 2.25 (s, 3H), 2.39 (m, 2H), 3.12-3.29 (m, 2H), 3.30-3.48 (m, 2H), 3.55 (s, 3H), 3.98 (m, 1H), 6.90 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 415 $(M+H)^+$.

EXAMPLE 9: Preparation of 1-Methoxy-4-{(1-methoxy-piperidin-4-yloxy)-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.26)

Step 1: Preparation of 1-methoxy-piperidin-4-ol

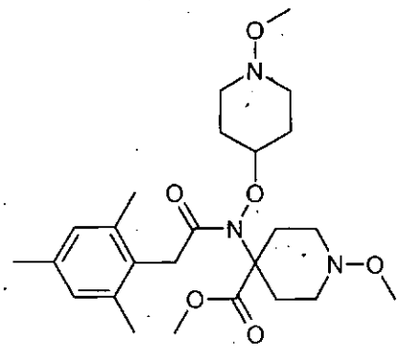


To a solution of 1-methoxy-piperidin-4-one [prepared according to Journal of Organic Chemistry (1961), 26, 1867-74] (15.0 g, 116.1 mmol) in ethanol (430 ml) was added sodium borohydride 96% (2.29 g, 58.1 mmol) in portions. The reaction mixture was stirred at room temperature for 5 hours, evaporated to half of its volume, poured on cold saturated aqueous ammonium chloride and thoroughly extracted with ethyl acetate. The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate). Yield: 10.9 g of 1-methoxy-piperidin-4-ol as a liquid.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.46-2.06 (br signals, total 5H), 2.34-3.40 (br signals, total 4H), 3.53 (s, 3H), 3.59-3.96 (br signals, total 1H).

LC/MS (ES+): 132 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 1-methoxy-4-{(1-methoxy-piperidin-4-yloxy)-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (title compound P3.26)



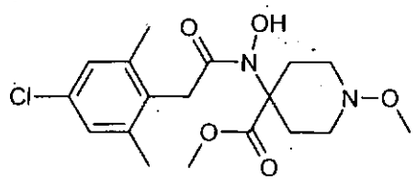
To a solution of triphenylphosphine (1.11 g, 4.23 mmol) in THF (20 ml) at 0°C was added diisopropyl azodicarboxylate (0.83 ml, 0.85 g, 4.24 mmol) dropwise and the resulting precipitate was stirred at 0°C for 30 minutes. 4-{Hydroxy-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.3 obtained in analogy to preparation example 1, step 4) (1.3 g, 3.57 mmol) was further added in one portion, followed by a solution of 1-methoxy-piperidin-4-ol (0.53 g, 4.04 mmol) in THF (6 ml) dropwise at 0°C. The reaction mixture was stirred at room temperature for two hours and concentrated *in vacuo*. The residue was triturated with hexane and filtered to remove part of the insoluble triphenylphosphine oxide. The filtrate was evaporated and the residue purified by chromatography on silica gel (gradient ethyl acetate/heptane 3:7 → ethyl acetate). Yield: 861 mg of pure 1-methoxy-4-{(1-methoxy-piperidin-4-yloxy)-[2-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-acetyl]-amino}-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (title compound P3.26) as a colorless gum, followed by a second fraction of compound P3.26 (701 mg) slightly contaminated with triphenylphosphine oxide.

^{1}H-NMR (CD_3OD, selected signals only): 2.19 (s, 6H, mesityl CH_3), 2.23 (s, 3H, mesityl CH_3), 3.52 (br s, 3H, $NOCH_3$), 3.54 (br s, 3H, $NOCH_3$), 3.65 (s, 3H, $COOCH_3$), 6.82 (s, 2H, mesityl H_{arom}).

LC/MS (ES+): 478 $(M+H)^+$

EXAMPLE 10: Preparation of Carbonic acid 3-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-1-ethoxycarbonyloxy-8-methoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester ethyl ester (compound P1.115)

Step 1: Preparation of 4-{[2-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.34)

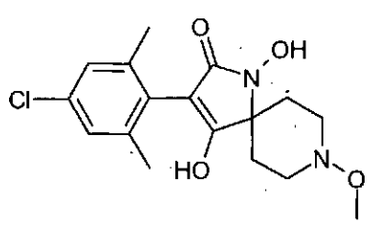


To a solution of (4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-acetyl chloride (2.90 g, 13.4 mmol) in THF (25 ml) was added sodium hydrogen carbonate (1.90 g, 22.7 mmol) at 0°C, followed by 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (preparation example 1, step 3; compound P4.2) (2.73 g, 13.4 mmol) dissolved in THF (25 ml) dropwise. The reaction mixture was stirred at 0°C for 30 minutes, then further 30 minutes at room temperature. After completion of the reaction indicated by TLC and LC/MS, the reaction mixture was filtered and the residue (NaCl) washed with THF. The filtrate was concentrated to dryness and stirred several times with little amounts of an ether/hexane mixture (1:1) to remove side products. Finally, the compound was washed with ether to yield pure 4-{[2-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P3.34) as white solid. Yield: 3.7 g, mp 228-231°C.

^{1}H-NMR (DMSO-d_6): 1.77-1.91 (br m, 1H), 1.91-2.05 (br m, 1H), 2.13 (s, 6H), 2.30-2.42 (br m, 1H), 2.45-2.55 (br m, 1H; covered by DMSO solvent peak), 2.62-2.80 (br m, 2H), 3.05-3.21 (br m, 2H), 3.40 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.70-3.85 (br m, 2H), 7.05 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 385/387 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 3-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-1,4-dihydroxy-8-methoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.103)



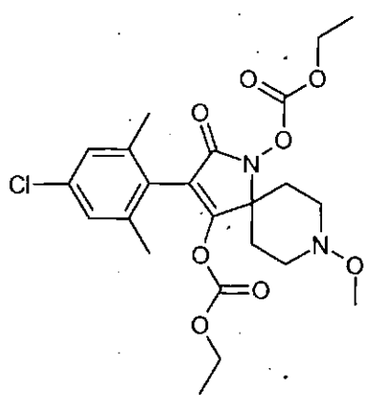
To a suspension of 4-{[2-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-acetyl]-hydroxy-amino}-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (0.40 g, 1.04 mmol) in dimethylformamide (3 ml)

at 0°C was added potassium tert-butoxide (0.35 g, 3.12 mmol) in portions. After completion of the addition, stirring was continued at 0°C for 30 minutes and at room temperature overnight. The reaction mixture was poured into cold water (0°C), the pH adjusted to ca 5.5 by adding 1 N HCl and then thoroughly extracted with ethyl acetate (three times). The combined organic layers were washed with water and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The resulting crude material was purified by column chromatography on silica gel (gradient ethyl acetate/cyclohexane 1:1 → ethyl acetate). Yield: 0.14 g of 3-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-1,4-dihydroxy-8-methoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.103) as a white solid.

^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.95-2.10 (br m, 2H), 2.15-2.30 (br m, 2H), 2.18 (s, 6H), 3.20-3.50 (br m, total 4H), 3.55 (s, 3H), 7.14 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 353/355 $(M+H)^+$

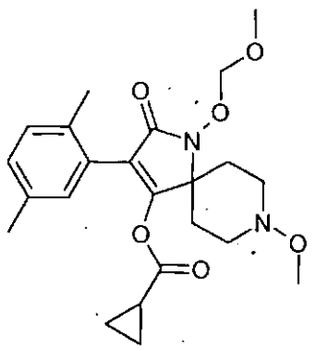
Step 3: Preparation of carbonic acid 3-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-1-ethoxycarbonyloxy-8-methoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester ethyl ester (title compound P1.115)



To a solution of 3-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-1,4-dihydroxy-8-methoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (140 mg, 0.40 mmol) and triethylamine (0.1 ml, 72 mg, 0.71 mmol) in THF (3 ml) at 0°C was added a solution of ethyl chloroformate (0.05 ml, 52 mg, 0.48 mmol) dissolved in THF (2 ml) dropwise. The suspension was stirred at 0°C for 30 minutes. Then the reaction mixture was poured into cold (0°C) water and thoroughly extracted three times with ethyl acetate. The combined organic layers were washed with water and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The raw material was purified by column chromatography on silica gel (ethyl acetate/cyclohexane 1:4). Yield: 70 mg of

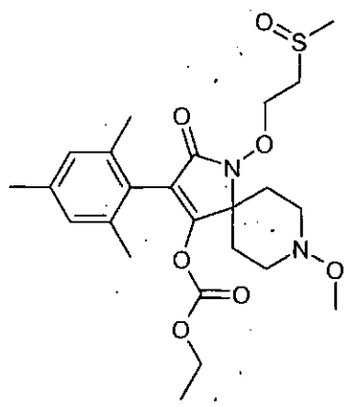
carbonic acid 3-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-1-ethoxycarbonyloxy-8-methoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester ethyl ester (title compound P1.115) as a colorless gum.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.09 (t, 3H), 1.39 (t, 3H), 2.08-2.30 (br m, 4H), 2.19 (s, 6H), 2.70-3.13 (br m, total 2H), 3.20-3.42 (br m, 2H), 3.55 (s, 3H), 4.03 (q, 2H), 4.38 (br q, 2H), 7.05 (s, 2H).
LC/MS (ES+): 497/499 $(M+H)^+$

EXAMPLE 11: Preparation of Cyclopropanecarboxylic acid 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-8-methoxy-1-methoxymethoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.4)



To a solution of 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.2) (200 mg, 0.55 mmol), triethylamine (0.153 ml, 111 mg, 1.10 mmol) and a catalytic amount of 4-dimethylaminopyridine in tetrahydrofuran (6 ml) at 0°C was added cyclopropanecarboxylic acid chloride (0.066 ml, 75 mg, 0.72 mmol) dropwise. The suspension was stirred at 0°C for 10 minutes, and at room temperature for one hour. The reaction mixture was evaporated, diluted with ethyl acetate and filtered to remove salts. The filtrate was washed with a saturated aqueous sodium hydrogen carbonate solution and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 1:2) to afford 200 mg of an oily product. This material was triturated with diethyl ether, filtered and dried. Yield: 190 mg of cyclopropanecarboxylic acid 3-(2,5-dimethyl-phenyl)-8-methoxy-1-methoxymethoxy-2-oxo-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (title compound P1.4) as a white solid, mp 114-116°C.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 0.75-0.92 (br m, 4H), 1.63 (br m, 1H), 1.72-2.03 (br m, 2H), 2.19 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.47 (br m, 2H), 2.88 (br m, 1H), 3.16-3.45 (br m, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 5.07 (br s, 2H), 6.91 (s, 1H), 7.02 (d, 1H), 7.08 (d, 1H).
LC/MS (ES+): 431 $(M+H)^+$

EXAMPLE 12: Preparation of Carbonic acid ethyl ester 1-(2-methanesulfinyl-ethoxy)-8-methoxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.111)



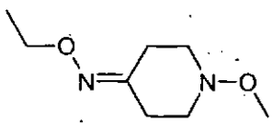
To a solution of carbonic acid ethyl ester 8-methoxy-1-(2-methylsulfanyl-ethoxy)-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (compound P1.110) (400 mg, 0.84 mmol) in dichloromethane (10 ml) at 0°C was added 3-chloroperbenzoic acid (210 mg, MCPBA ~70%, 0.85 mmol). The reaction mixture was stirred at room temperature overnight, then poured on saturated aqueous sodium metabisulfite and the layers separated. The aqueous phase was extracted with dichloromethane (3x), the combined organic layers were washed with water and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/methanol 20:1). Yield: 220 mg of carbonic acid ethyl ester 1-(2-methanesulfinyl-ethoxy)-8-methoxy-2-oxo-3-(2,4,6-trimethyl-phenyl)-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-4-yl ester (title compound P1.111) as a colorless gum.

^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.03 (t, 3H), 2.05 (br m, 2H), 2.13 (s, 3H), 2.14 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.33 (m, 2H), 2.75 (s, 3H), 2.96 (br m, 1H), 3.09-3.46 (br m, total 5H), 3.55 (s, 3H), 4.01 (q, 2H), 4.59 (m, 2H), 6.89 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 495 $(M+H)^+$

EXAMPLE 13: Preparation of 2-(4-Chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-N-(4-cyano-1-methoxy-piperidin-4-yl)-N-ethoxy-acetamide (compound P3.49)

Step 1: Preparation of 1-methoxy-piperidin-4-one O-ethyl-oxime

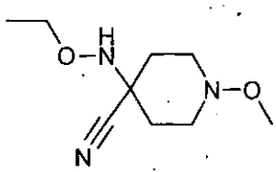


Obtained from 1-methoxy-piperidin-4-one (20 g,154.85 mmol), triethylamine (47.4 ml, 34.5 g, 340.66 mmol) and O-ethyl-hydroxylamine hydrochloride (30.2 g, 309.69 mmol) in methanol (300 ml) according to procedure 'EXAMPLE 1, Step 1'. Yield: 22.02 g of 1-methoxy-piperidin-4-one O-ethyl-oxime as a colorless, viscous liquid. This material was used without further purification in the next step.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.25 (t, 3H), 2.20-3.40 (br signals, total 8H), 3.55 (s, 3H), 4.07 (q, 2H).

LC/MS (ES+): 173 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 4-ethoxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile

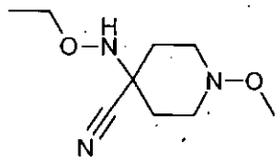


Obtained from 1-methoxy-piperidin-4-one O-ethyl-oxime (10 g, 58.06 mmol), potassium dihydrogen phosphate (31.6 g, 232.20 mmol) in water (50 ml) at 0-5°C to which was added a solution of potassium cyanide (6.81 g, 104.58 mmol) in water (50 ml) according to procedure 'EXAMPLE 1, Step 2'. The reaction mixture was stirred at room temperature for 2 days [treated in between with another portion of potassium dihydrogen phosphate (7.9 g) and potassium cyanide (1.9 g)] and at 40°C for 4 days [again treated in between with another portion of potassium dihydrogen phosphate (7.9 g) and potassium cyanide (1.9 g)]. The mixture was flushed with nitrogen, the aqueous layer saturated with sodium chloride and extracted with diethyl ether (4x 150 ml). The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/cyclohexane 1:2). Yield: 5.1 g of 4-ethoxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile as a pale yellow oil.

^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.19 (t, 3H), 1.59-2.29 (br signals, total 4H), 2.64-3.43 (br signals, total 4H), 3.52 (s, 3H), 3.80 (q, 2H), 5.37 (br s, 1H).

IR (CN): ν 2235.3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 200 $(M+H)^+$

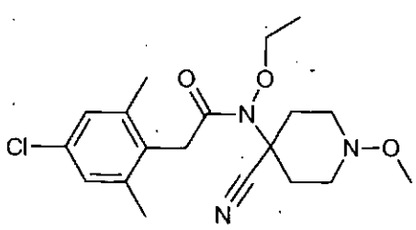
Step 2: Preparation of 4-ethoxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile (compound P4.3)



Obtained from 1-methoxy-piperidin-4-one O-ethyl-oxime (10 g, 58.06 mmol), potassium dihydrogen phosphate (31.6 g, 232.20 mmol) in water (50 ml) at 0-5°C to which was added a solution of potassium cyanide (6.81 g, 104.58 mmol) in water (50 ml) according to procedure 'EXAMPLE 1, Step 2'. The reaction mixture was stirred at room temperature for 2 days [treated in between with another portion of potassium dihydrogen phosphate (7.9 g) and potassium cyanide (1.9 g)] and at 40°C for 4 days [again treated in between with another portion of potassium dihydrogen phosphate (7.9 g) and potassium cyanide (1.9 g)]. The mixture was flushed with nitrogen, the aqueous layer saturated with sodium chloride and extracted with diethyl ether (4x 150 ml). The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/cyclohexane 1:2). Yield: 5.1 g of 4-ethoxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile (compound P4.3) as a pale yellow oil. ^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.19 (t, 3H), 1.59-2.29 (br signals, total 4H), 2.64-3.43 (br signals, total 4H), 3.52 (s, 3H), 3.80 (q, 2H), 5.37 (br s, 1H).

IR (CN): ν 2235.3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 200 $(M+H)^+$

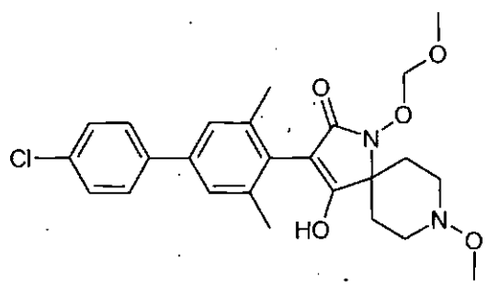
Step 3: Preparation of 2-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-N-(4-cyano-1-methoxy-piperidin-4-yl)-N-ethoxy-acetamide (title compound P3.49)



To a solution of 4-ethoxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile (2.0 g, 10.04 mmol), triethylamine (3.49 ml, 2.54 g, 25.09 mmol) and a catalytic amount of 4-dimethylamino-

pyridine in tetrahydrofuran (10 ml) at 0°C was added a solution of (4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-acetyl chloride (2.18 g, 10.04 mmol) in tetrahydrofuran (1 ml) dropwise. The suspension was stirred at 0°C for 15 minutes, and at room temperature overnight. The reaction mixture was evaporated, diluted with ethyl acetate and water, and the layers separated. The aqueous phase was extracted with ethyl acetate, the combined organic layers washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The crude material was triturated with diisopropyl ether, filtered and the filtrate concentrated. The oily residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl acetate/hexane 1:1). Yield: 1.53 g of 2-(4-chloro-2,6-dimethyl-phenyl)-N-(4-cyano-1-methoxy-piperidin-4-yl)-N-ethoxy-acetamide (title compound P3.49) as a colorless oil, which solidified upon standing, mp 100-103°C.
^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.36 (t, 3H), 2.00-3.44 (br signals, total 8H), 2.24 (s, 6H), 3.51 (br s, 3H), 3.63 (br d, 1H), 4.04 (br d, 1H), 4.13 (br q, 2H), 7.04 (s, 2H).
IR (CN): ν 2243.4 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 380/382 $(M+H)^+$

EXAMPLE 14: Preparation of 3-(4'-Chloro-3,5-dimethyl-biphenyl-4-yl)-4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.15)



To a suspension of 3-(4-bromo-2,6-dimethyl-phenyl)-4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.14) (500 mg, 1.13 mmol) in dimethoxyethane (22 ml) under nitrogen atmosphere was added tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0) (65 mg, 0.056 mmol) and the mixture stirred at room temperature for 15 minutes. After further addition of water (4.3 ml), 4-chlorophenylboronic acid (213 mg, 1.36 mmol) and sodium carbonate (410 mg, 3.87 mmol), the mixture was heated at reflux for 3 hours. The reaction mixture was acidified at room temperature with 1N hydrochloric acid and extracted with ethyl acetate (3x). The combined organic layers were washed with brine, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by chromatography on silica gel (ethyl

acetate/heptane 5:3) to afford 150 mg of an gummy product. This material was triturated with methanol, filtered and dried.

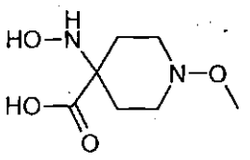
Yield: 90 mg of 3-(4'-chloro-3,5-dimethyl-biphenyl-4-yl)-4-hydroxy-8-methoxy-1-methoxymethoxy-1,8-diaza-spiro[4.5]dec-3-en-2-one (compound P2.15) as a white solid, mp 128°C (dec).

^{1}H-NMR ($CDCl_3$, selected signals only): 2.27 (br s, 6H, mesityl CH_3), 3.60 (br s, 3H, OCH_3), 3.62 (br s, 3H, OCH_3), 5.05 (s, 2H, $O\boldsymbol{CH_2}OCH_3$), 7.26 (s, 2H, H_{arom}), 7.39 (d, 2H, H_{arom}), 7.49 (d, 2H, H_{arom}).

LC/MS (ES+): 473/475 $(M+H)^+$

EXAMPLE 15: Alternative preparation of 4-Hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (compound P4.2)

Step 1: Preparation of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid (compound P4.4)

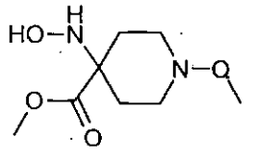


4-Hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carbonitrile (compound P4.1) (1.5 g, 8.76 mmol) was added in two portions to concentrated sulfuric acid (15 ml) at 0°C. After stirring for 20 minutes, a yellow solution was obtained which was kept at room temperature for two days. The reaction mixture was diluted with ice water (30 ml), heated at reflux for 4 hours, then poured on ice (25 g) and neutralised with 25% aqueous ammonia under cooling to pH 7-8. The reaction mixture was evaporated and the white solid residue triturated with warm (40°C) methanol (3x 50 ml), filtered and the combined methanol phases concentrated. The residue was treated with toluene (3x 50 ml) to remove water azeotropically until constant weight, then triturated with tetrahydrofuran, filtered and dried. Yield: 1.58 g of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid (compound P4.4) as a white solid, mp 180°C (dec).

^{1}H-NMR (CD_3OD): 1.54-2.29 (br signals, total 4H), 2.82 (br m, 2H), 3.07-3.26 (br signals, total 2H), 3.49 (s, 3H).

LC/MS (ES+): 191 $(M+H)^+$

Step 2: Preparation of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (title compound P4.2)



To a suspension of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid (1.0 g, 5.26 mmol) in methanol (25 ml) at 0-10°C was added thionyl chloride (1.14 ml, 1.88 g, 15.77 mmol) and the reaction mixture was heated at reflux for 48 hours. After cooling, the mixture was concentrated, the residue diluted with ice water (20 ml) and neutralised with aqueous sodium bicarbonate. The aqueous phase was extracted with diethyl ether (3x 25 ml), the combined organic layers washed with aqueous sodium bicarbonate and brine, dried over sodium sulfate and concentrated. Yield: 0.53 g of 4-hydroxyamino-1-methoxy-piperidine-4-carboxylic acid methyl ester (title compound P4.2) as a viscous, yellowish oil. This material was identical to the compound described above under preparation 'EXAMPLE 1, Step 3'. LC/MS (ES+): 205 $(M+H)^+$

Compounds of the formula I from Table P1, compounds of the formula II from Table P2 and intermediates listed in Tables P3 and P4 can be prepared by analogous procedures. Either one of the following LC-MS methods was used to characterize the compounds:

Method A

MS: ZQ Mass Spectrometer from Waters (Single quadrupole mass spectrometer); Ionisation method: Electrospray; Polarity: positive/negative ions; Capillary (kV) 3.00, Cone (V) 30.00, Extractor (V) 2.00, Source Temperature (°C) 100, Desolvation Temperature (°C) 250, Cone Gas Flow (L/Hr) 50, Desolvation Gas Flow (L/Hr) 400; Mass range: 150 to 1000 or 100 to 900 Da.

LC: HP 1100 HPLC from Agilent: solvent degasser, quaternary pump (ZCQ) / binary pump (ZDQ), heated column compartment and diode-array detector. Column: Phenomenex Gemini C18, 3 µm particle size, 110 Angström, 30 x 3 mm, Temp: 60°C; DAD Wavelength range (nm): 200 to 500; Solvent gradient: A = water + 0.05% v/v HCOOH, B= Acetonitril/Methanol (4:1, v/v) + 0.04% v/v HCOOH.

Time (min)	A%	B%	Flow (ml/min)
0.00	95.0	5.0	1.700

2.00	0.0	100.0	1.700
2.80	0.0	100.0	1.700
2.90	95.0	5.0	1.700
3.00	95.0	5.0	1.700

Method B

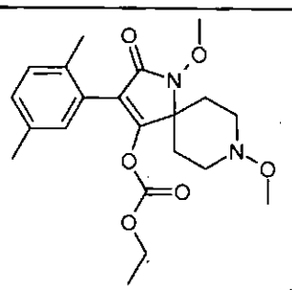
MS: ZMD Mass Spectrometer from Waters (Single quadrupole mass spectrometer) ; Ionisation method: Electrospray; Polarity: positive/negative ions; Capillary (kV) 3.80, Cone (V) 30.00, Extractor (V) 3.00, Source Temperature (°C) 150, Desolvation Temperature (°C) 350, Cone Gas Flow (L/Hr) OFF, Desolvation Gas Flow (L/Hr) 600; Mass range: 150 to 1000 (100 to 1500 for LowMass) or 100 to 900 Da.

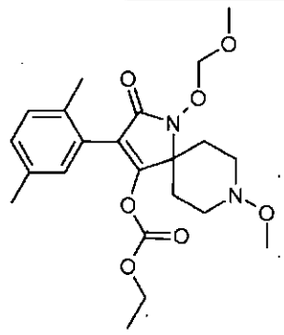
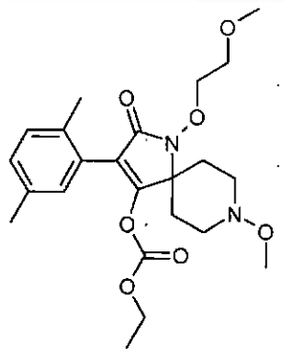
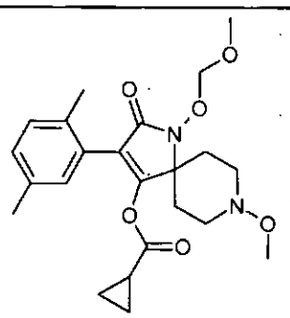
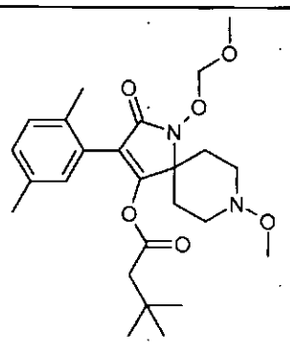
LC: HP 1100 HPLC from Agilent: solvent degasser, binary pump, heated column compartment and diode-array detector. Column: Phenomenex Gemini C18, 3 µm particle size, 110 Angström, 30 x 3 mm, Temp: 60 °C; DAD Wavelength range (nm): 200 to 500; Solvent gradient: A = water + 0.05% v/v HCOOH, B= Acetonitril/Methanol (4:1, v:v) + 0.04% v/v HCOOH.

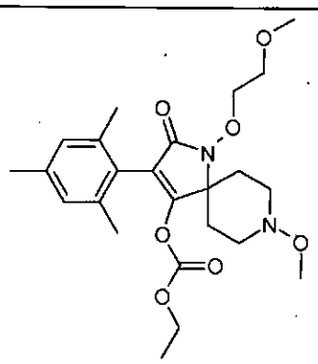
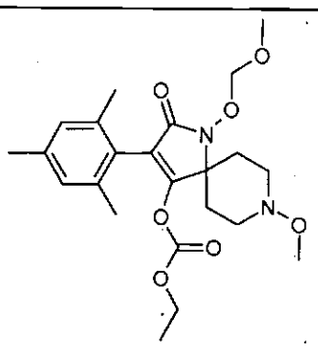
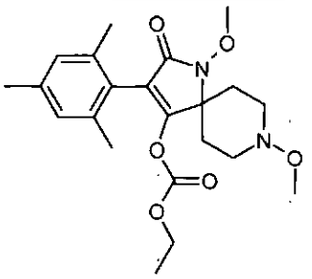
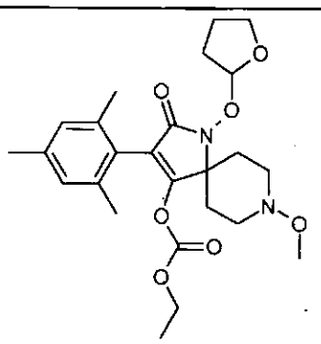
Time (min)	A%	B%	Flow (ml/min)
0.00	95.0	5.0	1.700
2.00	0.0	100.0	1.700
2.80	0.0	100.0	1.700
2.90	95.0	5.0	1.700
3.00	95.0	5.0	1.700

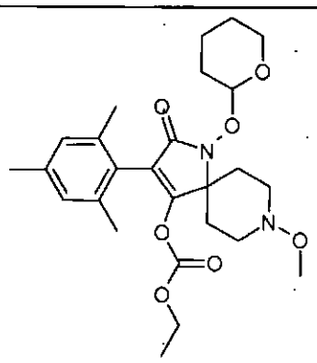
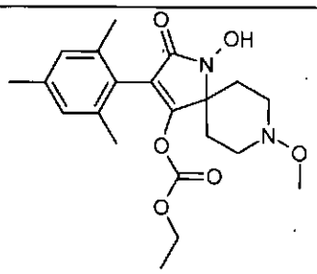
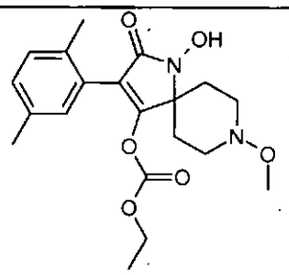
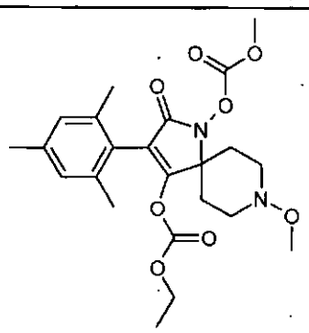
The characteristic values obtained for each compound were the retention time ("R_t", recorded in minutes) and the molecular ion as listed in Table P1, Table P2, Table P3 and in Table P4.

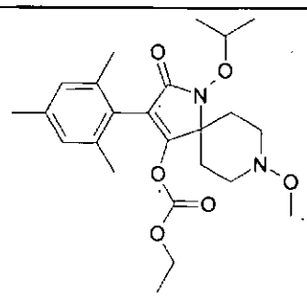
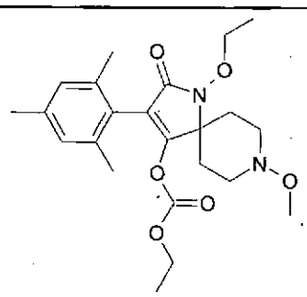
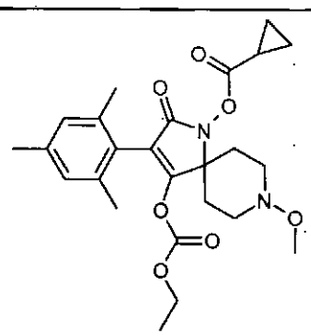
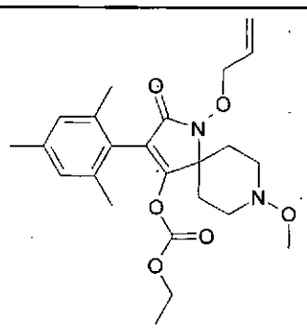
Table P1: Physical data of compounds of formula I:

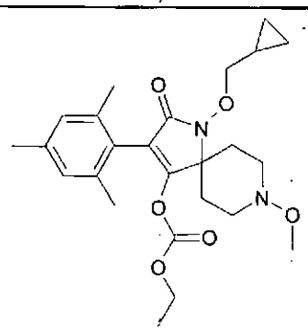
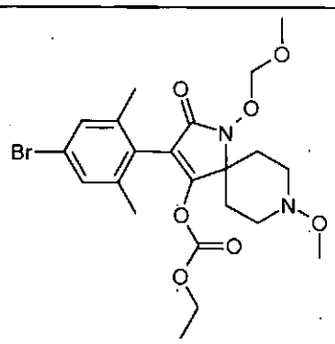
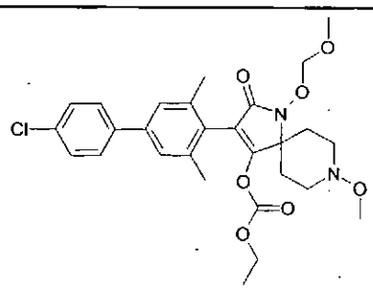
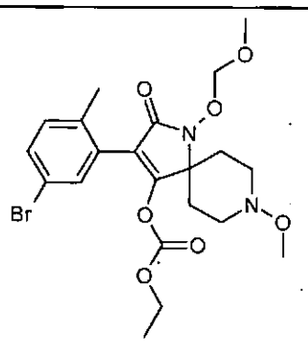
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.1		gum	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1.88 min

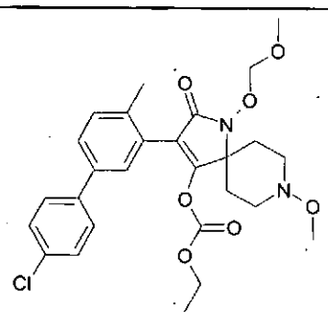
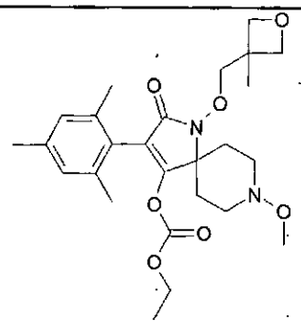
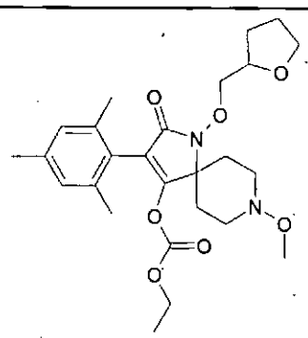
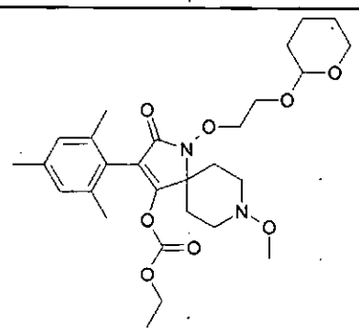
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.2	 EXAMPLE 1, step 6	109-111°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 1.90 min
P1.3		gum	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min
P1.4	 EXAMPLE 11	114-116°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1.87 min
P1.5		93-95°C	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 2.12 min

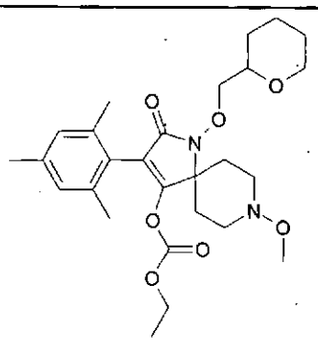
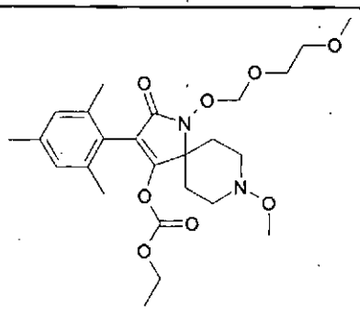
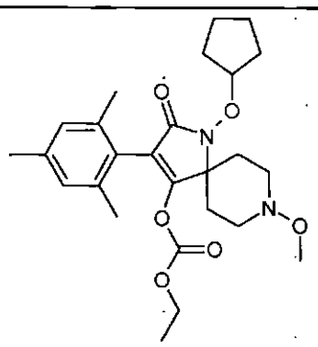
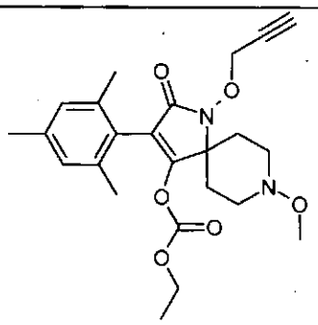
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.6		gum	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P1.7		109-111°C	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P1.8		96-97°C	LC/MS: 419 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min
P1.9	 EXAMPLE 3, step 2	100-102°C	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min

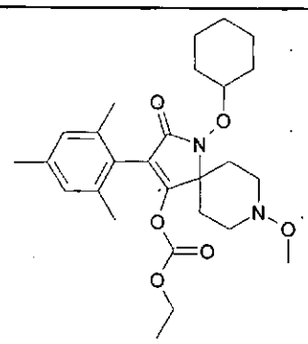
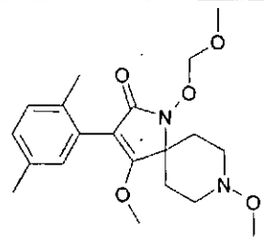
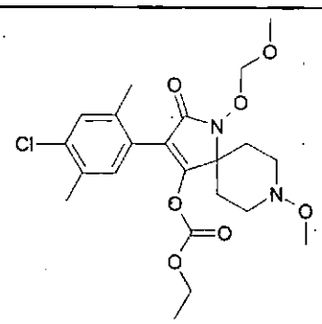
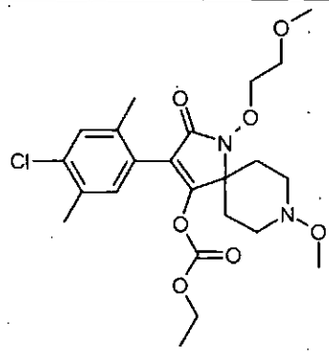
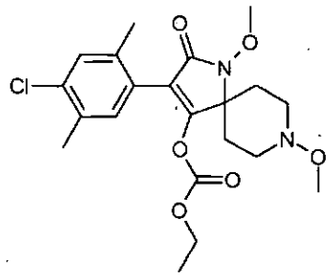
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.10		130-132°C	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 2.05 min
P1.11	 EXAMPLE 3, step 1	154-155°C	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1.79 min
P1.12		78-81°C	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P1.13	 EXAMPLE 5	gum	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min

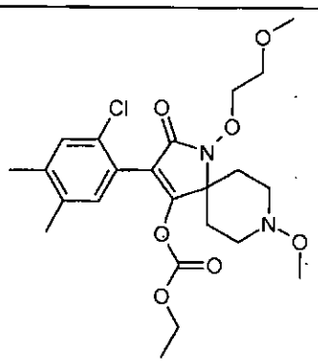
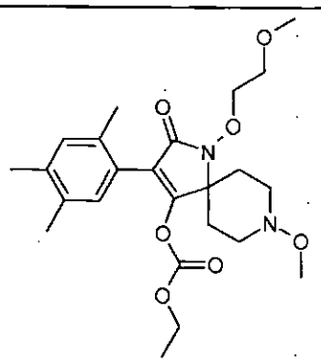
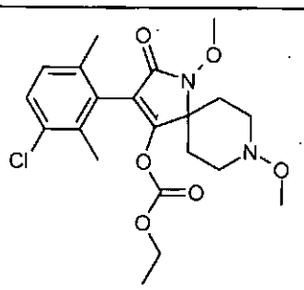
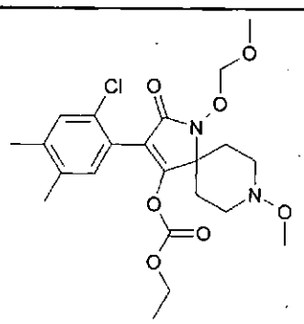
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.14		gum	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2.07 min
P1.15		84-86°C	LC/MS: 433 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min
P1.16		gum	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P1.17		gum	LC/MS: 445 $(M+H)^+$ R_t = 2.04 min

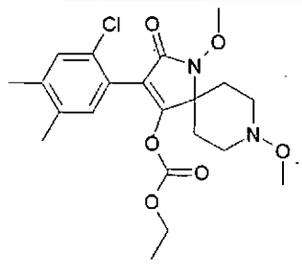
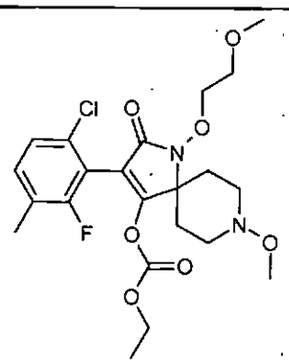
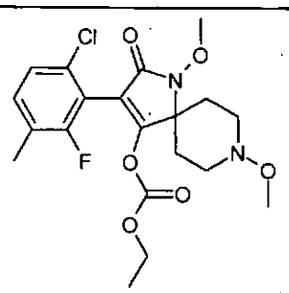
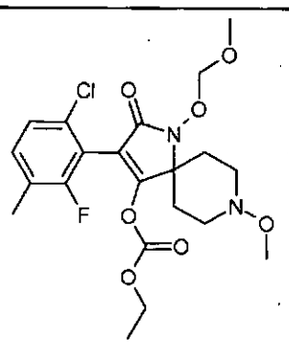
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.18		gum	LC/MS: 459 $(M+H)^+$ R_t = 2.09 min
P1.19		83-85°C	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P1.20		110-113°C	LC/MS: 545/547 $(M+H)^+$ R_t = 2.20 min
P1.21		118-121°C	LC/MS: 499/501 $(M+H)^+$ R_t = 1.96 min

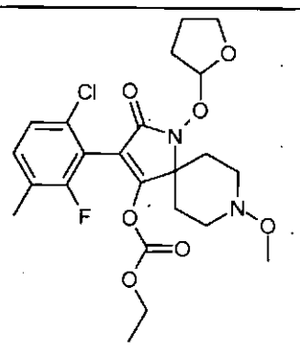
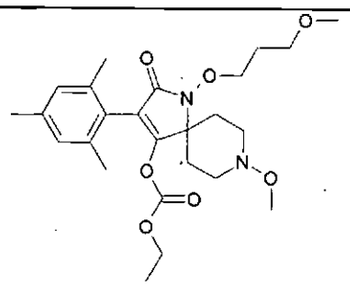
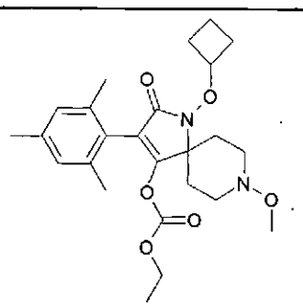
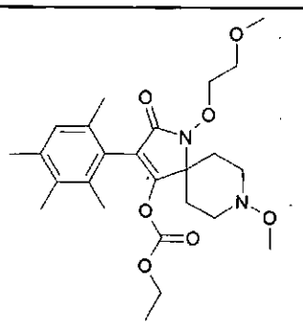
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.22		gum	LC/MS: 531/533 $(M+H)^+$ R_t = 2.15 min
P1.23		132-134°C	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 1.99 min
P1.24		53-55°C	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 2.04 min
P1.25		gum	LC/MS: 533 $(M+H)^+$ R_t = 2.12 min

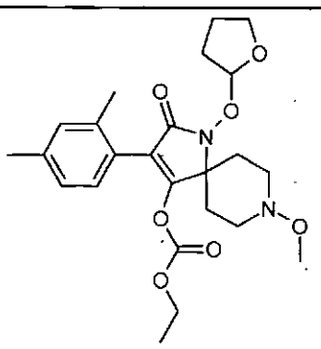
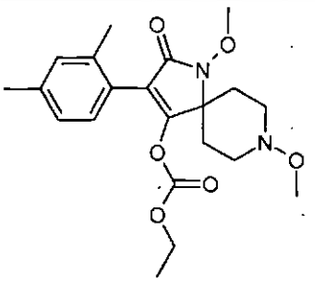
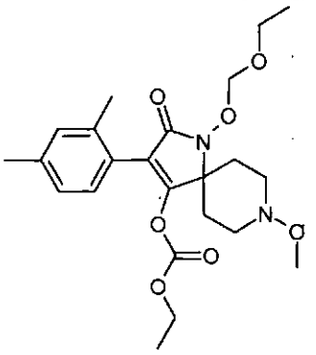
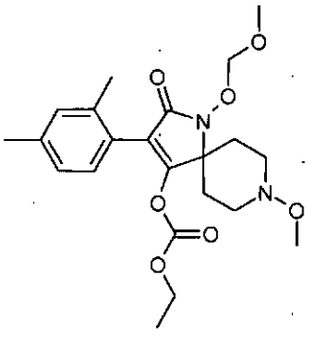
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.26		74-76°C	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 2.10 min
P1.27		57-59°C	LC/MS: 493 $(M+H)^+$ R_t = 1.96 min
P1.28		gum	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2.17 min
P1.29		gum	LC/MS: 443 $(M+H)^+$ R_t = 1.99 min

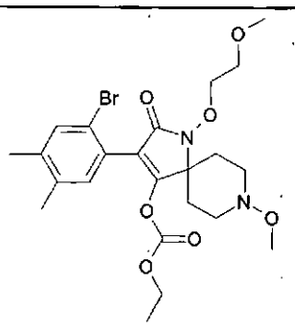
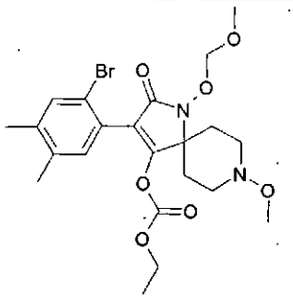
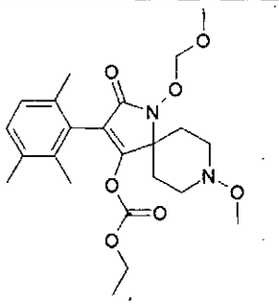
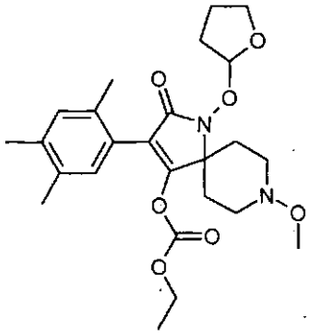
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.30		gum	LC/MS: 487 $(M+H)^+$ R_t = 2.19 min
P1.31		91-93°C	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1.79 min
P1.32		gum	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1.94 min
P1.33		gum	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.93 min
P1.34		gum	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min

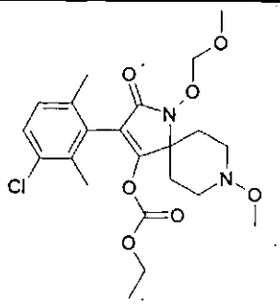
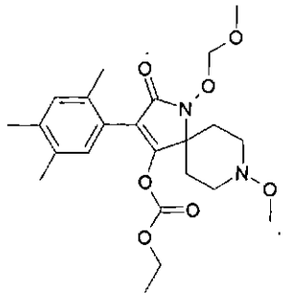
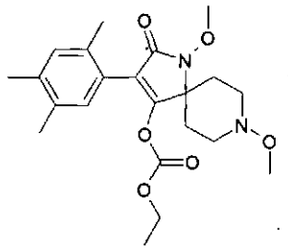
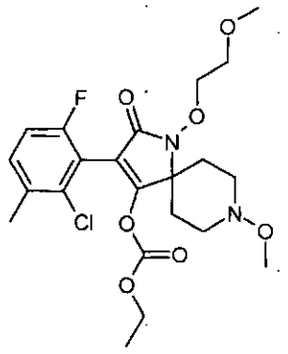
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.35		solid	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.87 min
P1.36		gum	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min
P1.37		gum	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min
P1.38		solid	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1.90 min

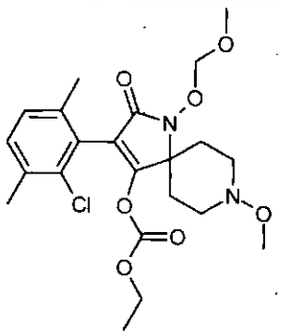
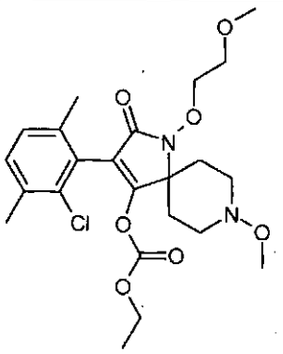
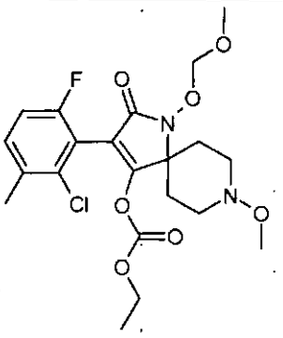
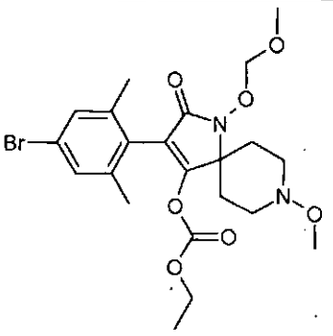
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.39		gum	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1.84 min
P1.40		gum	LC/MS: 487/489 $(M+H)^+$ R_t = 1.84 min
P1.41		solid	LC/MS: 443/445 $(M+H)^+$ R_t = 1.82 min
P1.42		119-123°C	LC/MS: 473/475 $(M+H)^+$ R_t = 1.85 min

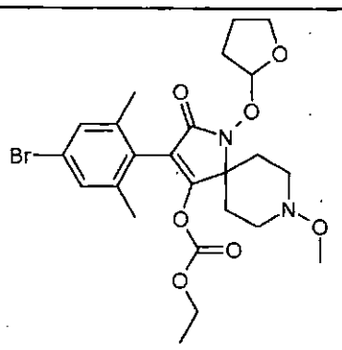
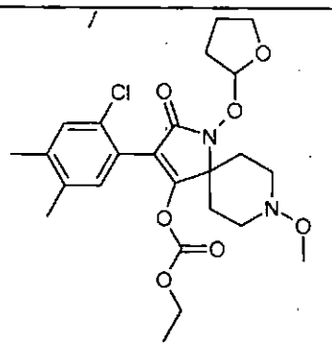
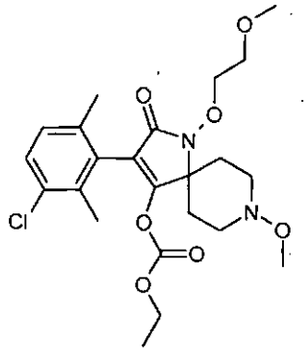
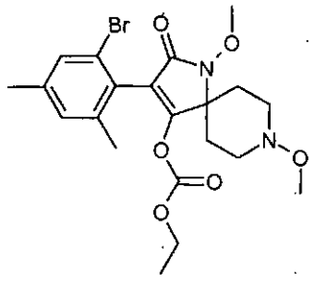
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.43		135-137°C	LC/MS: 499/501 $(M+H)^+$ R_t = 1.89 min
P1.44		122-125°C	LC/MS: 477 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P1.45		gum	LC/MS: 459 $(M+H)^+$ R_t = 2.07 min
P1.46		gum	LC/MS: 477 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min

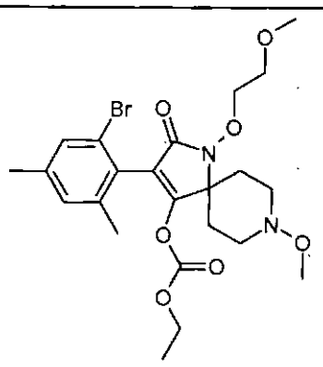
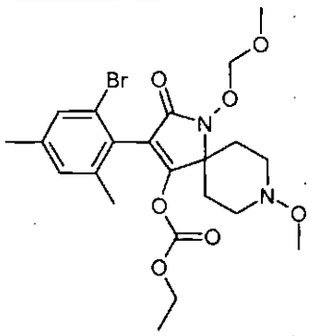
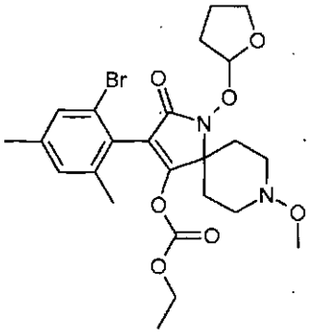
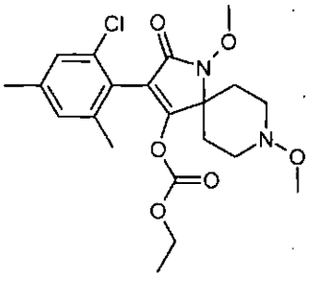
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.47		gum	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1.92 min
P1.48		gum	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1.83 min
P1.49		powder	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P1.50		128-130°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 1.87 min

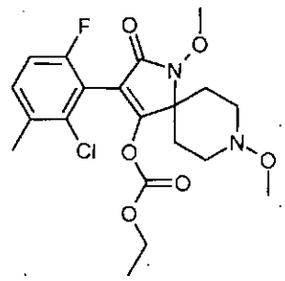
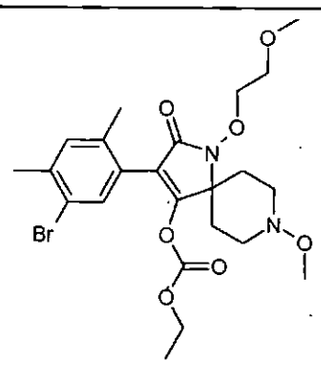
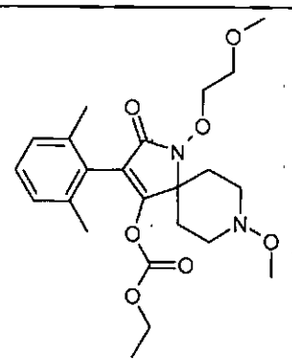
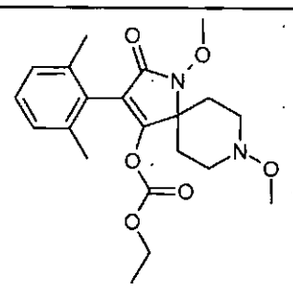
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.51		gum	^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.17 (t, 3H), 2.02-2.31 (br m, total 4H), 2.20 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.91-3.47 (br m, total 4H), 3.43 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.72 (br m, 2H), 4.08 (q, 2H), 4.35 (br m, 2H), 7.06 (s, 1H), 7.35 (s, 1H).
P1.52		gum	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 1.92 min
P1.53		gum	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.90 min
P1.54		gum	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1.96 min

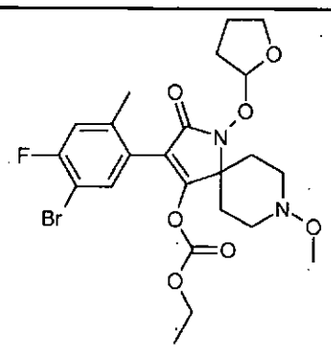
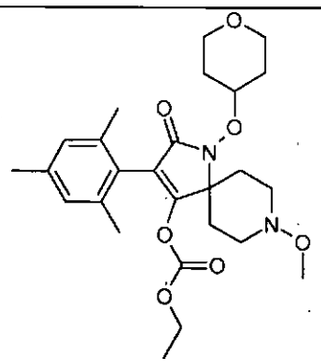
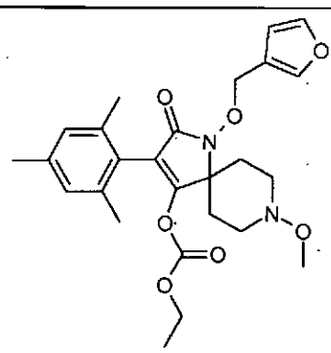
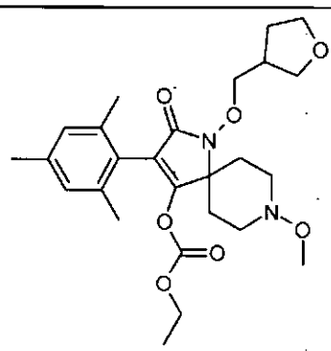
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.55		gum	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1.96 min
P1.56		gum	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.88 min
P1.57		gum	LC/MS: 419 $(M+H)^+$ R_t = 1.90 min
P1.58		gum	LC/MS: 487/489 $(M+H)^+$ R_t = 1.84 min

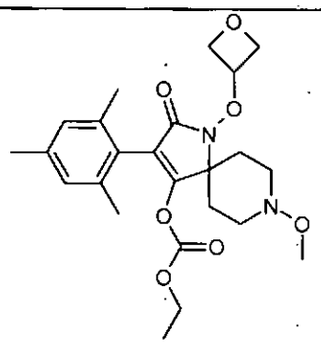
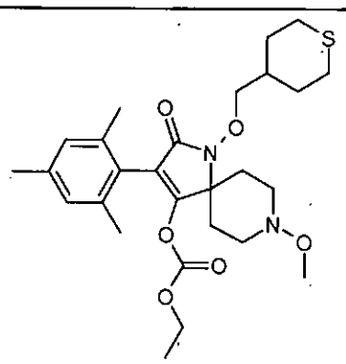
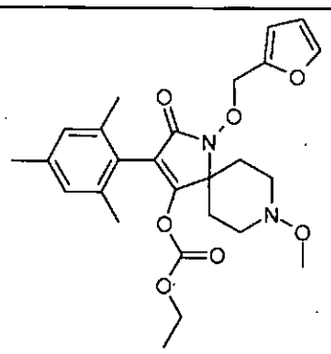
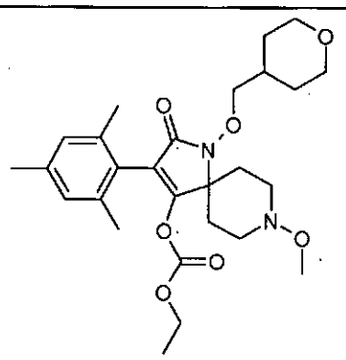
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.59		gum	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1.87 min
P1.60		gum	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.86 min
P1.61		116-119°C	LC/MS: 473/475 $(M+H)^+$ R_t = 1.80 min
P1.62		gum	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 2.01 min

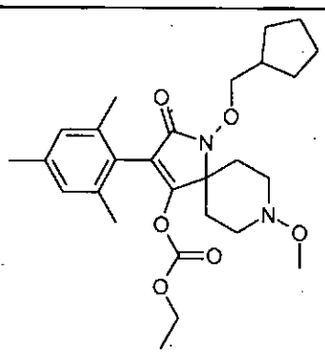
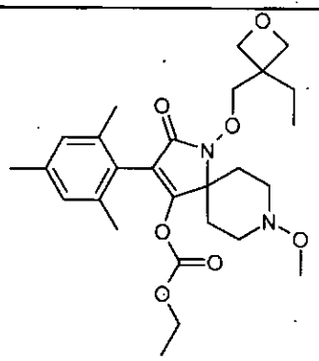
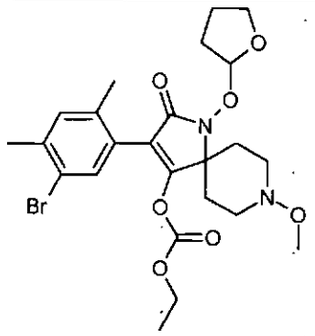
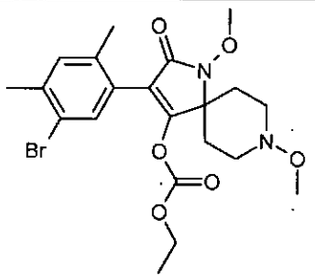
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.63		gum	LC/MS: 539/541 $(M+H)^+$ R_t = 2.01 min
P1.64		gum	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P1.65		gum	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.94 min
P1.66		90-94°C	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.89 min

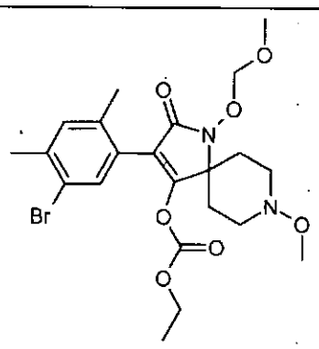
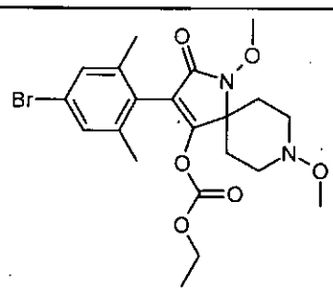
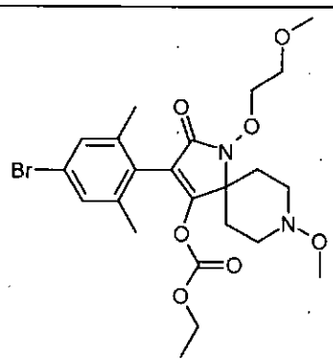
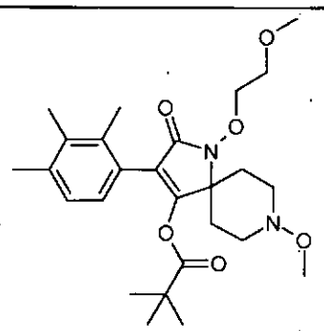
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.67		gum	LC/MS: 527/529 $(M+H)^+$ R_t = 1.92 min
P1.68		gum	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min
P1.69		gum	LC/MS: 539/541 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P1.70		gum	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1.88 min

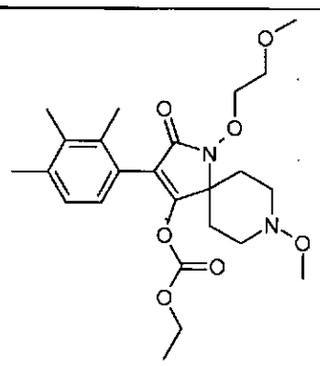
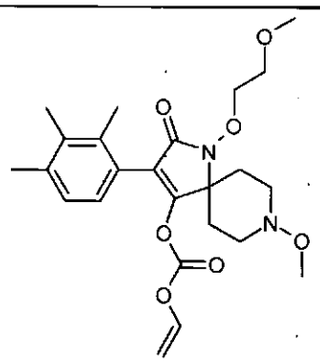
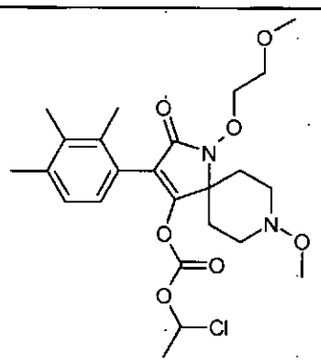
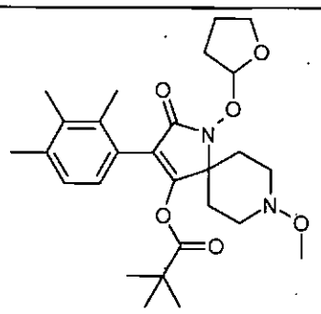
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.71		gum	LC/MS: 443/445 $(M+H)^+$ R_t = 1.79 min
P1.72		gum	LC/MS: 527/529 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P1.73		gum	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.84 min
P1.74		gum	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1.81 min

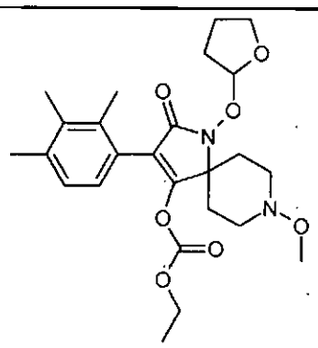
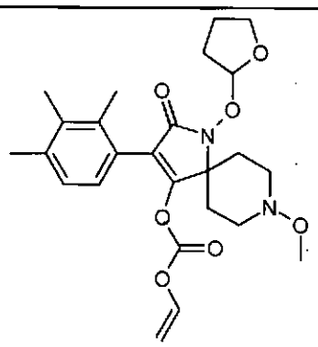
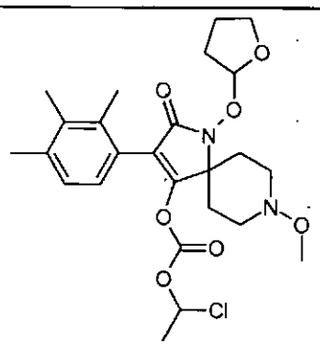
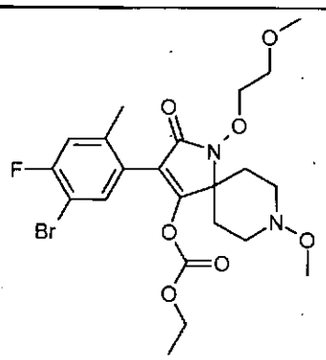
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.75		gum	LC/MS: 543/545 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P1.76		gum	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 1.93 min
P1.77		gum	LC/MS: 485 $(M+H)^+$ R_t = 2.02 min
P1.78		gum	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min

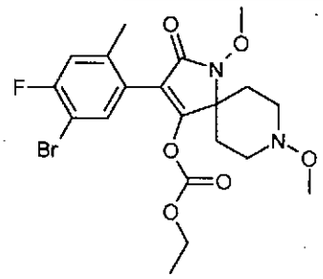
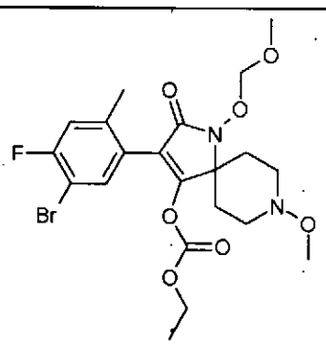
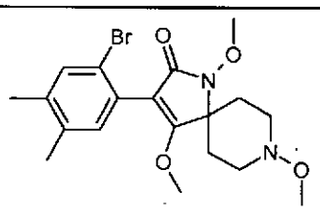
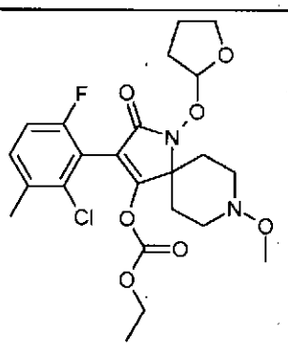
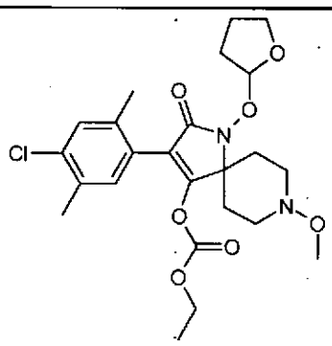
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.79		gum	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1.87 min
P1.80		gum	LC/MS: 519 $(M+H)^+$ R_t = 2.14 min
P1.81		gum	LC/MS: 485 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P1.82		gum	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min

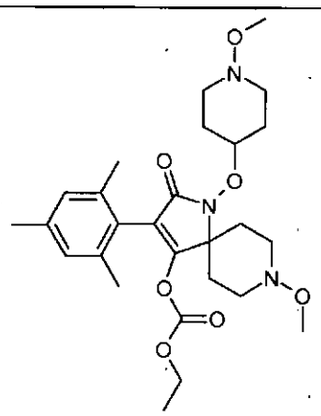
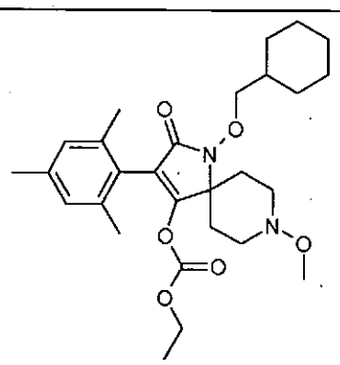
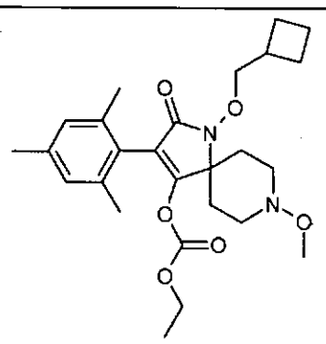
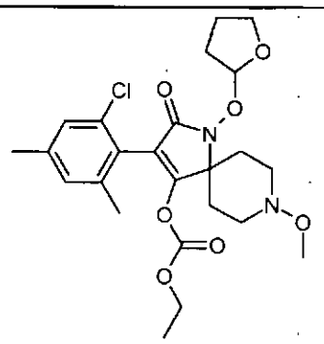
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.83		gum	LC/MS: 487 $(M+H)^+$ R_t = 2.23 min
P1.84		105-107°C	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P1.85		gum	LC/MS: 539/541 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P1.86		gum	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.94 min

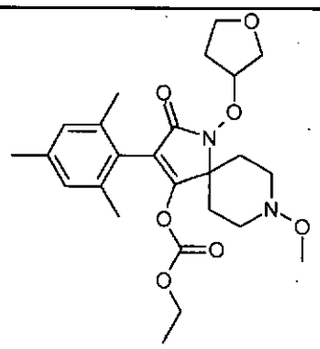
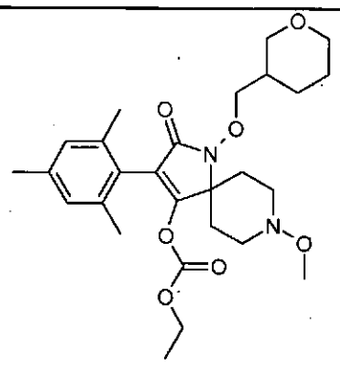
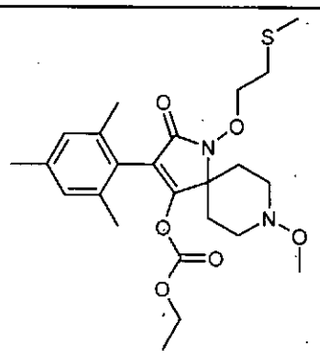
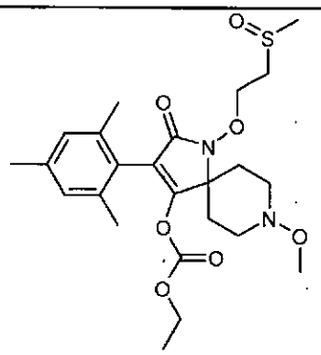
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.87		gum	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P1.88		113-116°C	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.96 min
P1.89		gum	LC/MS: 527/529 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min
P1.90		gum	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 2.05 min

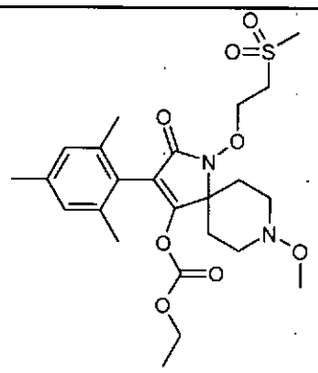
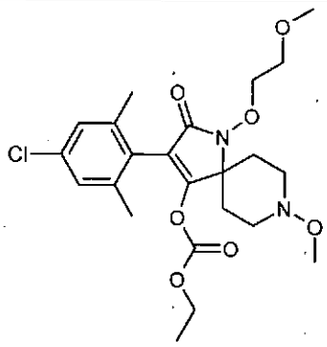
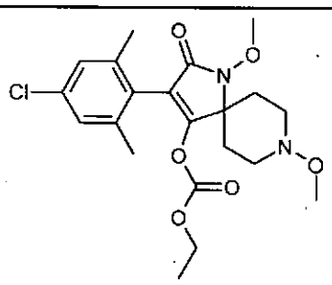
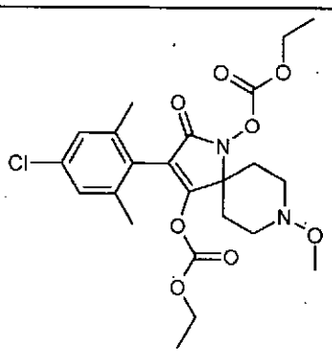
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.91		gum	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1.89 min
P1.92		solid	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P1.93		gum	LC/MS: 497/499 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P1.94		gum	LC/MS: 487 $(M+H)^+$ R_t = 2.12 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.95		gum	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P1.96		gum	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2.00 min
P1.97		gum	LC/MS: 509/511 $(M+H)^+$ R_t = 2.02 min
P1.98		gum	LC/MS: 531/533 $(M+H)^+$ R_t = 1.92 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.99		gum	LC/MS: 487/489 $(M+H)^+$ R_t = 1.93 min
P1.100		gum	LC/MS: 517/519 $(M+H)^+$ R_t = 1.94 min
P1.101		gum	LC/MS: 425/427 $(M+H)^+$ R_t = 1.83 min
P1.102		134-138°C	LC/MS: 499/501 $(M+H)^+$ R_t = 1.90 min
P1.103		gum	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.104		gum	LC/MS: 518 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P1.105		gum	LC/MS: 501 $(M+H)^+$ R_t = 2.26 min
P1.106		gum	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2.15 min
P1.107		gum	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.108		gum	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1.94 min
P1.109		gum	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 2.04 min
P1.110		gum	LC/MS: 479 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P1.111	 EXAMPLE 12	gum	LC/MS: 495 $(M+H)^+$ R_t = 1.74 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.112			
P1.113		gum	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1.94 min
P1.114		122-125°C	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1.92 min
P1.115	 EXAMPLE 10, step 3	gum	LC/MS: 497/499 $(M+H)^+$ R_t = 2.02 min

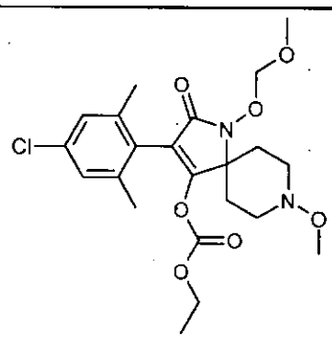
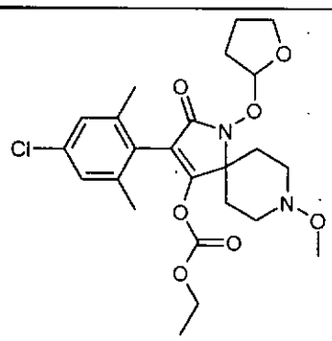
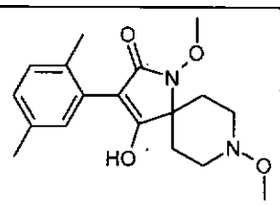
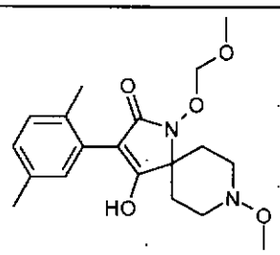
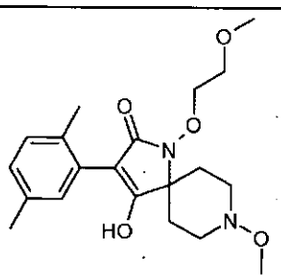
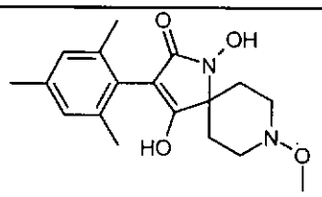
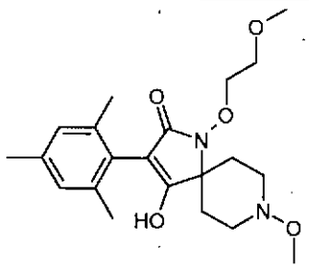
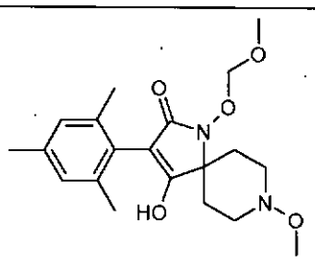
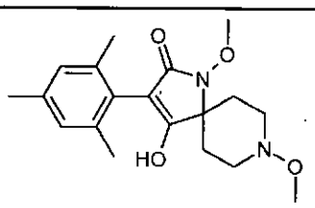
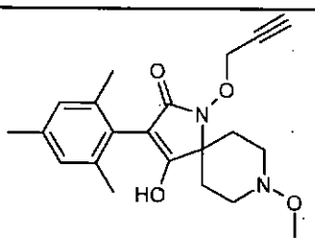
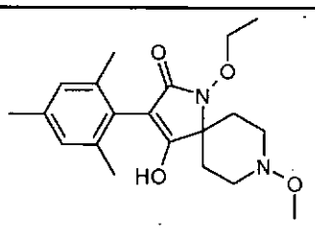
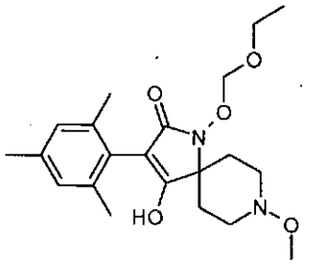
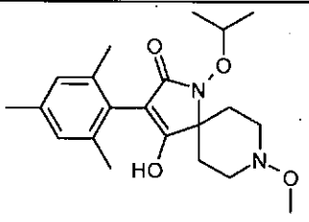
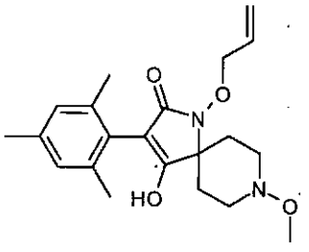
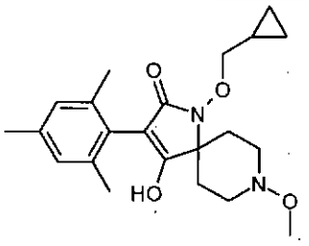
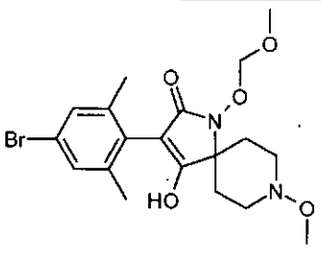
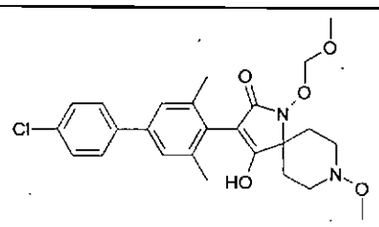
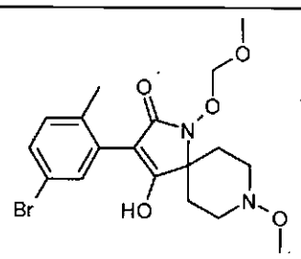
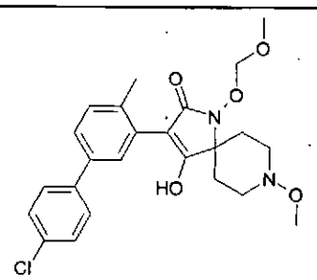
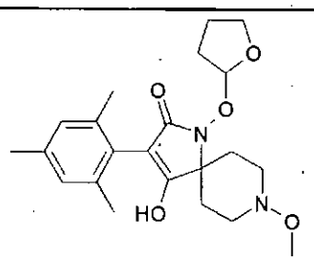
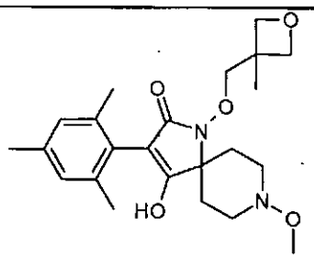
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P1.116		gum	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P1.117		gum	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 2.02 min

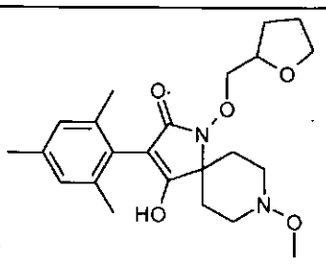
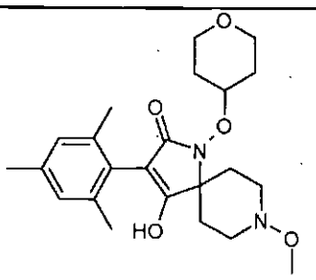
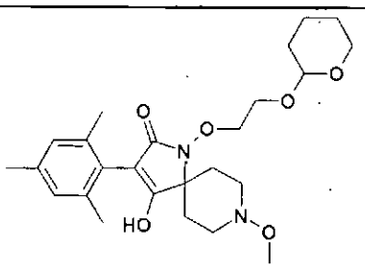
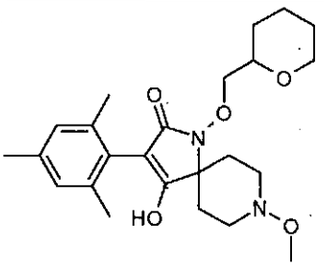
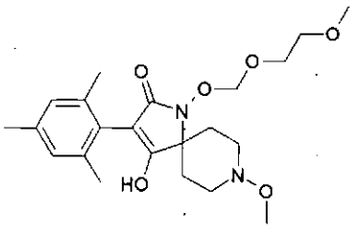
Table P2: Physical data of compounds of formula II:

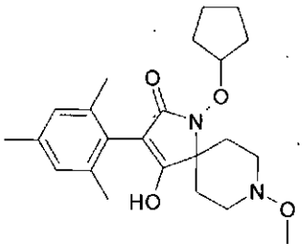
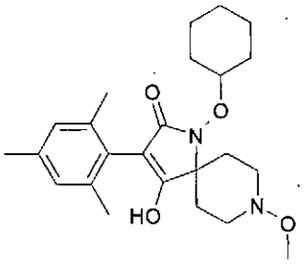
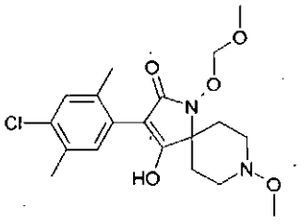
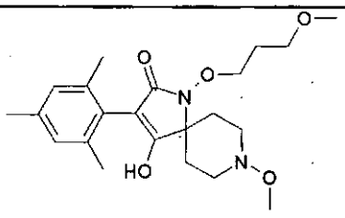
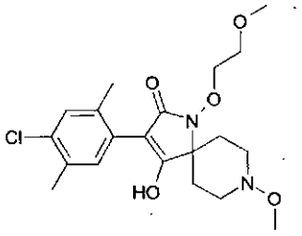
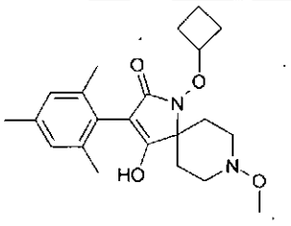
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.1		gum	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1.54 min
P2.2	 EXAMPLE 1, step 5	136-138°C	LC/MS: 363 $(M+H)^+$ R_t = 1.55 min

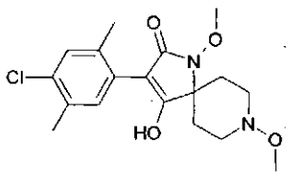
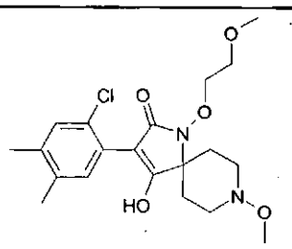
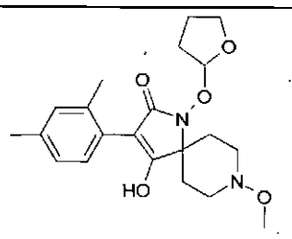
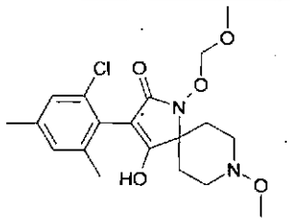
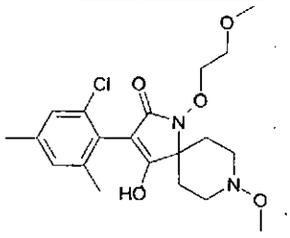
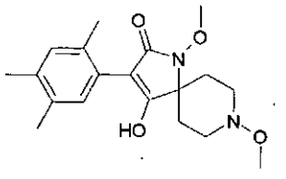
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.3		gum	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1.58 min
P2.4	 EXAMPLE 4	152-154°C	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1.40 min
P2.5		139-142°C	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1.61 min
P2.6		163-165°C	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1.64 min
P2.7		70°C (dec)	LC/MS: 347 $(M+H)^+$ R_t = 1.60 min
P2.8	 EXAMPLE 2, step 2	167-169°C	LC/MS: 371 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min

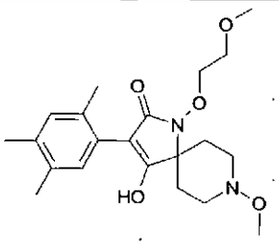
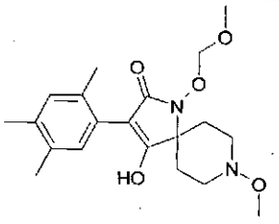
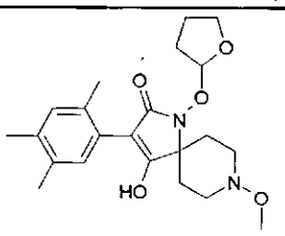
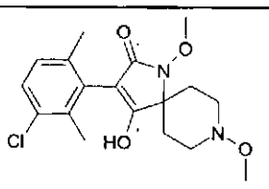
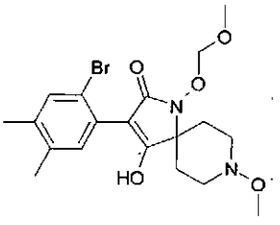
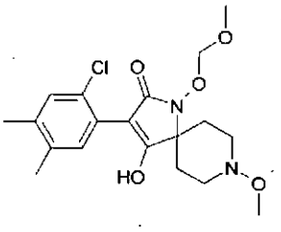
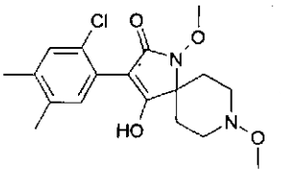
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.9		168-170°C	LC/MS: 361 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P2.10		gum	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1.71 min
P2.11		153-156°C	LC/MS: 375 $(M+H)^+$ R_t = 1.78 min
P2.12		162-164°C	LC/MS: 373 $(M+H)^+$ R_t = 1.73 min
P2.13		150-153°C	LC/MS: 387 $(M+H)^+$ R_t = 1.81 min
P2.14		190-191°C	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min

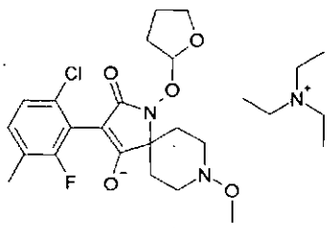
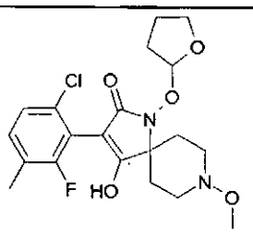
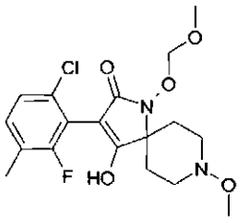
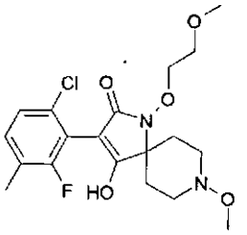
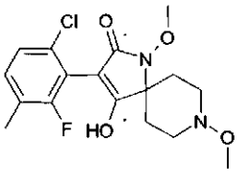
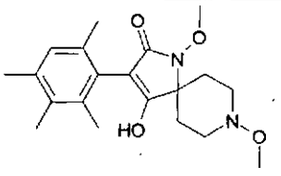
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.15	 EXAMPLE 14	128°C (dec)	LC/MS: 473/475 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min
P2.16		gum	LC/MS: 427/429 $(M+H)^+$ R_t = 1.63 min
P2.17		68-71°C	LC/MS: 459/461 $(M+H)^+$ R_t = 1.93 min
P2.18	 EXAMPLE 7, step 2	144-146°C	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min
P2.19		108-111°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1.68 min

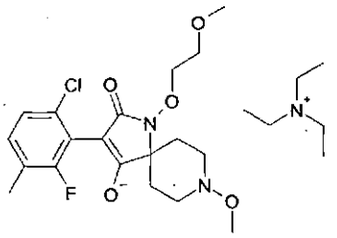
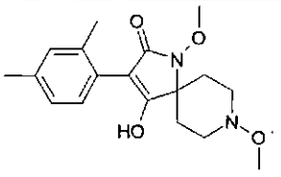
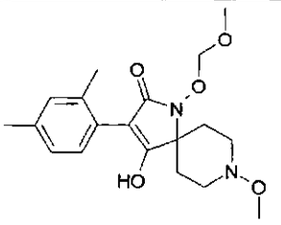
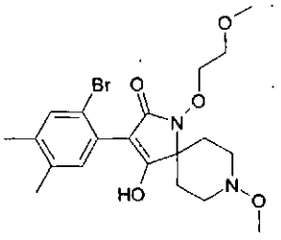
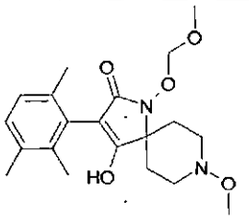
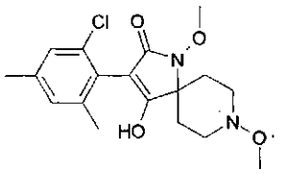
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.20		gum	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1.72 min
P2.21		124-126°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min
P2.22		135-137°C	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1.87 min
P2.23		90-93°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1.81 min
P2.24		98-100°C	LC/MS: 421 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min

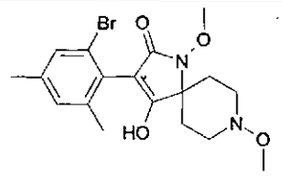
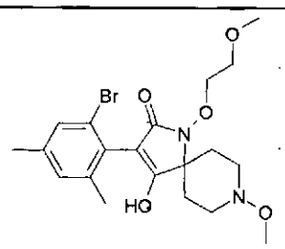
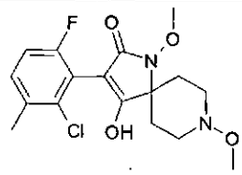
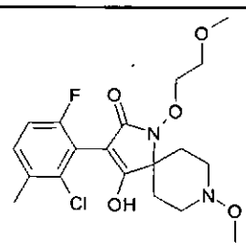
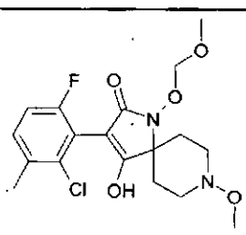
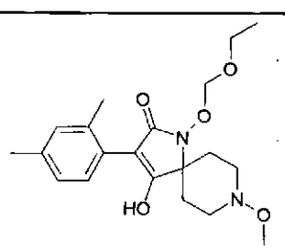
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.25		144-147°C	LC/MS: 401 $(M+H)^+$ R_t = 1.92 min
P2.26	 EXAMPLE 8, step 2	115-118°C	LC/MS: 415 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min
P2.27		139-143°C	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P2.28		128-130°C	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1.69 min
P2.29		49-54°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.68 min
P2.30		gum	LC/MS: 387 $(M+H)^+$ R_t = 1.82 min

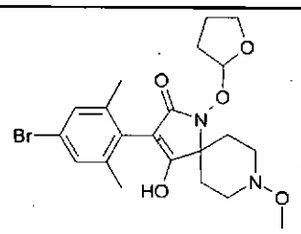
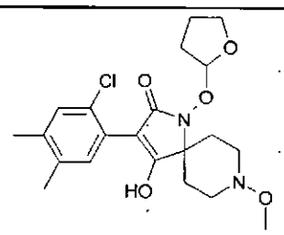
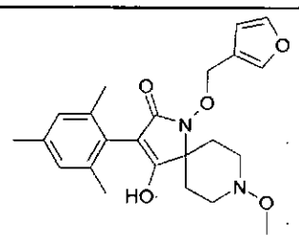
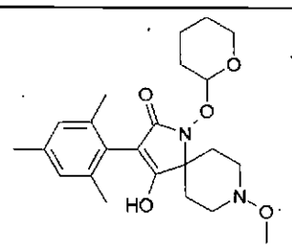
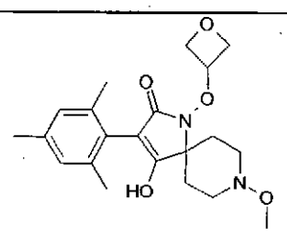
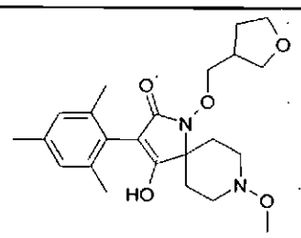
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.31		92-95°C	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1.64 min
P2.32		solid	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min
P2.33		solid	LC/MS: 389 $(M+H)^+$ R_t = 1.63 min
P2.34		79-82°C	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1.55 min
P2.35		161-163°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.55 min
P2.36		gum	LC/MS: 347 $(M+H)^+$ R_t = 1.59 min

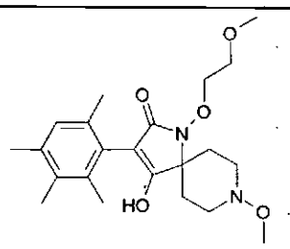
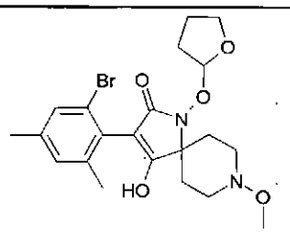
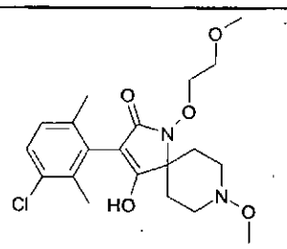
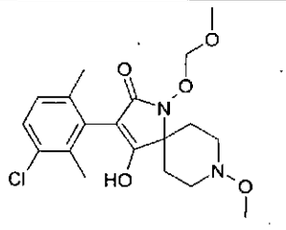
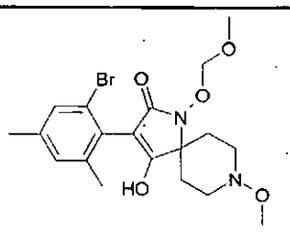
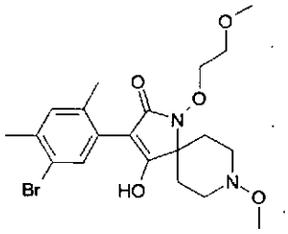
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.37		gum	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1.65 min
P2.38		gum	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1.60 min
P2.39		gum	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1.72 min
P2.40		gum	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1.58 min
P2.41		solid	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1.64 min
P2.42		solid	LC/MS: 395/397 $(M-H)^-$ R_t = 1.64 min
P2.43		solid	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1.64 min

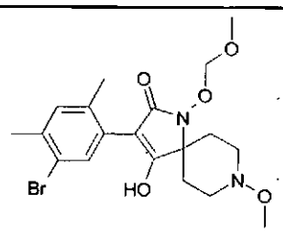
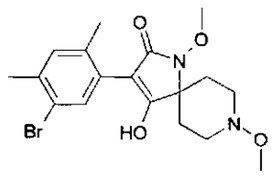
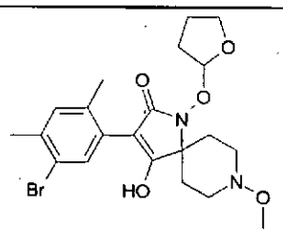
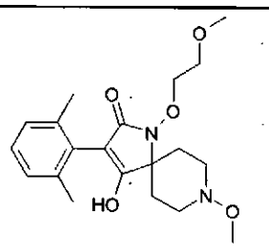
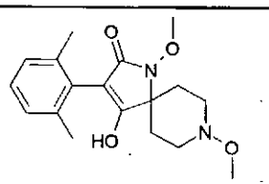
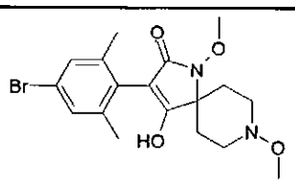
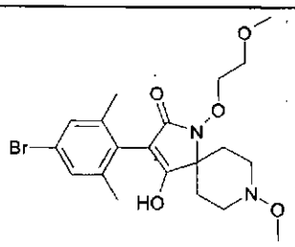
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.44		gum	^{1}H-NMR (CD_3OD, selected signals only): 1.29 (t, 9H, $N(CH_2\boldsymbol{CH_3})_3$), 2.23 (d, $^4J(H,F)$ = 1.9Hz, 3H, mesityl CH_3), 3.17 (q, 6H, $N(\boldsymbol{CH_2}CH_3)_3$), 3.54 (s, 3H, $NOCH_3$), 5.62 (br m, 1H, tetrahydrofuranyl CH).
P2.45		solid	LC/MS: 427/429 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min
P2.46		solid	LC/MS: 401/403 $(M+H)^+$ R_t = 1.54 min
P2.47		gum	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1.57 min
P2.48		solid	LC/MS: 371/373 $(M+H)^+$ R_t = 1.55 min
P2.49		gum	LC/MS: 361 $(M+H)^+$ R_t = 1.63 min

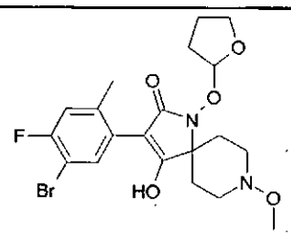
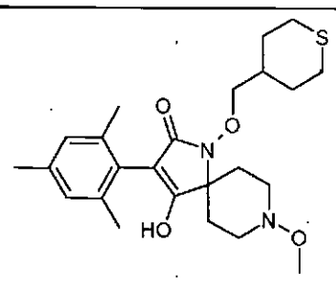
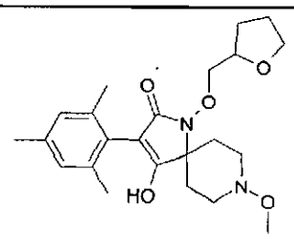
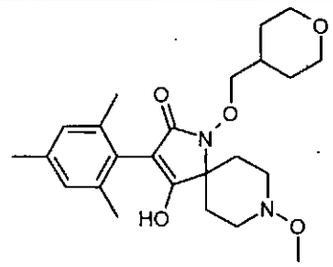
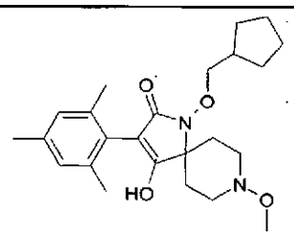
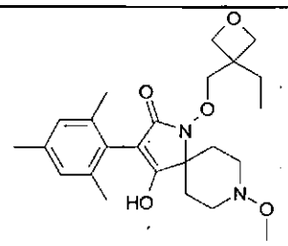
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.50		gum	^{1}H-NMR (CD_3OD, selected signals only): 1.29 (t, 9H, $N(CH_2\boldsymbol{CH_3})_3$), 2.22 (d, $^4J(H,F)$ = 2.2Hz, 3H, mesityl CH_3), 3.17 (q, 6H, $N(\boldsymbol{CH_2}CH_3)_3$), 3.39 (s, 3H, $CH_2CH_2O\boldsymbol{CH_3}$), 3.54 (s, 3H, $NOCH_3$).
P2.51		powder	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1.53 min
P2.52		133-136°C	
P2.53		solid	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P2.54		gum	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1.57 min
P2.55		176-180°C	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1.55 min

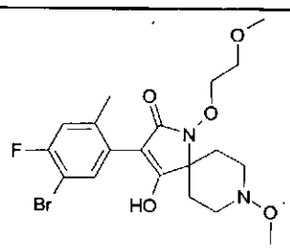
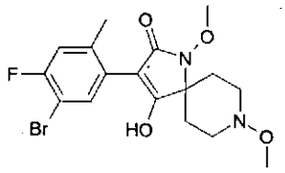
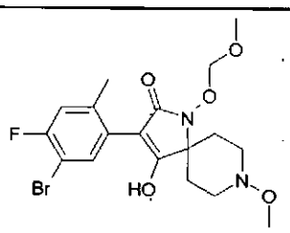
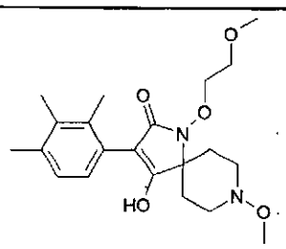
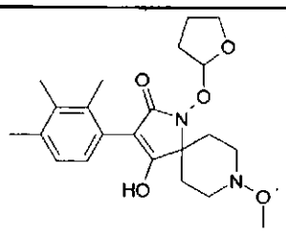
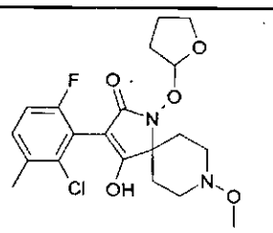
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.56		185-190°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.56 min
P2.57		148-153°C	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1.60 min
P2.58		83-86°C	LC/MS: 371/373 $(M+H)^+$ R_t = 1.52 min
P2.59		55-57°C	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1.53 min
P2.60		155-158°C	LC/MS: 401/403 $(M+H)^+$ R_t = 1.51 min
P2.61		powder	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min

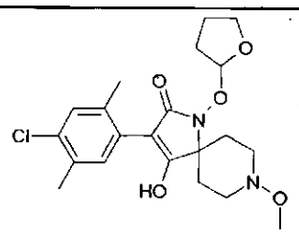
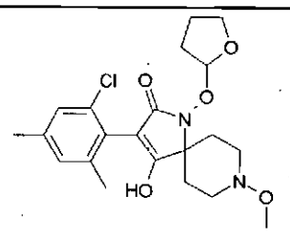
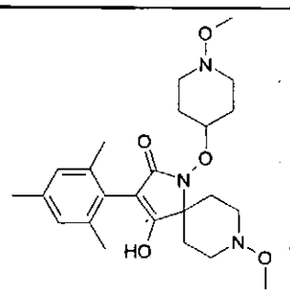
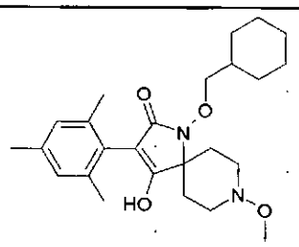
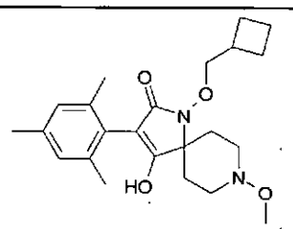
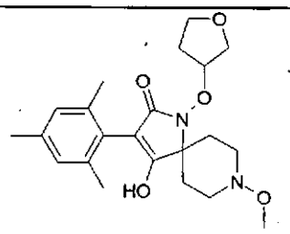
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.62		91-92°C	LC/MS: 467/469 $(M+H)^+$ R_t = 1.71 min
P2.63		84-85°C	LC/MS: 423/425 $(M+H)^+$ R_t = 1.71 min
P2.64		154-157°C	LC/MS: 413 $(M+H)^+$ R_t = 1.77 min
P2.65		103-106°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1.77 min
P2.66		88-91°C	LC/MS: 389 $(M+H)^+$ R_t = 1.54 min
P2.67		69-72°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1.64 min

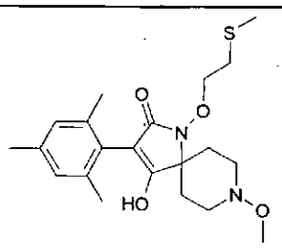
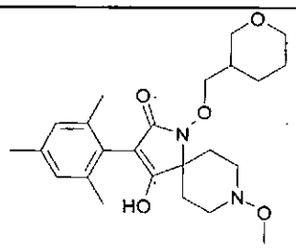
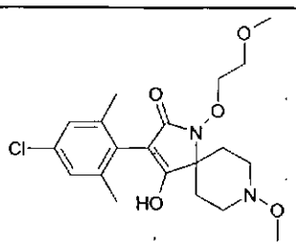
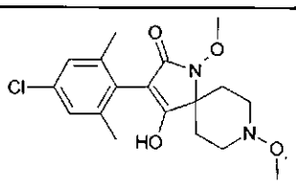
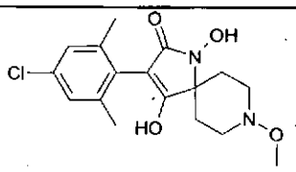
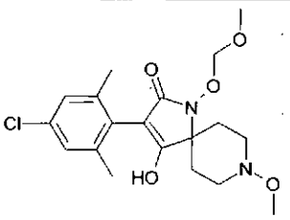
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.68		gum	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1.65 min
P2.69		gum	LC/MS: 467/469 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min
P2.70		gum	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.61 min
P2.71		gum	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1.60 min
P2.72		167-171°C	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1.58 min
P2.73		63-64°C	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1.72 min

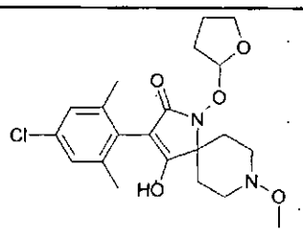
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.74		79-80°C	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1.70 min
P2.75		86-87°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.69 min
P2.76		96-97°C	LC/MS: 467/469 $(M+H)^+$ R_t = 1.78 min
P2.77		141-144°C	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1.49 min
P2.78		153-155°C	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1.44 min
P2.79		188-191°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.63 min
P2.80		163-167°C	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.81		gum	LC/MS: 471/473 $(M+H)^+$ R_t = 1.70 min
P2.82		95-98°C	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 1.89 min
P2.83		155-157°C	LC/MS: 413 $(M+H)^+$ R_t = 1.75 min
P2.84		100-103°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1.70 min
P2.85		74-77°C	LC/MS: 415 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min
P2.86		88-91°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.87		71-74°C	LC/MS: 459/461 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min
P2.88		solid	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1.63 min
P2.89		64-67°C	LC/MS: 445/447 $(M+H)^+$ R_t = 1.65 min
P2.90		solid	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min
P2.91		foam	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1.68 min
P2.92		86-89°C	LC/MS: 427/429 $(M+H)^+$ R_t = 1.61 min

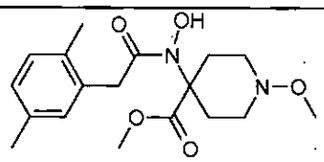
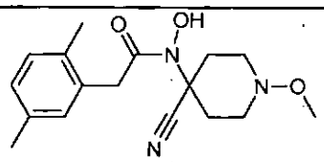
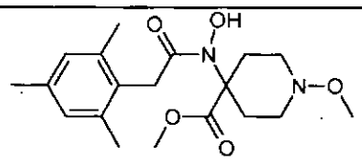
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.93		88-91°C	LC/MS: 423/425 $(M+H)^+$ R_t = 1.74 min
P2.94		84-88°C	LC/MS: 423/425 $(M+H)^+$ R_t = 1.63 min
P2.95		solid	LC/MS: 446 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min
P2.96		169-172°C	LC/MS: 429 $(M+H)^+$ R_t = 2.05 min
P2.97		113-115°C	LC/MS: 401 $(M+H)^+$ R_t = 1.89 min
P2.98		135-138°C	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1.57 min

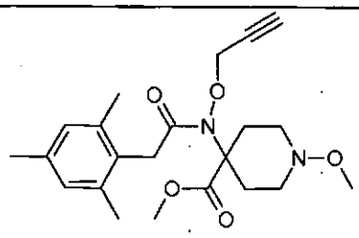
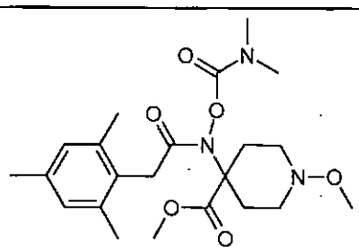
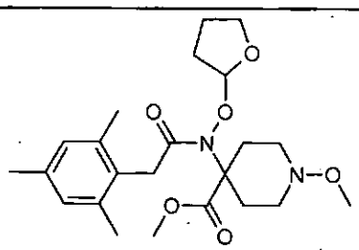
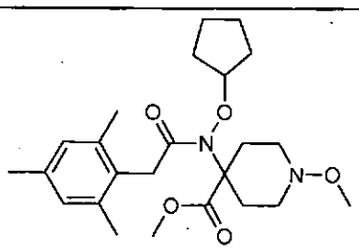
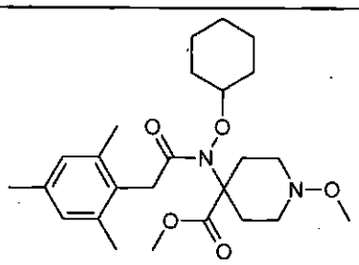
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.99		113-115°C	LC/MS: 407 $(M+H)^+$ R_t = 1.72 min
P2.100		98-101°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1.72 min
P2.101		161-164°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1.63 min
P2.102		88-92°C	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1.58 min
P2.103	 EXAMPLE 10, step 2	solid	LC/MS: 353/355 $(M+H)^+$ R_t = 1.37 min
P2.104		176-178°C	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1.64 min

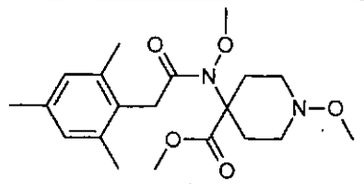
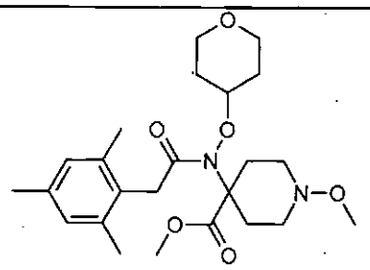
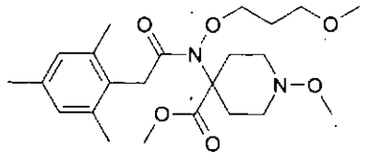
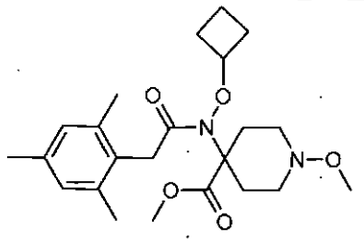
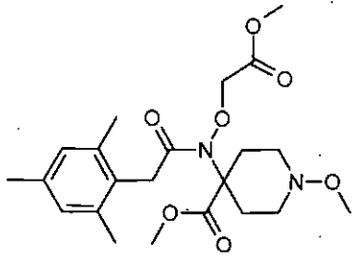
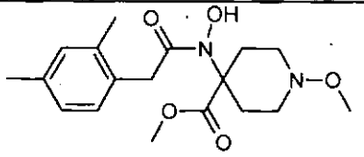
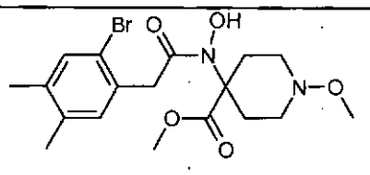
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P2.105		137-139°C	LC/MS: 421/423 $(M-H)^-$ R_t = 1.69 min

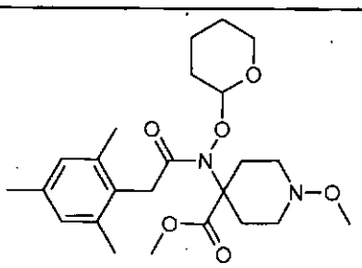
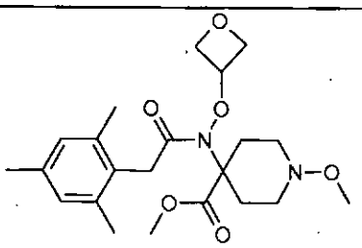
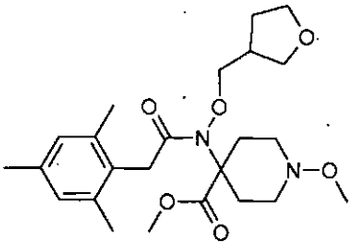
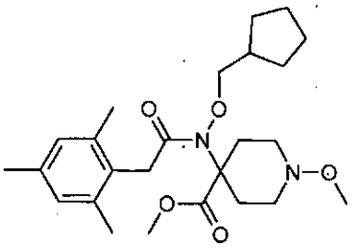
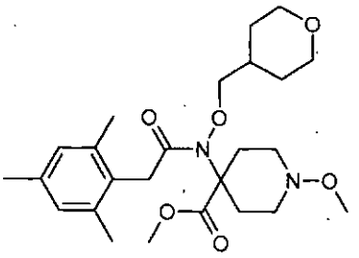
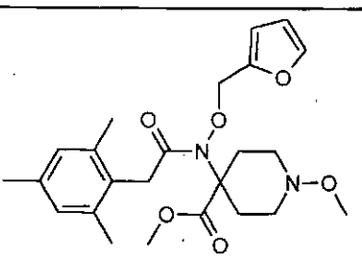
Intermediates of the formula IV or X from Table P3 can be prepared by analogous procedures.

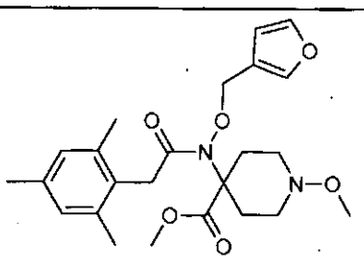
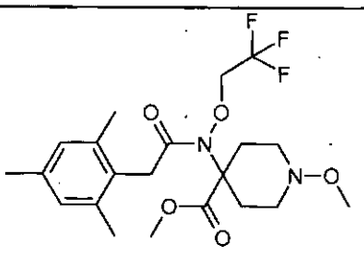
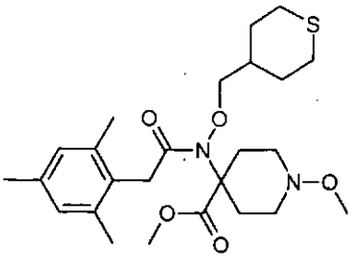
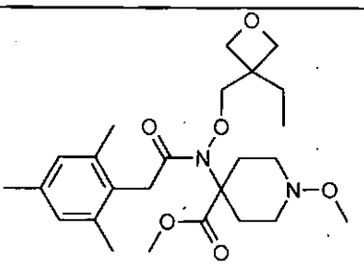
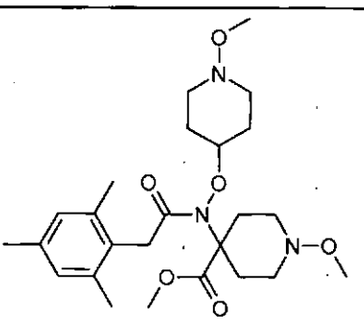
Table P3: Physical data of intermediates of formula IV or X:

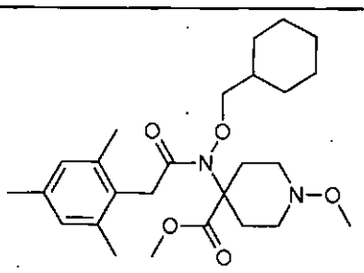
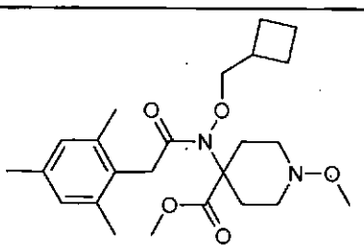
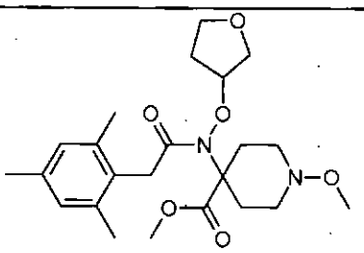
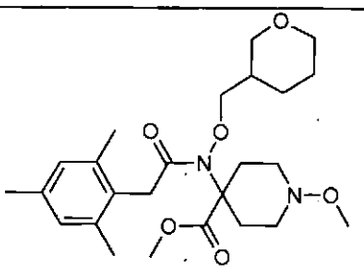
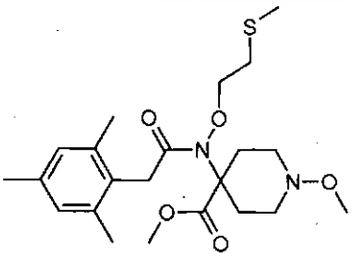
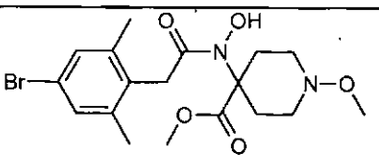
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.1	 EXAMPLE 1, step 4 EXAMPLE 6, step 2	140-142°C	LC/MS: 351 $(M+H)^+$ R_t = 1.59 min
P3.2	 EXAMPLE 6, step 1	153-156°C	LC/MS: 318 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min
P3.3		199-200°C	LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1.68 min

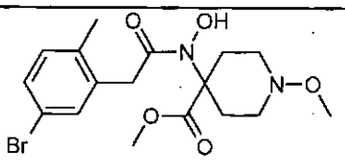
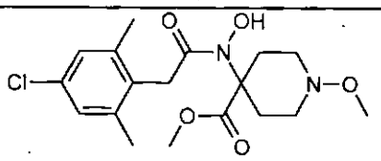
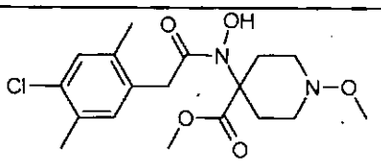
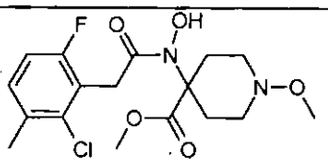
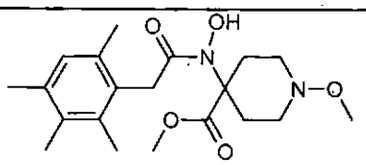
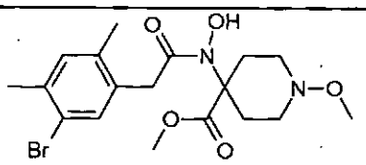
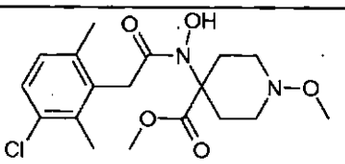
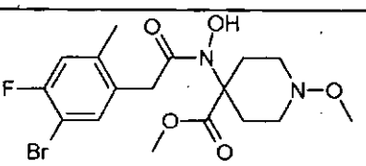
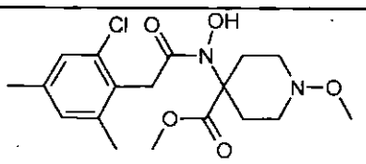
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.4	 EXAMPLE 2, step 1	108-110°C	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min
P3.5		gum	LC/MS: 436 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min
P3.6	 EXAMPLE 7, step 1	107-109°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P3.7		gum	LC/MS: 433 $(M+H)^+$ R_t = 2.19 min
P3.8	 EXAMPLE 8, step 1	gum	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2.23 min

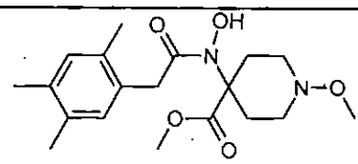
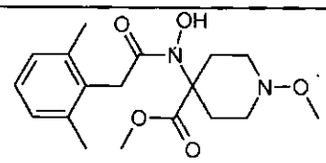
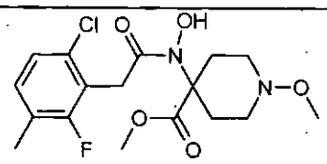
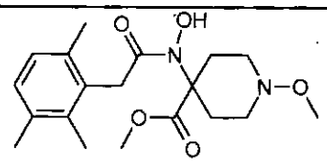
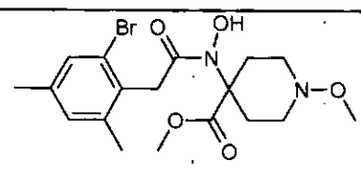
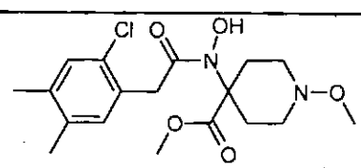
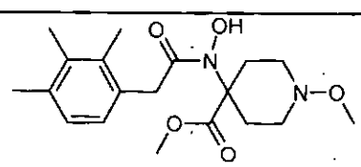
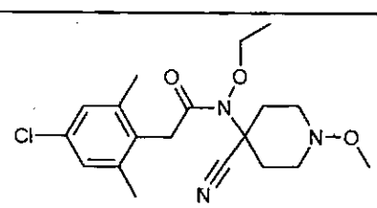
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.9		gum	LC/MS: 379 $(M+H)^+$ R_t = 1.89 min
P3.10		gum	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.89 min
P3.11		55-57°C	LC/MS: 437 $(M+H)^+$ R_t = 1.95 min
P3.12		gum	LC/MS: 419 $(M+H)^+$ R_t = 2.09 min
P3.13		gum	LC/MS: 437 $(M+H)^+$ R_t = 1.86 min
P3.14		solid	LC/MS: 351 $(M+H)^+$ R_t = 1.59 min
P3.15		166-167°C	LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1.71 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.16		gum	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 2.08 min
P3.17		gum	LC/MS: 421 $(M+H)^+$ R_t = 1.80 min
P3.18		gum	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1.88 min
P3.19		gum	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2.25 min
P3.20		gum	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1.93 min
P3.21		gum	LC/MS: 445 $(M+H)^+$ R_t = 2.05 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.22		gum	LC/MS: 445 $(M+H)^+$ R_t = 1.98 min
P3.23		gum	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P3.24		gum	LC/MS: 479 $(M+H)^+$ R_t = 2.10 min
P3.25		gum	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1.94 min
P3.26	 EXAMPLE 9, step 2	gum	LC/MS: 478 $(M+H)^+$ R_t = 1.97 min

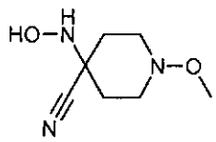
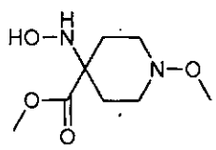
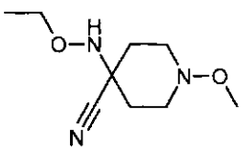
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.27		gum	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 2.31 min
P3.28		gum	LC/MS: 433 $(M+H)^+$ R_t = 2.17 min
P3.29		115-117°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 1.85 min
P3.30		gum	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 2.01 min
P3.31		gum	LC/MS: 439 $(M+H)^+$ R_t = 2.03 min
P3.32		solid	LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1.73 min

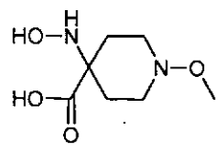
Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.33		solid	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P3.34	 EXAMPLE 10, step 1	228-231°C	LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1.71 min
P3.35			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1.86 min
P3.36			LC/MS: 389/391 $(M+H)^+$ R_t = 1.59 min
P3.37			LC/MS: 379 $(M+H)^+$ R_t = 1.91 min
P3.38		162-163°C	LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1.76 min
P3.39			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P3.40			LC/MS: 433/435 $(M+H)^+$ R_t = 1.69 min
P3.41			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1.69 min

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P3.42			LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P3.43			LC/MS: 351 $(M+H)^+$ R_t = 1.55 min
P3.44			LC/MS: 389/391 $(M+H)^+$ R_t = 1.62 min
P3.45			LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1.66 min
P3.46			LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1.67 min
P3.47			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1.71 min
P3.48			LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1.65 min
P3.49	 EXAMPLE 13, step 3	100-103°C	LC/MS: 380/382 $(M+H)^+$ R_t = 1.99 min

Intermediates of the formula V or VII from Table P4 can be prepared by analogous procedures.

Table P4: Physical data of intermediates of formula V or VII or XI:

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P4.1	 EXAMPLE 1, step 2	130-131°C	^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.55-2.35 (br signals, total 4H), 2.60-3.45 (br signals, total 4H), 3.52 (s, 3H), 5.19 (br s, 1H) , 5.42 (br s, 1H). IR (CN): ν 2227.8 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 172 $(M+H)^+$; R_t = 0.31 min.
P4.2	 EXAMPLE 1, step 3	Oil	^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.50-2.40 (br signals, total 4H), 2.76 (br m, 2H), 3.01-3.32 (br m, 2H), 3.52 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.58 (br s, 2H). IR (COOMe): ν 1731.3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 205 $(M+H)^+$; R_t = 0.31 min.
P4.3	 EXAMPLE 13, step 2	Oil	^{1}H-NMR ($CDCl_3$): 1.19 (t, 3H), 1.59-2.29 (br signals, total 4H), 2.64-3.43 (br signals, total 4H), 3.52 (s, 3H), 3.80 (q, 2H), 5.37 (br s, 1H). IR (CN): ν 2235.3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 200 $(M+H)^+$; R_t = 1.21 min.

Compound No.	Structures	Melting Point	MS/NMR
P4.4	 example 15, step 1	180°C	1H-NMR (CD3OD): 1.54-2.29 (br signals, total 4H), 2.82 (br m, 2H), 3.07-3.26 (br signals, total 2H), 3.49 (s, 3H). LC/MS (ES+): 191 (M+H)+; Rt = 0.22 min.

FORMULATION EXAMPLES (% = percent by weight)

Example F1: Emulsion concentrates	a)	b)	c)
Active ingredient	25 %	40 %	50 %
Calcium dodecylbenzenesulfonate	5 %	8 %	6 %
Castor oil polyethylene glycol ether (36 mol of EO)	5 %	-	-
Tributylphenoxypolyethylene glycol ether (30 mol of EO)	-	12 %	4 %
Cyclohexanone	-	15 %	20 %
Xylene mixture	65 %	25 %	20 %

Emulsions of any desired concentration can be prepared from such concentrates by dilution with water.

Example F2: Solutions	a)	b)	c)	d)
Active ingredient	80 %	10 %	5 %	95 %
Ethylene glycol monomethyl ether	20 %	-	-	-
Polyethylene glycol MW 400	-	70 %	-	-
N-Methylpyrrolid-2-one	-	20 %	-	-
Epoxidized coconut oil	-	-	1 %	5 %
Petroleum ether (boiling range: 160-190°)	-	-	94 %	-

The solutions are suitable for use in the form of microdrops.

Example F3: Granules	a)	b)	c)	d)
Active ingredient	5 %	10 %	8 %	21 %
Kaolin	94 %	-	79 %	54 %
Highly disperse silica	1 %	-	13 %	7 %
Attapulgite	-	90 %	-	18 %

The active ingredient is dissolved in dichloromethane, the solution is sprayed onto the carrier(s), and the solvent is subsequently evaporated in vacuo.

Example F4: Dusts	a)	b)
Active ingredient	2 %	5 %
Highly disperse silica	1 %	5 %
Talc	97 %	-
Kaolin	-	90 %

Ready-to-use dusts are obtained by intimately mixing the carriers and the active ingredient.

Example F5: Wettable powders	a)	b)	c)
Active ingredient	25 %	50 %	75 %
Sodium lignosulfonate	5 %	5 %	-
Sodium lauryl sulfate	3 %	-	5 %
Sodium diisobutylnaphthalenesulfonate	-	6 %	10 %
Octylphenoxypolyethylene glycol ether (7-8 mol of EO)	-	2 %	-
Highly disperse silica	5 %	10 %	10 %
Kaolin	62 %	27 %	-

The active ingredient is mixed with the additives and the mixture is ground thoroughly in a suitable mill. This gives wettable powders, which can be diluted with water to give suspensions of any desired concentration.

Example F6: Extruder granules	
Active ingredient	10 %
Sodium lignosulfonate	2 %

Carboxymethylcellulose	1 %
Kaolin	87 %

The active ingredient is mixed with the additives, and the mixture is ground, moistened with water, extruded, granulated and dried in a stream of air.

Example F7: Coated granules

Active ingredient	3 %
Polyethylene glycol (MW 200)	3 %
Kaolin	94 %

In a mixer, the finely ground active ingredient is applied uniformLy to the kaolin, which has been moistened with the polyethylene glycol. This gives dust-free coated granules.

Example F8a: Suspension concentrate

Active ingredient	40 %
Ethylene glycol	10 %
Nonylphenoxypolyethylene glycol ether (15 mol of EO)	6 %
Sodium lignosulfonate	10 %
Carboxymethylcellulose	1 %
37 % aqueous formaldehyde solution	0.2 %
Silicone oil (75 % aqueous emulsion)	0.8 %
Water	32 %

Example F8b: Suspension concentrate

Active ingredient	10%
Naphthalenesulfonic acid, sodium salt condensed with formaldehyde	2%
Solution of an acrylic graft copolymer in water and propyleneglycole	8%
Silicone antifoam emulsion	0.5%
DL-propanediol-(1,2)	3%
Heteropolysaccharide	0.5%
1,2-Benzisothiazol-3-one	0.2%
Water	75.8%

The finely ground active ingredient is mixed intimately with the additives. Suspensions of any desired concentration can be prepared from the thus resulting suspension concentrate by dilution with water.

Example F9: Powders for dry seed treatment	a)	b)	c)
active ingredient	25 %	50 %	75 %
light mineral oil	5 %	5 %	5 %
highly dispersed silicic acid	5 %	5 %	-
Kaolin	65 %	40 %	-
Talcum	-		20 %

The active ingredient is thoroughly mixed with the adjuvants and the mixture is thoroughly ground in a suitable mill, affording powders that can be used directly for seed treatment.

Example F10: Flowable concentrate for seed treatment	
active ingredient	40 %
propylene glycol	5 %
copolymer butanol PO/EO	2 %
tristyrenephenole with 10-20 moles EO	2 %
1,2-benzisothiazolin-3-one (in the form of a 20% solution in water)	0.5 %
monoazo-pigment calcium salt	5 %
Silicone oil (in the form of a 75 % emulsion in water)	0.2 %
Water	45.3 %

The finely ground active ingredient is intimately mixed with the adjuvants, giving a suspension concentrate from which suspensions of any desired dilution can be obtained by dilution with water. Using such dilutions, living plants as well as plant propagation material can be treated and protected against infestation by microorganisms, by spraying, pouring or immersion.

Example F11a: Oil-based suspension concentrate (based on a vegetable oil)	
Active ingredient	10%
Tristyrylphenole with 16 moles EO	10%
Block copolymer of polyhydroxystearic acid and polyalkylene glycols	2%

AEROSIL 200	1%
Rape seed oil methyl ester	12%
Oleic acid	65%

Example F11b: Oil-based suspension concentrate (based on a mineral oil)

Active ingredient	10%
Ethoxylated alcohols, C16-18 and C18-unsatd	5%
Dodecyl-benzene sulfonic acid Ca-salt linear	2.5%
2-Pyrrolidinone, 1-ethenylhexadecyl-, homopolymer	1%
Organophilic clay	1%
Mixture of petroleum	80.5%

The finely ground active ingredient is mixed intimately with the additives. Suspensions of any desired concentration can be prepared from the thus resulting suspension concentrate by dilution with water.

Preferably, the term "active ingredient" used above refers to one of the compounds selected from Tables 1 to 102 shown above. It also refers to mixtures of the compound of formula I, in particular a compound selected from said Tables 1 to 102, with other insecticides, fungicides, herbicides, safeners, adjuvants and the like, which mixtures are specifically disclosed above.

BIOLOGICAL EXAMPLES

These examples illustrate the pesticidal/insecticidal properties of compounds of formula I.

Example B1: Activity against *Myzus persicae* (green peach aphid)
(mixed population, feeding/residual contact activity; preventive)
Sunflower leaf discs are placed on agar in a 24-well microtiter plate and sprayed with test solutions. After drying, the leaf discs are infested with an aphid population of mixed ages. After an incubation period of 6 days, samples are checked for mortality and special effects (e.g. phytotoxicity).
In this test, compounds listed in the Tables P1 and P2 above show good activity. In particular compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.12, P1.15, P1.18, P1.19, P1.20, P1.22, P1.24, P1.26, P1.27, P1.29, P1.30, P1.33, P1.34,

P1.35, P1.36, P1.37, P1.38, P1.39, P1.44, P1.45, P1.47, P1.48, P1.49, P1.50, P1.54, P1.55, P1.56, P1.57, P1.59, P1.60, P1.62, P1.63, P1.66, P1.67, P1.68, P1.69, P1.70, P1.73, P1.74, P1.81, P1.82, P1.88, P1.89, P1.103, P1.106, P1.107, P1.108, P1.109, P2.1, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.12, P2.13, P2.14, P2.17, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.25, P2.28, P2.30, P2.31, P2.33, P2.34, P2.35, P2.36, P2.37, P2.38, P2.40, P2.41, P2.51, P2.52, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57, P2.61, P2.64, P2.65, P2.66, P2.67, P2.69, P2.70, P2.72, P2.74, P2.77, P2.78, P2.80, P2.83, P2.84, P2.85, P2.86, P2.92, P2.93, P2.94, P2.97, P2.98 and P2.100 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B2: Activity against *Myzus persicae* (green peach aphid)
(mixed population, systemic/feeding activity, curative)
Roots of pea seedlings, infested with an aphid population of mixed ages, are placed directly in the test solutions. 6 days after introduction, samples are checked for mortality and special effects on the plant.
In this test, compounds listed in the Tables P1 and P2 above show good activity. In particular compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.12, P1.14, P1.15, P1.16, P1.17, P1.18, P1.19, P1.23, P1.24, P1.26, P1.27, P1.29, P1.35, P1.41, P1.42, P1.43, P1.44, P1.45, P1.46, P1.47, P1.48, P1.49, P1.50, P1.52, P1.53, P1.55, P1.56, P1.57, P1.59, P1.60, P1.62, P1.63, P1.64, P1.65, P1.66, P1.67, P1.68, P1.69, P1.70, P1.73, P1.74, P1.76, P1.77, P1.78, P1.79, P1.81, P1.82, P1.83, P1.84, P1.88, P1.89, P1.102, P1.104, P1.106, P1.107, P1.108, P1.109, P2.1, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.11, P2.12, P2.13, P2.14, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.25, P2.27, P2.28, P2.30, P2.32, P2.33, P2.34, P2.35, P2.40, P2.41, P2.44, P2.45, P2.46, P2.48, P2.49, P2.51, P2.52, P2.53, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57, P2.58, P2.59, P2.61, P2.62, P2.64, P2.65, P2.66, P2.67, P2.69, P2.70, P2.71, P2.72, P2.77, P2.78, P2.79, P2.80, P2.83, P2.84, P2.85, P2.92, P2.94, P2.95, P2.97, P2.98, P2.99 and P2.100 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B3: Activity against *Thrips tabaci* (onion Thrips)
(mixed population, feeding/residual contact activity, preventive)
Sunflower leaf discs are placed on agar in a 24-well microtiter plate and sprayed with test solutions. After drying, the leaf discs are infested with a thrips population of mixed ages.

After an incubation period of 6 days, samples are checked for mortality and special effects (e.g. phytotoxicity).

In this test, compounds listed in the Tables P1 and P2 above show good activity. In particular compounds P1.8, P1.9, P1.11, P1.12, P1.47, P1.49, P1.62, P1.74, P1.81, P2.6, P2.7, P2.10, P2.13, P2.14, P2.18, P2.34, P2.51, P2.62, P2.67, P2.77 and P2.84 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B4: Activity against *Tetranychus urticae* (two-spotted spider mite)
(mixed population, feeding/residual contact activity, preventive)

Bean leaf discs on agar in 24-well microtiter plates are sprayed with test solutions. After drying, the leaf discs are infested with mite populations of mixed ages. 8 days later, discs are checked for egg mortality, larval mortality, and adult mortality.

In this test, compounds listed in the Tables P1 and P2 above show good activity. In particular compounds P1.4, P1.6, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.16, P1.17, P1.18, P1.21, P1.22, P1.24, P1.25, P1.26, P1.27, P1.28, P1.29, P1.43, P1.44, P1.45, P1.47, P1.48, P1.49, P1.54, P1.56, P1.59, P1.60, P1.69, P1.74, P1.76, P1.77, P1.78, P1.80, P1.81, P1.82, P1.83, P1.84, P1.87, P1.88, P1.104, P1.105, P1.106, P1.109, P2.4, P2.5, P2.8, P2.11, P2.12, P2.13, P2.14, P2.17, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.24, P2.25, P2.26, P2.30, P2.31, P2.34, P2.35, P2.45, P2.48, P2.55, P2.56, P2.57, P2.58, P2.64, P2.65, P2.67, P2.69, P2.76, P2.79, P2.83, P2.85, P2.86, P2.94, P2.97 and P2.100 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B5: Activity against *Plutella xylostella* (Diamond back moth)
(larvicide, feeding/residual contact activity, preventive)

24-well microtiter plate (MTP) with artificial diet is treated with test solutions by pipetting. After drying, the MTP's are infested with larvae (L2)(10-15 per well). After an incubation period of 5 days, samples are checked for larval mortality, antifeedant,and growth regulation.

In this test, compounds listed in the Tables P1 and P2 above show good activity. In particular compounds P1.2, P1.7, P1.8, P1.9, P1.11, P1.19, P1.74, P2.2, P2.4, P2.6 and P2.63 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B6: Activity against *Frankliniella occidentalis* (western flower thrips)

Bean leaf discs on agar in petri dishes or bean plants in a spray chamber are treated with diluted test solutions. After drying leaf discs are cut and placed in plastic cups on the

surface of an agar layer and infested with mixed population. 6 days (leaf discs) or 14 days (plants) after the infestation, samples are checked for reduction of treated population and compared to the non treated population.

In this test, compounds P1.9, P1.10, P1.14, P1.15, P1.18, P1.27, P1.45, P1.60, P2.6, P2.9, P2.10, P2.11, P2.12, P2.13, P2.30, P2.54, P2.55 and P2.56 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B7: Activity against *Bemisia tabaci* (tobacco white fly)
(larvicide, contact/feeding)

Bean plants are infested with 20-30 adults that were removed after a 4 day egg-laying period. After another 7 days, bean plants with hatched nymphs (N-2) are treated (2 replicates) with the test solutions in a spray chamber. Three weeks later, samples are checked for number of emerged adults. Efficacy was calculeted by comparing number of emerged adults in treated and non treated samples.

In this test, compounds P1.2, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.17, P1.18, P1.48, P1.78, P1.82, P2.2, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.12, P2.14, P2.18 and P2.64 show an activity of over 80% at a concentration of 200ppm.

Example B8: Activity against *Nilaparvata lugens* (brown rice planthopper)
(larvicide, feeding/contact)

Rice seedlings are treated with the diluted test solutions in a spray chamber. After drying, they are infested with 20 N_3 nymphs (2 replicates). 6-12 days after the treatment samples are checked for mortality, growth regulation, and effects on the F_1 generation.

In this test, compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.12, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.24, P1.25, P1.26, P1.27, P1.28, P1.45, P1.48, P1.49, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.88, P1.107, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.13, P2.14, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.25, P2.34, P2.55, P2.57 and P2.64 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B9: Activity against *Aphis craccivora* (cowpea aphid)
(mixed population, contact/feeding)

Pea seedlings, infested with an aphid population of mixed ages, are treated (2 replicates) with diluted test solutions in a spray chamber. 6 days after treatment, samples are checked for mortality.

In this test, compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.8, P1.15, P1.17, P1.26, P1.27, P1.48, P1.60, P1.82, P2.6, P2.7, P2.9, P2.13, P2.24 and P2.34 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B10: Activity against *Aphis craccivora* (cowpea aphid)
(mixed population, systemic/feeding)

Roots of pea seedlings, infested with an aphid population of mixed ages, are placed (2 replicates) directly in the test solution. 6 days later, samples are checked for mortality.

In this test, compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.17, P1.23, P1.24, P1.25, P1.26, P1.27, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.107, P2.5, P2.6, P2.8, P2.9, P2.10, P2.13, P2.14, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.34, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57 and P2.64 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B11: Translaminar activity against *Aphis craccivora* (cowpea aphid)

French bean leaves (Phaseolus vulgaris) are infested with about 20 mixed age individuals on the lower leaf side using clip cages. 1 day after the infestation, the upper side of the leaves is treated with the test solution by painting. 5 days later, samples are checked for mortality.

In this test, compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.14, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.23, P1.24, P1.26, P1.27, P1.45, P1.48, P1.49, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.107, P2.2, P2.3, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.12, P2.13, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.30, P2.34, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57 and P2.64 show an activity of over 80% at a concentration of 400ppm.

Example B12: Activity against *Aonidiella aurantii* (red scale)

Treatment of potato tubers by dipping the in the test solution. One day later, tubers are infested with about 50 crawlers. 6-8 weeks after application samples are checked for the number of crawlers of the next generation (compared to the non treated samples).

In this test, compounds P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.11, P1.15, P1.17, P1.19, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.14 and P2.18 show an activity of over 80% at a concentration of 200ppm.

Example B13: Drench activity against *Myzus persicae* (green peach aphid)

Pea seedlings cultivated in field soil are treated as drench application and infested with a mixed population of *M. persicae*. 7 days after infestation, samples are checked for mortality.

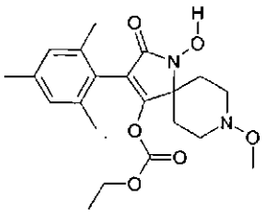
In this test, compounds listed in the Tables P1 and P2 above show good activity. For example compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.23, P1.24, P1.26, P1.27, P1.48, P1.49, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.88, P1.107, P2.1, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.11, P2.12, P2.13, P2.14, P2.18, P2.20, P2.21, P2.24, P2.30, P2.34, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57 and P2.64 show an activity of over 80% at a concentration of 25ppm.

Example B14: Insecticide seed treatment

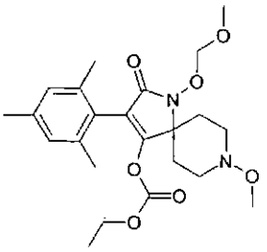
Sugarbeet seeds are treated with test compounds at various rates (mg a.i. /seed). The seeds are sown into pots filled with soil. After placing the seeds on the soil surface they are further covered with soil. Before and during the bioassays, the plants are grown under optimal greenhouse conditions. After 14 days, the plants are infested with cowpea aphid (*Aphis craccivora*) by placing one infested pea seedling containing approximately 150 aphids of a population of mixed developmental stages onto each plant. Seven days after infestation, the number of aphids is counted per plant. Each treatment group is replicated 10 times. Each replicate contains 1 plant.

In this test, compounds compounds P1.2, P1.7, P2.2 and P2.6 show an efficacy of over 80% (60% efficacy for compound P2.2) in the reduction of aphids compared to the untreated control plants at a rate of 0.3 mg a.i./seed.

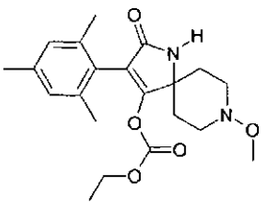
Example B15: Comparison of the insecticidal activity and crop compatibility of compounds according to the invention with a compound from the state of the art (compound No. A18 described on page 97 of WO09/049851):



(Compound No. P1.11 according to the invention)



(Compound No. P1.7 according to the invention)



(Compound No. A18 according to WO09/049851)

Drench activity against *Myzus persicae* (green peach aphid)
(mixed population, drench application in field soil, persistence, plant damage evaluation)
Six weeks old pepper plants cultivated in field soil are treated as drench application at various rates (mg a.i. / litre soil). The same day, plants are infested with a mixed population of *M.persicae* and incubated in the greenhouse under optimal greenhouse conditions. Samples are assessed 7 days after infestation on mortality. Treated plants are re-infested 7, 14, 21 and 28 days after application. Evaluation is always done 7 days after infestation. Plants are also checked for damage (phytotoxicity), visual assessment being made using a 0-100% rating scale (100% = total damage to plant; 0% = no damage to plant).
Results are shown in Table B15:

Table B15: Activity (death rate) against Myzus persicae (green peach aphid) and damage on pepper plants

Compound:	Concentration (ppm)	Mortality (%) *xx* days after application (drench, systemic action, persistence)					Damage (%) on pepper plant *xx* days after application				
		0	7	14	21	28	0	7	14	21	28
A18 (WO09/049851)	12.5	100	100	98	95	95	40	70	85	85	85
P1.11 (invention)	12.5	97	95	95	100	100	0	0	0	0	0
P1.7 (invention)	12.5	99	100	98	98	97	0	0	0	0	0

Table B15 shows that compounds No. P1.11 and P1.07 according to the invention exert an insecticidal action on *Myzus persicae* which is very similar to the action of the compound of the state of the art. However, compounds P1.11 and P1.07 exhibit a significantly better plant compatibility showing no plant damage at all on the pepper plants, whereas compound A18 damages these to an untolerable high extend.

Example B16: Activity against *Aphis craccivora* (cowpea aphid)
(mixed population, adjuvant effect, curative)

Broad bean plants are heavily infested with an aphid population of mixed ages. One day after infestation, plants are treated with diluted test solutions of the compound formulated as EC050 in a spray chamber (4 replicates). Optionally, an adjuvant is added with 0.1 % (v/v) to the spray solution. 7 days after treatment samples are checked for mortality. Efficacy was calculated with the aid of Abbott's formula.

Results are shown in Tables B16a and B16b:

Table B16a: Activity against *Aphis craccivora* (cowpea aphid)

Compound:	Concentration (ppm)	Abbott's efficacy (%) against *Aphis craccivora*
P1.15, no adjuvant	3	3
P1.15 + Merge	3	10
P1.15 + Ammonium nitrate	3	63
P1.15 + Mero	3	69
P1.15 + Adigor	3	94

Merge (CAS registry number 147230-14-6) is a mixture of surfactant blend and solvent (petroleum hydrocarbons).

Ammonium nitrate: "Ammonsalpeter", a nitrogen fertilizer, with a 27% nitrogen (N) composition was used (50% ammonium N and 50% nitrate N).

Mero (CAS registry number 85586-25-0) is rape seed oil methyl ester based.

Adigor (CAS registry number 1103981-66-3) is rape seed oil methyl ester based.

Table B16b: Activity against *Aphis craccivora* (cowpea aphid)

Compound:	Concentration (ppm)	Abbott's efficacy (%) against *Aphis craccivora*
P1.15, no adjuvant	3	11
P1.15 + Agnique ME CSO 10	3	81
P1.15 + Break Thru S 233	3	80
P1.15 + RME	3	93

Agnique ME CSO 10 is castor oil ethoxylate methylated based.

Break Thru S 233 is polyether modified polysiloxane based.

RME is rape seed oil methyl ester.

Tables B16a and B16b reveal that adjuvants from different chemical classes, such as for example, but not limited to, surfactants with or without solvents, vegetable oils, fertilizers, ammonium salts or polyalkyl-oxide-modified polysiloxanes are able to enhance the insecticidal activity of compound P1.1.5 significantly.

Example B17: Activity against *Myzus persicae* (green peach aphid)

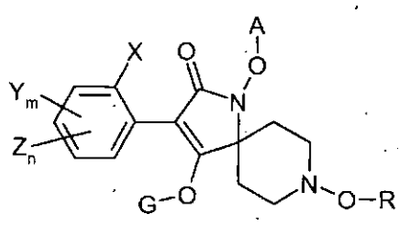
(mixed population, feeding/residual contact activity, plant damage evaluation)

Pepper plants infested with a mixed population of *Myzus persicae* are treated with diluted test solutions of the compounds in a spray chamber. 6 days after treatment, samples are checked for mortality and for plant damage (phytotoxicity), visual assessment being made using a 0-100% rating scale (100% = total damage to plant; 0% = no damage to plant).

In this test, compounds listed in the Tables P1 and P2 above show good activity against *Myzus persicae* and acceptable plant compatibility. For example compounds P1.1, P1.2, P1.3, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.14, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.24, P1.26, P1.27, P1.32, P1.37, P1.38, P1.44, P1.45, P1.48, P1.53, P1.55, P1.56, P1.57, P1.63, P1.65, P1.69, P1.73, P1.76, P1.77, P1.78, P1.79, P1.81, P1.82, P1.83, P1.88, P1.89, P1.106, P1.107, P2.2, P2.3, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.11, P2.12, P2.13, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.24, P2.29, P2.30, P2,31, P2.33, P2.36, P2.38, P2.40, P2.43, P2.54, P2.62, P2.63, P2.64, P2.65, P2.66, P2.67, P2.69, P2.70, P2.71, P2.77, P2.78, P2.79, P2.82, P2.83, P2.85, P2.86, P2.94, P2.95, P2.97 and P2.99 show an activity of greater than or equal to 80% against *Myzus persicae* and damage to pepper plants less than or equal to 10% at a concentration of 200ppm.

CLAIMS

1. A compound of the formula I



(I),

wherein

X , Y and Z independently of each other are C_{1-4}alkyl, C_{3-6}cycloalkyl, C_{1-4}haloalkyl, C_{1-4}alkoxy, halogen, phenyl or phenyl substituted by C_{1-4}alkyl, C_{1-4}haloalkyl, halogen or cyano;

m and n, independently of each other, are 0, 1, 2 or 3 and m+n is 0, 1, 2 or 3;

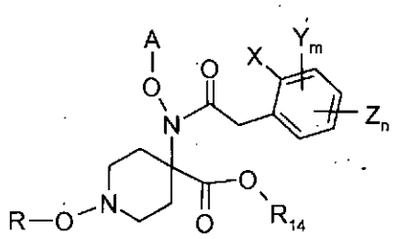
G is hydrogen, an alkali metal, alkaline earth metal, ammonium, sulfonium or a latentiating group;

R is hydrogen, C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{1-6}cyanoalkyl, benzyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl or is a group G; and

A is hydrogen, C_{1-6}alkyl, C_{1-6}haloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl, C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, or C_{3-6}cycloalkyl(C_{1-4})alkyl where in the cycloalkyl moiety a methylene group is replaced by O, S or NR_0, where R_0 is C_{1-6}alkyl or C_{1-6}alkoxy, or A is C_{2-6}alkenyl, C_{2-6}haloalkenyl, C_{3-6}alkynyl, C_{1-6}cyanoalkyl, benzyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkoxy(C_{1-4})alkoxy(C_{1-4})alkyl, oxetanyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, C_{1-6}alkylcarbonyl, C_{1-6}alkoxycarbonyl, C_{3-6}cycloalkylcarbonyl, N-di(C_{1-6}alkyl)carbamoyl, benzoyl, C_{1-6}alkylsulfonyl or phenylsulfonyl, C_{1-4}alkylthio(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkylsulfinyl(C_{1-4})alkyl, C_{1-4}alkylsulfonyl(C_{1-4})alkyl, furanyl(C_{1-4})alkyl, tetrahydro-thiofuranyl, tetrahydro-thiopyranyl, 1-(C_{1-4})alkoxy-piperidin-4-yl,

or an agrochemically acceptable salt or an N-oxide thereof.

2. A compound of formula IV

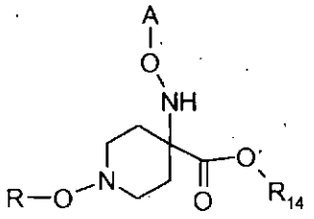


(IV),

or salts thereof, wherein X, Y, Z, m, n, R and A are as defined in claim 1 and R_{14} is

C_{1-6}alkyl.

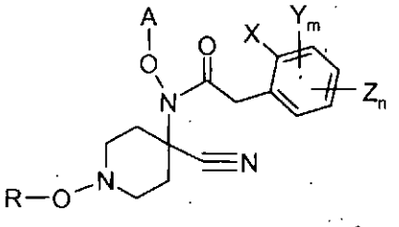
3. A compound of the formula V



(V),

or salts thereof, wherein R and A are as defined in claim 1 and wherein R_{14} is C_1-C_6alkyl.

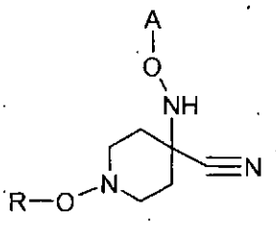
4. A compound of the formula X



(X),

or salts thereof, wherein X, Y, Z, m, n, R and A are as defined in claim 1.

5. A compound of the formula VII



(VII),

or salts thereof, wherein R and A are as defined in claim 1.

6. An insecticidal, acaricidal, nemacitidal or molluscicidal composition comprising an effective amount of at least one compound of formula I as defined in claim 1.

7. A composition according to claim 6, which, in addition to comprising the compound of formula I, comprises formulation adjuvants.

8. A composition according to claim 7, wherein the formulation adjuvant is an oil of vegetable or animal origin, a mineral oil, alkyl esters of such oils or mixtures of such oils and oil derivatives, or is a fertilizer or an ammonium- or phosphonium salt, optionally in admixture with the above oils and oil derivatives.

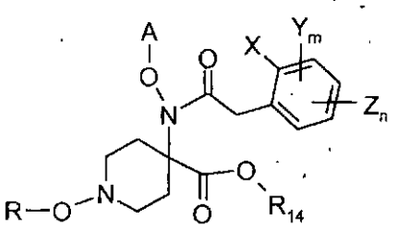
9. A composition according to claim 6, which, in addition to comprising the compound of formula I, comprises at least one additional insecticide, acaricide, nemacitide or molluscicide.

10. A composition according to claim 6, which, in addition to comprising the compound of formula I, comprises at least one additional fungicide, herbicide, safener or plant growth regulator.

11. A method of combating and controlling insect, acarine, nematode or mollusc pests which comprises applying to the pest, to a locus of the pest, or to a plant susceptible to attack by the pest an insecticidally, acaricidally, nematicidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula I, or of a composition comprising such a compound.

12. A method according to claim 11, which comprises applying to the pest, to a locus of the pest, or to a plant susceptible to attack by the pest an insecticidally, acaricidally, nematicidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula I and at least one additional insecticide, acaricide, nemacitide, molluscicide, fungicide, herbicide, safener or plant growth regulator.

13. A process for the preparation of the compounds of the formula I according to claim 1, wherein G is hydrogen, which comprises cyclisation of the compound of formula IV



(IV),

wherein X, Y, Z, m, n, R and A have the meanings assigned to them in claim 1, and R_{14} is C_{1-6}alkyl, under basic conditions.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2009/066039

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
INV. A01N43/90 C07D211/94 C07D471/10
ADD.

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)
A01N C07D

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

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)
EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X Y	WO 00/68196 A1 (SANKYO CO [JP]; NIPPON KAYAKU KK [JP]; MIO SHIGERU [JP]; ITO MITSURU [ ) 16 November 2000 (2000-11-16) Abstract; examples.	1-13 1-13
Y,P	WO 2009/049851 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; ZAMBACH WERNER [CH]; HUETER OTTMAR FR) 23 April 2009 (2009-04-23) Abstract; claims; examples.	1-13

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

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
5 May 2010	17/05/2010

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, Fax: (+31-70) 340-3016	Weisbrod, Thomas

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2009/066039

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0068196 A1	16-11-2000	AU 4315700 A	21-11-2000
WO 2009049851 A1	23-04-2009	AR 068865 A1	09-12-2009
		AU 2008314078 A1	23-04-2009
		UY 31392 A1	29-05-2009

000227

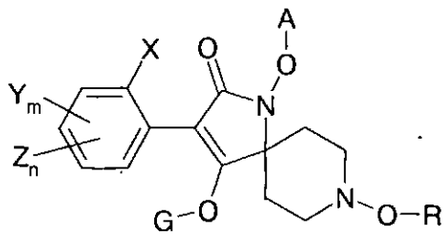
N-OXIAMIDAS ESPIROHERETOCÍCLICAS COMO PESTICIDAS

La presente invención se refiere a nuevos derivados de pirrolidindiona espiroheterocíclicos sustituidos con N–oxiamida, a procesos para su preparación, a composiciones insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematicidas que comprenden a los mismos y a métodos para su utilización para combatir y controlar pestes de insectos, ácaros, moluscos y nematodos.

Los derivados de pirrolidindiona espirocíclicos son descritos, por ejemplo, en WO 2000/068196, JP 2001072661, y en artículos de M. Ito et al., Heterocycles 57, 881–894, 2002; Bioscience, Biotechnology, y Biochemistry 66, 2406–14, 2002; Bioorganic & Medicinal Chemistry 11, 761–68, 2003; Bioscience, Biotechnology, y Biochemistry 67, 1230–8, 2003. Por añadidura, los derivados de pirrolidindiona espiroheterocíclicos son conocidos, por ejemplo, de WO 2009/049851.

Se ha descubierto ahora sorprendentemente que ciertos derivados de pirrolidindiona espiroheterocíclicos sustituidos con N–oxiamida novedosos tienen buenas propiedades insecticidas.

Por consiguiente, la presente invención proporciona compuestos de fórmula I



(I) ,

donde

X , Y y Z independientemente entre sí son alquiloC_{1-4}, cicloalquilo C_{3-6}, haloalquilo C_{1-4}, alcoxi C_{1-4}, halógeno, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_{1-4}, haloalquilo C_{1-4}, halógeno o ciano;

m y n, independientemente entre sí, son 0, 1, 2 o 3 y m+n es 0, 1, 2 o 3;

G es hidrógeno, un metal alcalino, metal alcalinotérreo, amonio, sulfonio o un grupo de latenciación;

R es hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cianoalquilo C_{1-6}, bencilo, alcoxi C_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4} alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}) o es un grupo G; y

000228

A es hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}), o ciclo–alquilC_{3-6}alquilo(C_{1-4}) donde en la porción cicloalquilo un grupo metileno es reemplazado con O, S o NR_0, donde R_0 es alquilo C_{1-6} o alcoxi C_{1-6}, o A es alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{3-6}, cianoalquilo C_{1-6}, bencilo, alcoxiC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4} alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), oxetanilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, alquil C_{1-6}carbonilo, alcoxicarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, N–di(alquil C_{1-6})carbamoílo, benzoílo, alquilsulfonilo C_{1-6} o fenilsulfonilo, alquiltioC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alquilsulfinilC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alquilsulfonil C_{1-4} alquilo(C_{1-4}), furanil–alquilo(C_{1-4}), tetrahidro–tiofuranilo, tetrahidro–tiopiranilo, 1–alcoxi(C_{1-4})–piperidin–4–ilo;

o su sal aceptable para uso agroquímico o su N–óxido.

En los compuestos de la fórmula I, cada porción alquilo ya sea sola o como parte de un grupo más grande es una cadena recta o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, n–propilo, n–butilo, iso–propilo, sec–butilo, iso–butilo, terc–butilo, n–pentilo, iso–pentilo y n–hexilo.

Los grupos alcoxi tienen, preferentemente, una longitud de cadena preferida de entre 1 y 4 átomos de carbono. Alcoxi es, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, i–propoxi, n–butoxi, isobutoxi, sec–butoxi y terc–butoxi. Dichos grupos pueden ser parte de un grupo más grande tal como alcoxialquilo y alcoxialcoxialquilo. Los grupos alcoxialquilo tienen preferentemente una longitud de cadena de 1 a 4 átomos de carbono. Alcoxialquilo es, por ejemplo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, n–propoximetilo, n–propoxietilo o isopropoximetilo.

Halógeno es generalmente flúor, cloro, bromo o yodo. Esto es también aplicable, correspondientemente, a halógeno en combinación con otros significados, tales como haloalquilo.

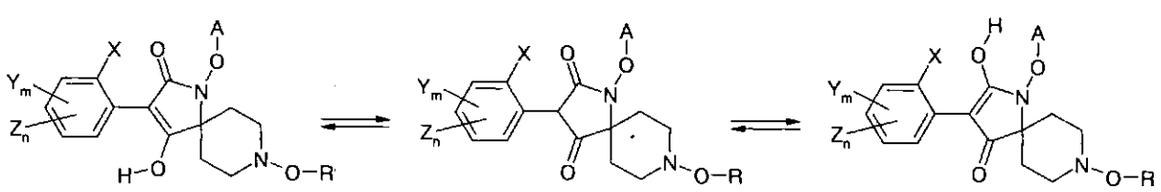
Los grupos haloalquilo preferentemente tienen una longitud de cadena de entre 1 y 6 átomos de carbono. Haloalquilo es, por ejemplo, fluormetilo, difluormetilo, trifluormetilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2–trifluoretilo, 2–fluoretilo, 2–cloroetilo, pentafluoretilo, 1,1–difluor–2,2,2–tricloroetilo, 2,2,3,3–tetrafluoretilo y 2,2,2–tricloroetilo; preferentemente triclorometilo, difluorclorometilo, difluormetilo, trifluormetilo y diclorofluormetilo.

Los grupos cicloalquilo preferentemente tienen entre 3 y 6 átomos de carbono en el anillo, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. En estos anillos, un grupo metileno puede ser reemplazado con un átomo de oxígeno y/o de azufre, lo cual conduce, por ejemplo, a anillos de oxetanilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, furanilo, tetrahidro–tiofuranilo y tetrahidro–tiopiranilo.

Fenilo, también como parte de un sustituyente tal como bencilo, puede ser sustituido, preferentemente con grupos alquilo, haloalquilo o halógeno. En este caso, los sustituyentes pueden estar en posición orto, meta y/o para. Las posiciones de los sustituyentes preferidas son las posiciones orto y para al punto de unión al anillo.

Los compuestos de fórmula I pueden existir en diferentes isómeros geométricos u ópticos o en diferentes formas tautoméricas. Uno o más centros de quiralidad pueden estar presentes, en cuyo caso los compuestos de la fórmula I pueden estar presentes como enantiómeros puros, mezclas de enantiómeros, diastereómeros puros o mezclas de diastereómeros. Pueden estar presentes centros de tautomerisación. Esta invención cubre todos esos isómeros y tautómeros y sus mezclas en todas las proporciones así como también las formas isotópicas tales como compuestos deuterados.

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de fórmula I pueden existir en diferentes formas isoméricas, las cuales están todas dentro del alcance de los compuestos reivindicados de la fórmula I. Cuando G es hidrógeno, por ejemplo, los compuestos de fórmula I pueden existir en diferentes formas tautoméricas:



Esta invención cubre todas esos isómeros y tautómeros y sus mezclas en todas las proporciones. Asimismo, cuando la estructura química de los sustituyentes da origen a la existencia de isómeros tales como sustituyentes, los

cuales contienen enlaces dobles y por ende existen como isómeros cis y trans, dichos isómeros, también, están dentro del alcance de los compuestos reivindicados de la fórmula I.

La invención se refiere además a las sales agrícolamente aceptable las cuales los compuestos de fórmula I son capaces de formar con bases de metal de transición, metal alcalino y metal alcalinotérreo, aminas, bases de amonio cuaternario o bases de sulfonio terciarias.

Entre los formadores de sales de metales de transición, metales alcalino y metales alcalinotérreos, deben mencionarse especialmente los hidróxidos de cobre, hierro, litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, y preferentemente los hidróxidos, bicarbonatos y carbonatos de sodio y potasio.

Los ejemplos de aminas adecuadas para la formación de sales de amonio incluyen amoníaco así como también alquilaminas C_1–C_{18} primarias, secundarias y terciarias, hidroxialquilaminas C_1–C_4 y alcoxialquil–aminas C_2–C_4, por ejemplo metilamina, etilamina, *n*–propilamina, *i*–propilamina, los cuatro isómeros de butilamina, *n*–amilamina, *i*–amilamina, hexilamina, heptilamina, octilamina, nonilamina, decilamina, pentadecilamina, hexadecilamina, heptadecilamina, octadecilamina, metiletilamina, metilisopropilamina, metilhexilamina, metilnonilamina, metilpentadecilamina, metiloctadecilamina, etilbutilamina, etilheptilamina, etiloctilamina, hexilheptilamina, hexiloctilamina, dimetilamina, dietilamina, di–*n*–propilamina, di–*i*–propilamina, di–*n*–butilamina, di–*n*–amilamina, di–*i*–amilamina, dihexilamina, diheptilamina, dioctilamina, etanolamina, *n*–propanolamina, *i*–propanolamina, *N*,*N*–dietanolamina, *N*–etilpropanolamina, *N*–butiletanolamina, alilamina, *n*–but–2–enilamina, *n*–pent–2–enilamina, 2,3–dimetilbut–2–enilamina, dibut–2–enilamina, *n*–hex–2–enilamina, propilendiamina, trimetilamina, trietilamina, tri–*n*–propilamina, tri–*i*–propilamina, tri–*n*–butilamina, tri–*i*–butilamina, tri–*sec*–butilamina, tri–*n*–amilamina, metoxietilamina y etoxietilamina; aminas heterocíclicas, por ejemplo piridina, quinolina, isoquinolina, morfolina, piperidina, pirrolidina, indolina, quinuclidina y azepina; arilaminas primarias, por ejemplo anilinas, metoxianilinas, etoxianilinas, *o*–, *m*– y *p*–toluidinas, fenilendiaminas, bencidinas, naftilaminas y *o*–, *m*– y *p*–cloroanilinas; aunque especialmente trietilamina, propilamina y di–*i*–propilamina.

Las bases de amonio cuaternario preferidas adecuadas para la formación de sales corresponden, por ejemplo, a la fórmula $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$, donde R_a, R_b, R_c y R_d son cada uno independientemente de los otros hidrógeno o alquilo C_1–C_4. Otras bases de tetraalquilamonio adecuadas con otros aniones pueden obtenerse, por ejemplo, mediante reacciones de intercambio aniónico.

Las bases de sulfonio terciarias preferidas adecuadas para la formación de sales corresponden, por ejemplo, a la fórmula $[SR_eR_fR_g]OH$, donde R_e, R_f y R_g son individual e independientemente de los otros alquilo C_1–C_4. Se prefiere especialmente el hidróxido de trimetilsulfonio. Las bases de sulfonio adecuadas pueden obtenerse a partir de la reacción de tioéteres, en particular, dialquilsulfuros, con alquilhaluros, seguido por conversión a una base adecuada, por ejemplo un hidróxido, mediante reacciones de intercambio aniónico.

Debería entenderse que en aquellos compuestos de fórmula I, donde G es un metal, amonio o sulfonio según lo mencionado anteriormente y como tal representa un catión, la carga negativa correspondiente es en gran parte deslocalizada a través de la unidad O–C=C–C=O.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también incluyen hidratos los cuales pueden ser formados durante la formación de sales.

El término "grupo de latenciación" como se utiliza para la porción G son bien conocidos por los expertos en la técnica de la preparación de los compuestos adecuados para utilizar en productos para la protección de plantas tales como compuestos insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematicidas. Dichos grupos de latenciación son seleccionados para permitir su remoción mediante uno o una combinación de procesos bioquímicos, químicos o físicos para proporcionar los compuestos de fórmula I donde G es H antes, durante o después de la aplicación a las pestes tratadas, locus de las pestes o plantas. Los ejemplos de estos procesos incluyen disociación enzimática, hidrólisis química y fotólisis. Los compuestos que portan ese tipo de grupos G pueden ofrecer ciertas desventajas, tales como penetración mejorada de la cutícula de las plantas tratadas, aumento de la tolerancia de los cultivos, compatibilidad o estabilidad mejorada en las mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, antídotos (safener) de herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, fungicidas o insecticidas, o lixiviación reducida en suelos.

El grupo de latenciación G es preferentemente seleccionado de los grupos alquilo C_1–C_8, haloalquilo C_2–C_8, fenilalquilo C_1–C_8 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro), heteroarilalquilo C_1–C_8 (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro), alquenilo C_3–C_8, haloalquenilo C_3–C_8, alquinilo C_3–C_8, $C(X^a)$–R^a, $C(X^b)$–X^c–R^b, $C(X^d)$–$N(R^c)$–R^d, –SO_2–R^e, –$P(X^e)(R^f)$–R^g o CH_2–X^f–R^h donde X^a, X^b, X^c, X^d, X^e y X^f son independientemente entre sí oxígeno o azufre;

R^a es H, alquilo C_1–C_{18}, alquenilo C_2–C_{18}, alquinilo C_2–C_{18}, haloalquilo C_1–C_{10}, cianoalquilo C_1–C_{10}, nitroalquilo C_1–C_{10}, aminoalquilo C_1–C_{10}, alquilamino C_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilamino C_2–C_8alquilo C_1–C_5, cicloalquil C_3–C_7alquilo C_1–C_5, alcoxiC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alqueniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquinil C_3–C_5oxialquilo C_1–C_5, alquiltioC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfinilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilidenaminoxiC_2–C_8C_1–C_5alquilo, alquilcarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alcoxicarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, aminocarbonilalquilo C_1–C_5, alquilaminocarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilaminocarbonil C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, *N*– alquilcarbonil C_1–C_5–*N*– alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, trialquilsilil C_3–C_6alquilo C_1–C_5, fenilalquilo C_1–C_5 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), heteroarilalquilo C_1–C_5, (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo C_2–C_5, cicloalquilo C_3–C_8, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro,

R^b es alquilo C_1–C_{18}, alquenilo C_3–C_{18}, alquinilo C_3–C_{18}, haloalquilo C_2–C_{10}, cianoalquilo C_1–C_{10}, nitroalquilo C_1–C_{10}, aminoalquilo C_2–C_{10}, alquilamino C_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilamino C_2–C_8alquilo C_1–C_5, cicloalquil C_3–C_7alquilo C_1–C_5,

alcoxiC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alqueniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiltioC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfinilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5; alquilidenaminoxi C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alcoxicarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, aminocarbonilalquilo C_1–C_5, alquilaminocarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilaminocarbonil C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, *N*– alquilcarbonil C_1–C_5–*N*– alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, trialquilsilil C_3–C_6alquilo C_1–C_5, fenilalquilo C_1–C_5 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), heteroarilalquilo C_1–C_5, (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquil–tio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo C_3–C_5, cicloalquilo C_3–C_8; fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, halo–alcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro,

R^c y R^d son cada uno independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C_1–C_{10}, alquenilo C_3–C_{10}, alquinilo C_3–C_{10}, haloalquilo C_2–C_{10}, cianoalquilo C_1–C_{10}, nitroalquilo C_1–C_{10}, aminoalquilo C_1–C_{10}; alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilamino C_2–C_8alquilo C_1–C_5, cicloalquil C_3–C_7alquilo C_1–C_5, alcoxiC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alqueniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiltioC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfinilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilidenaminoxi C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alcoxicarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, aminocarbonilalquilo C_1–C_5, alquilaminocarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilaminocarbonil C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, *N*–alquilcarbonil C_1–C_5–*N*–alquilaminoalquilo C_2–C_5, trialquilsilil C_3–C_6alquilo C_1–C_5, fenilalquilo C_1–C_5 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), heteroarilalquilo C_1–C_5, (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3,

alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo C_2–C_5, cicloalquilo C_3–C_8, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro, difenilamino o difenilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro o cicloalquilamino C_3–C_7, di–cicloalquilamino C_3–C_7 o cicloalcoxi C_3–C_7 o R^c y R^d pueden unirse para formar un anillo de 3–7 miembros, que contiene opcionalmente un heteroátomo seleccionado entre O u S,

R^e es alquilo C_1–C_{10}, alquenilo C_2–C_{10}, alquinilo C_2–C_{10}, haloalquilo C_1–C_{10}, cianoalquilo C_1–C_{10}, nitroalquilo C_1–C_{10}, aminoalquilo C_1–C_{10}, alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilamino C_2–C_8alquilo C_1–C_5, cicloalquil C_3–C_7alquilo C_1–C_5, alcoxiC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alqueniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiltioC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfinilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilidenaminoxi C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alcoxicarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, aminocarbonilalquilo C_1–C_5, alquilaminocarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilaminocarbonil C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, *N*– alquilcarbonil C_1–C_5–*N*– alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, trialquilsilil C_3–C_6alquilo C_1–C_5, fenilalquilo C_1–C_5 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), heteroarilalquilo C_1–C_5 (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo C_2–C_5, cicloalquilo C_3–C_8, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–

C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, difenilamino, o difenilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, o cicloalquilamino C_3–C_7, dicicloalquilamino C_3–C_7 o cicloalcoxi C_3–C_7, alcoxi C_1–C_{10}, haloalcoxi C_1–C_{10}, alquilamino C_1–C_5 o dialquilamino C_2–C_8

R^f y R^g son cada uno independientemente entre sí alquilo C_1–C_{10}, alquenilo C_2–C_{10}, alquinilo C_2–C_{10}, alcoxi C_1–C_{10}, haloalquilo C_1–C_{10}, cianoalquilo C_1–C_{10}, nitroalquilo C_1–C_{10}, aminoalquilo C_1–C_{10}, alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilamino C_2–C_8alquilo C_1–C_5, cicloalquil C_3–C_7alquilo C_1–C_5, alcoxiC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alqueniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiltioC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfinilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilidenaminoxi C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alcoxicarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, aminocarbonilalquilo C_1–C_5, alquilaminocarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilaminocarbonil C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, *N*–alquilcarbonil C_1–C_5–*N*–alquilaminoalquilo–C_2–C_5, trialquilsilil C_3–C_6alquilo C_1–C_5, fenilalquilo C_1–C_5 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), heteroarilalquilo C_1–C_5 (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano, o con nitro), haloalquenilo C_2–C_5, cicloalquilo C_3–C_8, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, heteroarilo o heteroarilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro, heteroarilamino o heteroarilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro, diheteroarilamino o diheteroarilamino sustituido con alquilo C_1–C_3,

haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, fenilamino o fenilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, difenilamino, o difenilamino sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, o cicloalquilamino C_3–C_7, dicicloalquilamino C_3–C_7 o cicloalcoxi C_3–C_7, haloalcoxi C_1–C_{10}, alquilamino C_1–C_5 o dialquilamino C_2–C_8, benciloxi o fenoxi, donde los grupos bencilo y fenilo pueden a su vez estar sustituidos con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o nitro, y

R^h es alquilo C_1–C_{10}, alquenilo C_3–C_{10}, alquinilo C_3–C_{10}, haloalquilo C_1–C_{10}, cianoalquilo C_1–C_{10}, nitroalquilo C_1–C_{10}, aminoalquilo C_2–C_{10}, alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilamino C_2–C_8alquilo C_1–C_5, cicloalquil C_3–C_7alquilo C_1–C_5, alcoxiC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alqueniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiniloxi C_3–C_5alquilo C_1–C_5, alquiltioC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfinilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilsulfonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alquilidenaminoxi C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, alcoxicarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, aminocarbonilalquilo C_1–C_5, alquilaminocarbonilC_1–C_5alquilo C_1–C_5, dialquilaminocarbonil C_2–C_8alquilo C_1–C_5, alquilcarbonilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, *N*–alquilcarbonil C_1–C_5–*N*– alquilaminoC_1–C_5alquilo C_1–C_5, trialquilsilil C_3–C_6alquilo C_1–C_5, fenilalquilo C_1–C_5 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro), heteroarilalquilo C_1–C_5 (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro), fenoxialquilo C_1–C_5 (donde el fenilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfinilo C_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro), heteroariloxialquilo C_1–C_5 (donde el heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, alquiltio C_1–C_3, alquilsulfiniloC_1–C_3, alquilsulfonilo C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro), haloalquenilo C_3–C_5, cicloalquilo C_3–C_8, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno o con nitro, o

heteroarilo, o heteroarilo sustituido con alquilo C_1–C_3, haloalquilo C_1–C_3, alcoxi C_1–C_3, haloalcoxi C_1–C_3, halógeno, ciano o con nitro.

En particular, el grupo de latenciación G es un grupo $-C(X^a)-R^a$ o $-C(X^b)-X^c-R^b$, y los significados de X^a, R^a, X^b, X^c y R^b son según lo definido anteriormente.

Se prefiere que G sea hidrógeno, un metal alcalino o metal alcalinotérreo, o un grupo amonio o sulfonio, donde el hidrógeno es especialmente preferido.

Preferentemente, en los compuestos de la fórmula I, el sustituyente R es hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, alquenilo C_2–C_6, alquinilo C_3–C_6, bencilo o alcoxi C_{1-4} alquilo(C_{1-4}), en particular hidrógeno, metilo, etilo, trifluormetilo, alilo, propargilo, bencilo, metoximetilo, etoximetilo o metoxietilo, y más particularmente metilo.

Preferentemente, X, Y y Z denotan hidrógeno, alquilo C_1–C_4, cicloalquilo C_3–C_6, alcoxi C_1–C_4 o halógeno, en particular metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, bromo o cloro, cuando m+n es 1–3, en particular, cuando m+n es 1–2.

Alternativamente, Y y Z, independientemente entre sí, denotan hidrógeno, alquilo C_1–C_4, cicloalquilo C_3–C_6, alcoxi C_1–C_4, halógeno, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_{1-4} o halógeno, en particular metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, cloro, bromo, fenilo o fenilo sustituido con halógeno, en particular flúor o cloro, en particular en posición 4, cuando m+n es 1–3, en particular, cuando m+n es 1–2.

En los compuestos de la fórmula I, el sustituyente A es preferentemente hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquil C_{3-6} alquilo(C_{1-4}), o cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}) donde en la porción cicloalquilo un grupo metileno es reemplazado con O u S, o A es alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{3-6}, bencilo, alcoxi C_{1-4} alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4} alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), oxetanilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, alquiltio C_{1-4} alquilo(C_{1-4}) o furanilalquilo(C_{1-4}), tetrahidrotiopiranilo o 1–alcoxi–piperidin–4–ilo(C_{1-4}) en particular hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, trifluormetilo, 2,2,2–trifluoretilo, 2,2–difluoretilo, 2–fluoretilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, alilo, propargilo, bencilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, metoxietoximetilo, metoximetoxietilo, oxetan–3–ilo, tetrahidrofuran–2–ilo, tetrahidropiran–2–ilo, tetrahidrofuran–3–ilo, tetrahidropiran–4–ilo, oxetan–3–ilmetilo, tetrahidrofuran–2–ilmetilo, tetrahidropiran–2–ilmetilo, tetrahidrofuran–3–ilmetilo, tetrahidropiran–3–ilmetilo,

tetrahidropiran–4–ilmetilo, metiltioetilo, furan–2–ilmetilo, furan–3–ilmetilo o tetrahidro–tiopiran–4–ilmetilo.

En otro grupo preferido de compuestos de la fórmula (I), R es hidrógeno, metilo, etilo, trifluormetilo, alilo, propargilo, bencilo, metoximetilo, etoximetilo o metoxietilo, X es metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, bromo o cloro, Y y Z, independientemente entre sí, son metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, cloro, bromo, fenilo o fenilo sustituido con halógeno o alquilo C_1–C_2, G es hidrógeno, A tiene los significados asignados al mismo anteriormente y m+n es 1–3.

En un grupo particularmente preferido de compuestos de la fórmula (I), R es metilo, etilo, alilo, propargilo, metoximetilo, X es metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, bromo o cloro, Y y Z, independientemente entre sí, son metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, cloro, bromo, fenilo o fenilo sustituido con halógeno o alquilo C_1–C_2, G es hidrógeno, A tiene los significados asignados al mismo anteriormente, y m+n es 1–3.

En un grupo excepcionalmente preferido de compuestos de la fórmula (I), R es metilo, etilo, metoximetilo, X es metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, bromo o cloro, Y y Z, independientemente entre sí, son metilo, etilo, ciclopropilo, metoxi, flúor, cloro, bromo, fenilo o fenilo sustituido con halógeno o alquilo C_1–C_2, G es hidrógeno, A es hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, trifluormetilo, 2,2,2–trifluoretilo, 2,2–difluoretilo, 2–fluoretilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, alilo, propargilo, bencilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, metoxietoximetilo, metoximetoxietilo, oxetan–3–ilo, tetrahidrofuran–2–ilo, tetrahidropiran–2–ilo, tetrahidrofuran–3–ilo, tetrahidropiran–4–ilo, oxetan–3–ilmetilo, tetrahidrofuran–2–ilmetilo, tetrahidropiran–2–ilmetilo, tetrahidrofuran–3–ilmetilo, tetrahidropiran–3–ilmetilo, tetrahidropiran–4–ilmetilo, metiltioetilo, furan–2–ilmetilo, furan–3–ilmetilo o tetrahidro–tiopiran–4–ilmetilo y m+n es 1–3.

Aun más preferido, R es metilo, X, Y, Z independientemente entre sí, son metilo, flúor, cloro, bromo o clorofenilo, G es hidrógeno y A es hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, ciclopropilo, ciclopropilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, alilo, propargilo, bencilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, metoxietoximetilo, metoximetoxietilo, oxetan–3–ilo, tetrahidrofuran–2–ilo, tetrahidropiran–2–ilo, tetrahidrofuran–3–ilo, tetrahidropiran–4–ilo, oxetan–3–ilmetilo, tetrahidrofuran–2–

ilmetilo, tetrahidropiran–2–ilmetilo, tetrahidrofuran–3–ilmetilo, tetrahidropiran–3–ilmetilo, tetrahidropiran–4–ilmetilo, metiltioetilo, metilsulfiniletilo, metilsulfoniletilo, furan–2–ilmetilo, furan–3–ilmetilo o tetrahidro–tiopiran–4–ilmetilo y m+n es 1–3.

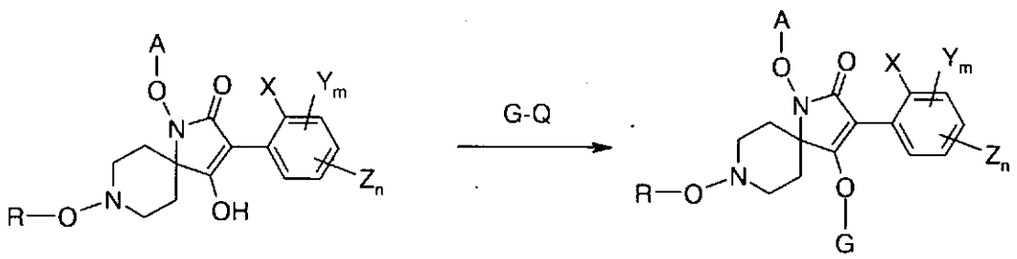
La invención cubre además sales de los compuestos de la fórmula I con aminas, bases de metal alcalino y de metal alcalinotérreo o bases de amonio cuaternario.

Entre los hidróxidos de metal alcalino y de metal alcalinotérreo como formadores de sales, deben mencionarse especialmente los hidróxidos de litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, pero especialmente los hidróxidos de sodio y potasio. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también incluyen hidratos los cuales pueden formarse durante la formación de sales.

Los ejemplos de aminas adecuadas para la formación de sales de amonio incluyen amoníaco así como también alquilaminas C_1–C_{18} primarias, secundarias y terciarias, hidroxialquilaminas C_1–C_4 y alcoxialquilaminas C_2–C_4, por ejemplo metilamina, etilamina, n–propilamina, isopropilamina, los cuatro isómeros de butilamina, n–amilamina, isoamilamina, hexilamina, heptilamina, octilamina, nonilamina, decilamina, pentadecilamina, hexadecilamina, heptadecilamina, octadecilamina, metiletilamina, metilisopropilamina, metilhexilamina, metilnonilamina, metilpentadecilamina, metiloctadecilamina, etilbutilamina, etilheptilamina, etiloctilamina, hexilheptilamina, hexiloctilamina, dimetilamina, dietilamina, di–n–propilamina, diisopropilamina, di–n–butilamina, di–n–amilamina, diisoamilamina, dihexilamina, diheptilamina, dioctilamina, etanolamina, n–propanolamina, isopropanolamina, N,N–dietanolamina, N–etilpropanolamina, N–butiletanolamina, alilamina, n–but–2–enilamina, n–pent–2–enilamina, 2,3–dimetilbut–2–enilamina, dibut–2–enilamina, n–hex–2–enilamina, propilendiamina, trimetilamina, trietilamina, tri–n–propilamina, triisopropilamina, tri–n–butilamina, triisobutilamina, tri–sec–butilamina, tri–n–amilamina, metoxietilamina y etoxietilamina; aminas heterocíclicas, por ejemplo piridina, quinolina, isoquinolina, morfolina, piperidina, pirrolidina, indolina, quinuclidina y azepina; arilaminas primarias, por ejemplo anilinas, metoxianilinas, etoxianilinas, o–, m– y p–toluidinas, fenilendiaminas, bencidinas, naftilaminas y o–, m– y p–cloroanilinas; pero especialmente trietilamina, isopropilamina y diisopropilamina.

Las bases de amonio cuaternario preferidas adecuadas para la formación de sales corresponden, por ejemplo, a la fórmula $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$ donde R_a, R_b, R_c y R_d son individual e independientemente de los otros alquilo C_1–C_4. Otras bases de tetraalquilamonio adecuadas con otros aniones pueden obtenerse, por ejemplo, por reacciones de intercambio de aniones.

Los compuestos de la invención pueden prepararse mediante una variedad de métodos. Por ejemplo, los compuestos de fórmula I, donde los sustituyentes tienen los significados asignados a los mismos anteriormente, pueden prepararse por medio de procesos conocidos *per se*, por ej. tratando los compuestos de fórmula II con un agente de alquilación, acilación, fosforilación o sulfonilación G–Q en presencia de por lo menos un equivalente de una base, donde G es el grupo alquilo, acilo, fosforilo o sulfonilo a ser incorporado y Q es un nucleófugo:



(II) (I)

Los compuestos de fórmula I, donde G es un grupo de latenciación de la fórmula $-C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$ o $-C(X^d)-NR^cR^d$ pueden prepararse mediante procedimientos conocidos según lo descrito, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266. Típicamente, los compuestos de fórmula II son tratados con un agente de acilación tal como un haluro ácido (especialmente cloruro ácido), anhídrido ácido, haloformiato (especialmente cloroformiato), halotioformiato (especialmente clorotioformiato), isocianato, isotiocianato, haluro de carbamoílo (especialmente cloruro de carbamoílo) o haluro de tiocarbamoílo (especialmente cloruro de tiocarbamoílo) en presencia de por lo menos un equivalente de una base adecuada, opcionalmente en presencia de un solvente adecuado. La base puede ser inorgánica tal como un carbonato o hidróxido de metal alcalino o un hidruro de metal, o una base orgánica tal como una amina terciaria o alcóxido de metal. Los ejemplos de bases inorgánicas adecuadas incluyen carbonato de sodio, hidróxido sódico o potásico, hidruro sódico y las bases orgánicas adecuadas

incluyen trialquilaminas tales como trimetilamina y trietilamina, piridinas u otras bases de amina tales como 1,4–diazobiciclo[2.2.2]octano y 1,8–diazabiciclo[5.4.0]undec–7–eno. Las bases preferidas incluyen trietilamina y piridina. Los solventes adecuados para esta reacción se seleccionan para que sean compatibles con los reactivos e incluyen éteres tales como tetrahidrofurano y 1,2–dimetoxietano y solventes halogenados tales como diclorometano y cloroformo. Pueden emplearse exitosamente ciertas bases, tales como piridina y trietilamina, tanto como base como solvente. Para los casos, en donde el agente de acilación es un ácido carboxílico, la acilación se efectúa preferentemente en presencia de un agente de acoplamiento tal como yoduro de 2–cloro–1–metilpiridinio, *N,N'*–diciclohexilcarbodiimida, 1–(3–dimetilaminopropil)–3–etilcarbodiimida y *N,N'*–carbodiimidazol, y una base tal como trietilamina o piridina en un solvente adecuado tal como tetrahidrofurano, diclorometano y acetonitrilo. Los procedimientos adecuados son descritos, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.

Los compuestos de fórmula I, donde G es un grupo de latenciación de la fórmula $C(X^b)–X^c–R^b$ o $–C(X^d)–NR^cR^d$, también pueden prepararse tratando los compuestos de fórmula II con fosgeno o un equivalente de fosgeno, opcionalmente en presencia de un solvente tal como tolueno o acetato de etilo, y una base y haciendo reaccionar el cloroformiato resultante, o equivalente, con un alcohol, tiol o amina bajo condiciones conocidas, según lo descrito, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.

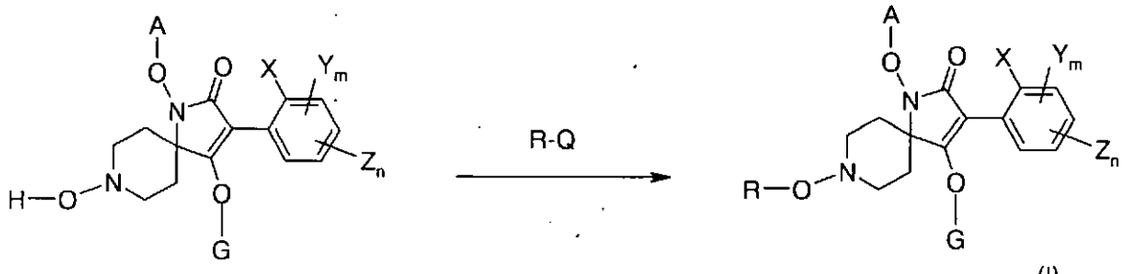
Los compuestos de fórmula I, donde G es un grupo de latenciación de la fórmula $–P(X^e)R^fR^g$ pueden prepararse a partir de los compuestos de fórmula II utilizando procedimientos descritos, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.

Los compuestos de fórmula I, donde G es un grupo de latenciación de la fórmula $–SO_2R^e$, pueden prepararse mediante reacción de los compuestos de fórmula II con un haluro de alquil o arilsulfonilo, preferentemente en presencia de por lo menos un equivalente de base.

Los compuestos de fórmula I, donde G es alquilo $C_1–C_6$, alquenilo $C_2–C_6$, alquinilo $C_3–C_6$ o un grupo de latenciación de la fórmula $CH_2–X^f–R^h$, pueden prepararse mediante tratamiento de un compuesto de la fórmula II con un

compuesto de fórmula G–Y donde Y es un halógeno (especialmente bromo o yodo), sulfonato (especialmente mesilato o tosilato) o un sulfato preferentemente en presencia de una base, bajo condiciones conocidas.

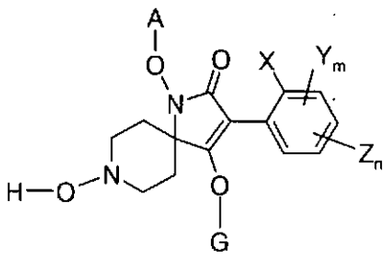
Los compuestos de fórmula I, en la cual R representa $-C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$ o $-C(X^d)-NR^cR^d\ SO_2R^e$, $P(X^e)R^fR^g$ o $CH_2-X^f-R^h$, pueden obtenerse tratando los compuestos de fórmula III con un agente de alquilación, acilación, fosforilación o sulfonilación R–Q, donde Q representa un nucleófugo, en presencia de por lo menos un equivalente de una base.



(III) (I)

Las condiciones adecuadas son las mismas a las descritas anteriormente para la conversión de los compuestos de fórmula II en los compuestos de fórmula I.

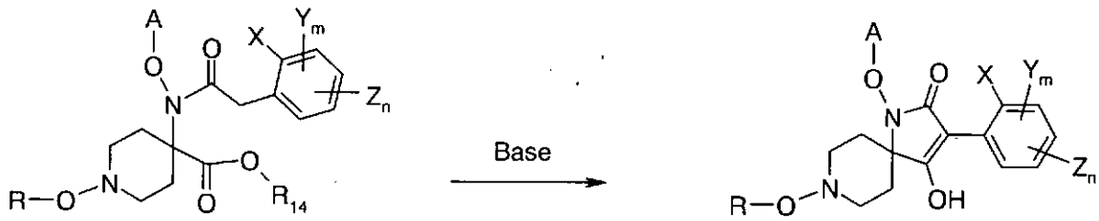
Los compuestos de fórmula III



(III)

pueden obtenerse mediante hidrogenación catalítica de los compuestos de fórmula I, en la cual R es representada mediante un grupo bencilo.

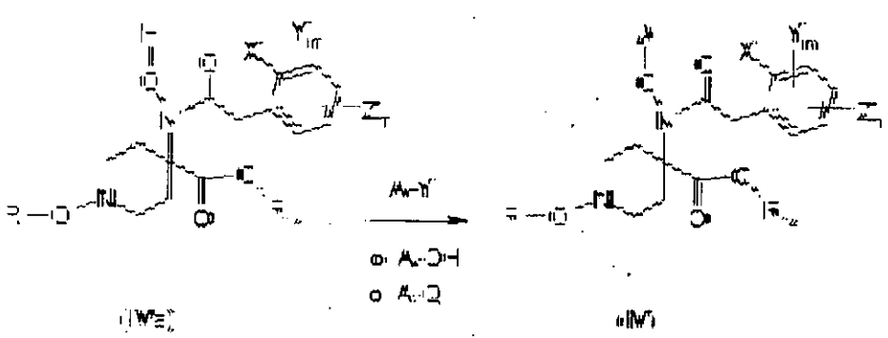
Los compuestos de fórmula II pueden prepararse por medio de ciclación de los compuestos de fórmula IV,



(IV) (II)

donde R_{14} es alquilo C_1–C_6, preferentemente en presencia de base, y opcionalmente en presencia de un solvente adecuado, mediante métodos descritos, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.

Los compuestos de fórmula IV, donde R_{14} es según lo definido anteriormente y donde A es alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquil C_{3-6} alquilo(C_{1-4}), o cicloalquil C_{3-6} alquilo(C_{1-4}) donde en la porción cicloalquilo un grupo metileno es reemplazado con O, S o NR_0, donde R_0 es alquilo C_{1-6} o alcoxi C_{1-6}, o A es alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{3-6}, cianoalquilo C_{1-6}, alcoxi C_{1-4} alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4} alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), oxetan–3–ilo, tetrahidrofuran–3–ilo, tetrahidropiran–3–ilo, tetrahidropiran–4–ilo o bencilo pueden prepararse mediante tratamiento de un compuesto de fórmula IVa (A=H) con un agente de alquilación de fórmula A–Y, donde A es el grupo alquilo a ser incorporado e Y es un halógeno (especialmente bromo o yodo), sulfonato (especialmente mesilato o tosilato) o un sulfato, preferentemente en presencia de una base, bajo condiciones conocidas.



Alternativamente, los compuestos de fórmula IV, donde R_{14} es según lo definido anteriormente y donde A es alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}), o cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}) donde en la porción cicloalquilo un grupo metileno es reemplazado con O, S o NR_0, donde R_0 es alquilo C_{1-6} o alcoxi C_{1-6}, o A es alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{3-6}, cianoalquilo C_{1-6}, alcoxi C_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4}alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), oxetan–3–ilo, tetrahidrofuran–3–ilo, tetrahidropiran–3–ilo, tetrahidropiran–4–ilo o bencilo pueden prepararse mediante tratamiento de un compuesto de la fórmula IVa (A=H) con un alcohol de fórmula A–OH, donde A es el grupo alquilo a ser incorporado, bajo las condiciones conocidas de la reacción Mitsunobu. Típicamente, el alcohol A–OH se hace reaccionar con el derivado de ácido hidroxámico IVa en presencia de un azodicarboxilato de dialquilo (preferentemente azodicarboxilato de dietilo DEAD, azodicarboxilato de diisopropilo DIAD, 1,1'–(azodicarbonil)dipiperidina ADDP, N,N,N',N'–tetrametilazodicarboxamida TMAD o equivalentes) y una trialquil– o triaril fosfina (preferentemente trifenilfosfina, tributilfosfina o equivalentes) generalmente en solventes tales como tetrahidrofurano, dioxano, diclorometano, cloroformo, dimetilformamida, tolueno o benceno a –20 hasta 80°C, preferentemente a 0°C hasta 30°C. Estas condiciones conocidas son descritas por ejemplo por O. Mitsunobu, Synthesis 1981, 1–28; B.R. Castro, Org. React. 1983, 29, 1–162; D.L. Hughes, Org. React. 1992, 42, 335–656 o D.L. Hughes, Org. Prep. Preced. Int. 1996, 28, 127–164.

Los compuestos de fórmula IV, donde R_{14} es según lo definido anteriormente y donde A es tetrahidrofuran–2–ilo o tetrahidropiran–2–ilo pueden prepararse mediante tratamiento de un compuesto de fórmula IVa (A=H) con 2,3–dihidro–furano o 3,4–dihidro–2H–pirano preferentemente en presencia de un catalizador ácido (especialmente ácido p–toluensulfónico o p–toluensulfonato de piridinio), bajo condiciones conocidas descritas, por ejemplo, por Shanzer at al., J.Am.Chem.Soc. 129, 347–354, (2007).

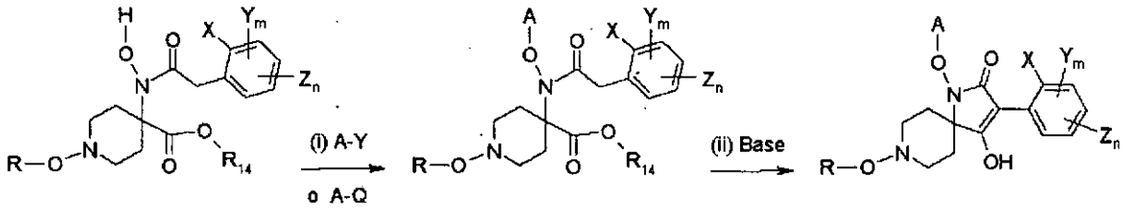
Los compuestos de fórmula IV, en donde R_{14} es según lo definido anteriormente y en donde A representa alquilcarbonilo C_{1-6}, alcoxicarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, N–di(alquil C_{1-6})carbamoílo, benzoílo, alquilsulfonilo C_{1-6} o fenilsulfonilo, pueden obtenerse tratando los compuestos de fórmula IVa (A=H) con un agente de acilación o sulfonilación A–Q, donde A es el grupo acilo o

sulfonilo a ser incorporado y Q representa un nucleófugo, en presencia de por lo menos un equivalente de una base, bajo condiciones conocidas.

Los compuestos de fórmula IV, donde R_{14} es según lo definido anteriormente y donde A es alquilcarbonilo C_{1-6}, alcoxicarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6} o N–di(alquil C_{1-6})carbamoílo, también pueden prepararse tratando los compuestos de fórmula IVa (A=H) con fosgeno o un equivalente de fosgeno, opcionalmente en presencia de un solvente tal como tolueno o acetato de etilo, y una base y haciendo reaccionar el cloroformiato resultante, o equivalente, con un alcohol o una amina, bajo condiciones conocidas.

Los compuestos de fórmula IV, donde R_{14} es según lo definido anteriormente y donde A es alquilsulfonilo C_{1-6} o fenilsulfonilo, pueden prepararse mediante reacción de los compuestos de fórmula IVa (A=H) con un haluro de alquil o fenilsulfonilo, preferentemente en presencia de por lo menos un equivalente de una base, bajo condiciones conocidas.

Las condiciones adecuadas son las mismas que las descritas anteriormente para la conversión de los compuestos de fórmula II en los compuestos de fórmula I.



(IVa) (IV) (II)

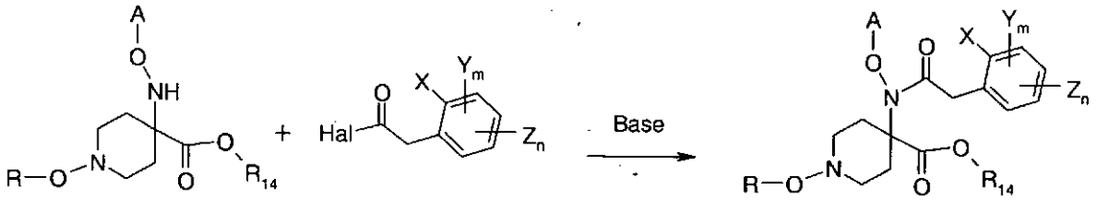
Los compuestos de fórmula II también pueden prepararse en un proceso de un recipiente de dos etapas que involucra

(i) O–alquilación, acilación o sulfonilación de los compuestos de fórmula IVa con un agente A–Y o A–Q, donde A es el grupo alquilo, acilo o sulfonilo a ser incorporado y donde Y y Q representa un nucleófugo según lo definido anteriormente, en presencia de por lo menos un equivalente de una base, y

(ii) ciclación de los compuestos intermedios de fórmula IV, preferentemente en presencia de una base adicional, por lo menos un equivalente más, y

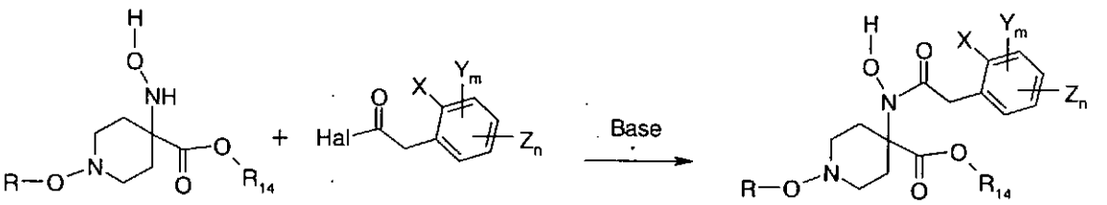
opcionalmente en presencia de un solvente adecuado, mediante métodos antes descritos.

R_{14} es típicamente alquilo C_1–C_6. La base para las etapas (i) y (ii) puede ser la misma o diferente.



(V) (VI) (IV)

Los compuestos de la fórmula general IV pueden prepararse haciendo reaccionar derivados de α–hidroxiaminoácido O–sustituido de fórmula V con haluros de fenilacetilo de fórmula VI, preferentemente en presencia de una base en un solvente adecuado mediante métodos conocidos descritos, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.

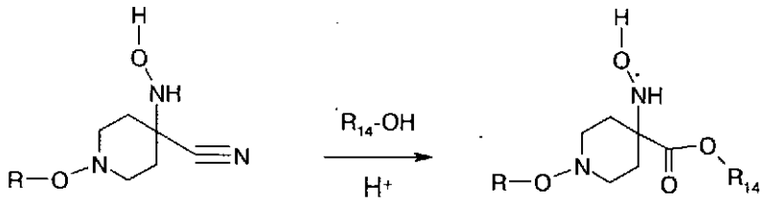


(Va) (VI) (IVa)

Para la situación en particular donde A es hidrógeno, los compuestos de fórmula IVa pueden prepararse haciendo reaccionar derivados de □–hidroxilamino ácido de fórmula Va con haluros de fenilacetilo de fórmula VI, preferentemente en presencia de una base en un solvente adecuado bajo métodos conocidos. De extrema ventaja son los métodos de acilación de derivados de □–hidroxilamino ácido de fórmula Va donde la selectividad de N–acilación puede lograrse de acuerdo con, por ejemplo, Vallée y Blandin, Organic & Biomolecular Chemistry, 4, 3125–3141, (2006) o con WO 1996/35714, y donde el uso de bases de metal de

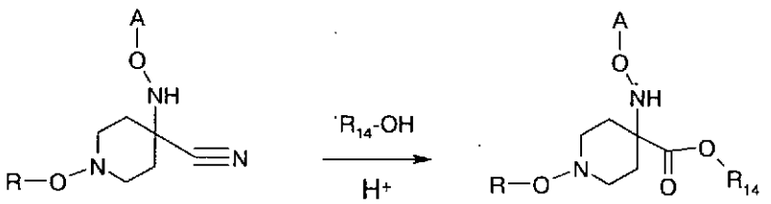
transición, metal alcalino y metal alcalinotérreo es preferido. El uso de una base suave, especialmente bicarbonatos y carbonatos de litio, sodio, potasio y cesio, y más particularmente carbonato de hidrógeno de litio, sodio, potasio y cesio, e incluso más particularmente carbonato de hidrógeno de sodio y potasio en solventes tales como diclorometano, tetrahidrofurano, dioxano o sus mezclas son condiciones de reacción preferidas. El sistema solvente para estas condiciones de acilación básicas leves también puede ser acuoso bifásico empleando, por ejemplo, acetato de etilo (o diclorometano, o cualquier solvente orgánico relacionado) y agua, según lo descrito, por ejemplo, por Ito et al., Heterocycles, 57, 881–894, (2002).

Los haluros de fenilacetilo de fórmula VI, donde Hal es Cl o Br, son compuestos conocidos o se pueden preparar mediante métodos conocidos según lo descrito, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.



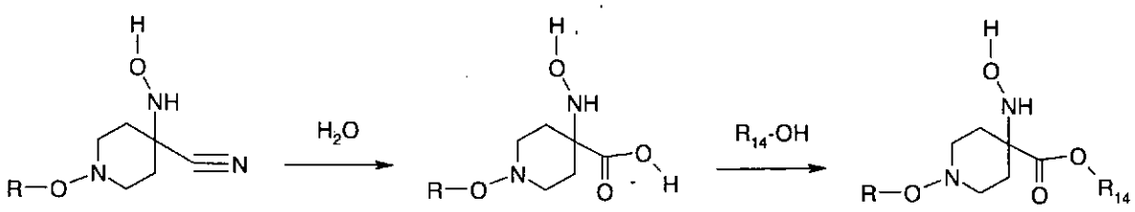
(VIIa) (Va)

Los ésteres de□–hidroxilaminoácido de la fórmula Va, donde R_{14} es alquilo C_1–C_6, pueden prepararse haciendo reaccionar nitrilos de □–hidroxilamino de la fórmula VIIa con un alcohol de la fórmula $R_{14}OH$, preferentemente en presencia de un ácido fuerte (especialmente ácido sulfúrico o ácido clorhídrico), bajo condiciones conocidas.



(VII) (V)

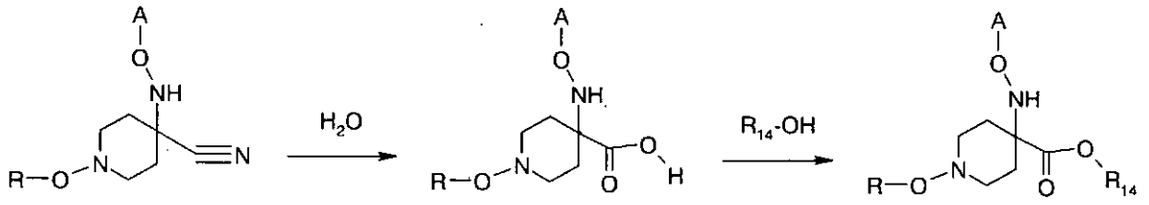
Más generalmente,los ésteres de ácido □–hidroxilamino O–sustituido de la fórmula V, donde R_{14} es alquilo C_1–C_6 y donde A es según lo definido anteriormente, pueden prepararse haciendo reaccionar nitrilos de □–hidroxilamino O–sustituidos de la fórmula VII con un alcohol de la fórmula $R_{14}OH$, preferentemente en presencia de un ácido fuerte (especialmente ácido sulfúrico o ácido clorhídrico), bajo condiciones conocidas.



(VIIa) (XIa) (Va)

Los ésteres de □–hidroxilaminoácido de la fórmula Va, donde R_{14} es alquilo C_1–C_6, también pueden prepararse mediante métodos conocidos a partir de □–hidroxilaminoácidos de fórmula XIa. La esterificación de XIa con un alcohol de la fórmula $R_{14}OH$ bajo activación de cloruro de tionilo es un ejemplo típico para la preparación de ésteres Va, según lo descrito por ejemplo en WO09/049851, aunque también pueden aplicarse otros métodos de esterificación conocidos, tales como por ejemplo tratamiento de un compuesto de la fórmula XIa con un alcohol de la fórmula $R_{14}OH$ bajo condiciones ácidas (típicamente H_2SO_4 o HCl). Para la situación en particular donde R_{14} es metilo, un compuesto de la fórmula XIa también puede ser tratado con diazometano o trimetilsilildiazometano, o con cloruro de acetilo en metanol. Los compuestos XIa y Va pueden aislarse como aminas libres o sales de amina.

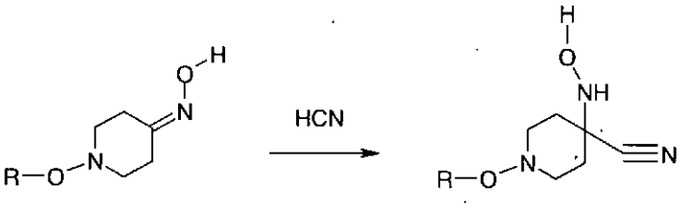
Los □–hidroxilaminoácidos de fórmula XIa pueden prepararse por sí mismos mediante métodos conocidos, típicamente bajo condiciones de hidrólisis generalmente ácidos o básicos, a partir de nitrilos de □–hidroxilamino de fórmula VIIa. Un ejemplo representativo para la hidrólisis de nitrilos (compuesto VIIa) en su correspondiente funcionalidad ácido carboxílico (compuesto XIa) bajo condiciones de H_2SO_4 o HCl acuosas pueden encontrarse, por ejemplo, en E.F.G. Duynstee et al., Recueil Trav. Chim. Pays–Bas 84, 1442–1451, (1965).



(VII) (XI) (V)

Más en general, los ésteres de ácido □–hidroxilamino O–sustituidos de la fórmula V, donde R_{14} es alquilo C_1–C_6 y donde A es según lo definido anteriormente, también pueden prepararse mediante métodos conocidos a partir de ácidos O–sustituidos de □–hidroxilamino de fórmula XI. La esterificación de XI con un alcohol de la fórmula $R_{14}OH$ bajo la activación con cloruro de tionilo es un ejemplo típico para la preparación los ésteres V, según lo descrito por ejemplo en WO09/049851, pero también pueden aplicarse otros métodos conocidos de esterificación, tales como por ejemplo tratamiento de un compuesto de la fórmula XI con un alcohol de la fórmula $R_{14}OH$ bajo condiciones ácidas (típicamente H_2SO_4 o HCl). Para la situación en particular donde R_{14} es metilo, un compuesto de la fórmula XI también puede ser tratado con diazometano o trimetilsilildiazometano, o con cloruro de acetilo en metanol. Los compuestos XI y V también pueden ser aislados como aminas libres o sales de aminas.

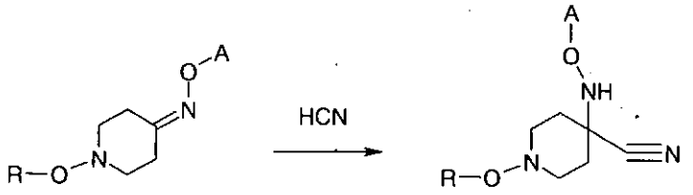
Los ácidos O–sustituidos de □–hidroxilamino de formula XI pueden prepararse ellos mismos mediante métodos conocidos, típicamente bajo condiciones de hidrólisis generalmente ácidas o básicas, a partir de nitrilos O–sustituidos de □–hidroxilamino de fórmula VII.



(VIIIa) (VIIa)

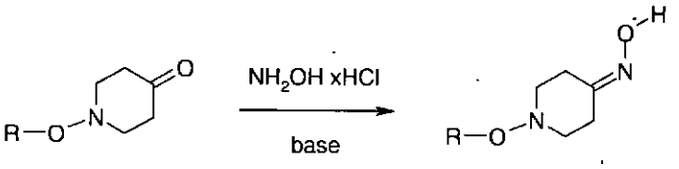
Los nitrilos de □–hidroxilamino de la fórmula VIIa pueden prepararse haciendo reaccionar oximas de la fórmula VIIIa con cianuro de hidrógeno, bajo

condiciones conocidas. Es particularmente ventajoso el método leve utilizando una fuente de cianuro (especialmente cianuro de sodio o potasio) en un buffer de fosfato acuoso de acuerdo, por ejemplo, con Porter y Hellerman, J.Am.Chem.Soc. 66, 1652–55, (1944) y J.Am.Chem.Soc. 61, 754, (1939).



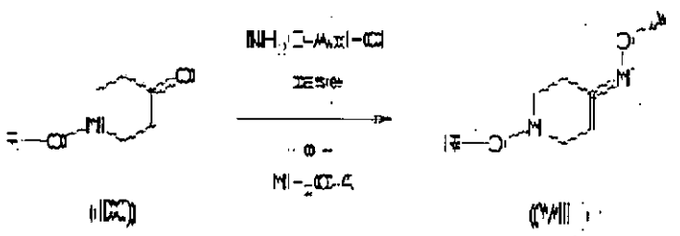
(VIII) (VII)

Más generalmente, los nitrilos O–sustituidos de □–hidroxilamino de la fórmula VII, donde A es según lo definido anteriormente, pueden prepararse haciendo reaccionar oximas O–sustituidas de la fórmula VIII con cianuro de hidrógeno, bajo condiciones conocidas. Particularmente ventajoso es el método leve utilizando una fuente de cianuro (especialmente cianuro sódico o potásico) en un buffer de fosfato acuoso de acuerdo, por ejemplo, con Porter y Hellerman, J.Am.Chem.Soc. 66, 1652–55, (1944) y J.Am.Chem.Soc. 61, 754, (1939).



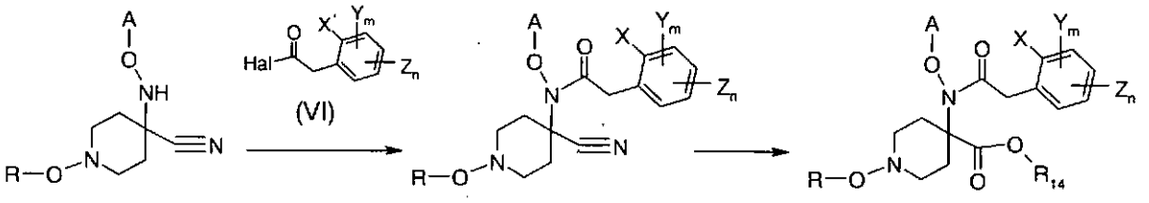
(IX) (VIIIa)

Las oximas de la fórmula VIIIa pueden prepararse haciendo reaccionar cetonas de la fórmula IX con clorhidrato de hidroxilamina (o base libre de hidroxil amina; u otra sal halogenada o sal equivalente de hidroxilamina), opcionalmente en presencia de una base y en un solvente adecuado, bajo condiciones convencionales.



Más en general, las oximas O–sustituidas de la fórmula VIII, donde A es según lo definido anteriormente, pueden prepararse haciendo reaccionar las cetonas de la fórmula IX con un clorhidrato de hidroxilamina O–sustituido de la fórmula $H_2NO–A$ xHCl (u otra sal halogenada o sal equivalente de la correspondiente hidroxilamina O–sustituida $H_2NO–A$), preferentemente en presencia de una base y en un solvente adecuado, bajo condiciones convencionales. Las cetonas de la fórmula IX también pueden hacerse reaccionar con una base libre de hidroxilamina O–sustituida de la fórmula $H_2NO–A$ bajo condiciones de reacción convencionales similares.

Los compuestos de la fórmula IX, donde R es alquilo $C_{1–6}$, haloalquilo $C_{1–6}$, cianoalquilo $C_{1–6}$, alquenilo $C_2–C_6$, alquinilo $C_3–C_6$, alcoxi $C_{1–4}$alquilo($C_{1–4}$), alcoxi $C_{1–4}$alcoxi($C_{1–4}$)alquilo($C_{1–4}$) o un grupo bencilo, son conocidos o pueden obtenerse, por ejemplo, de acuerdo con Major y Dursch, Journal of Organic Chemistry 26, 1867–74, (1961).

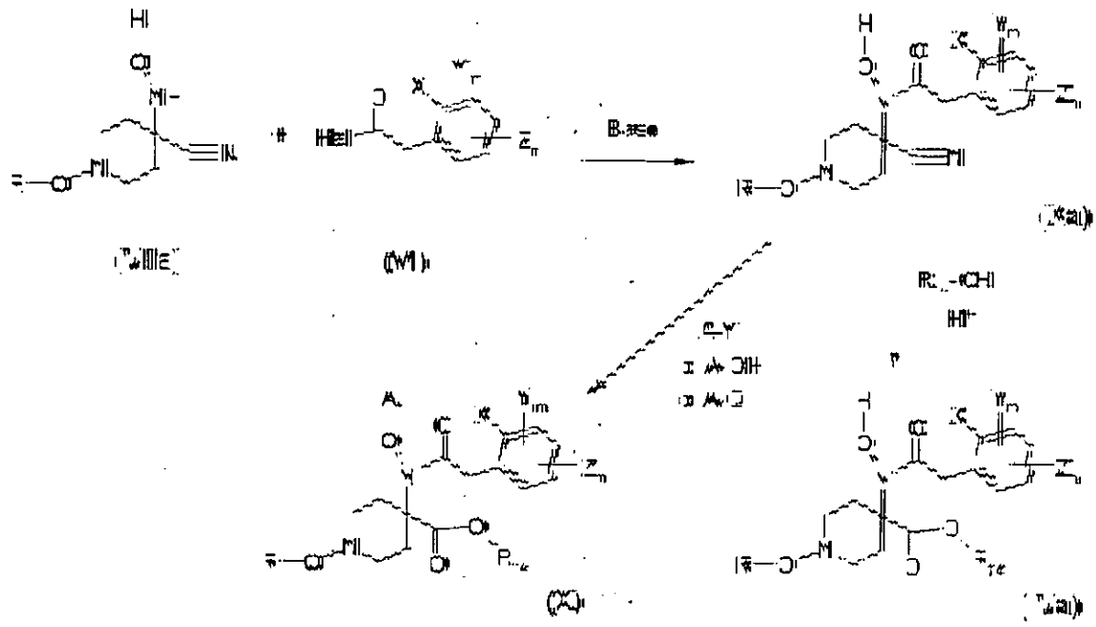


(VII) (X) (IV)

Alternativamente, los compuestos de la fórmula general IV pueden prepararse sometiendo los derivados de la fórmula X a alcohólisis con $R_{14}OH$, preferentemente en un medio ácido fuerte (especialmente ácido sulfúrico o ácido clorhídrico) mediante métodos conocidos descritos, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.

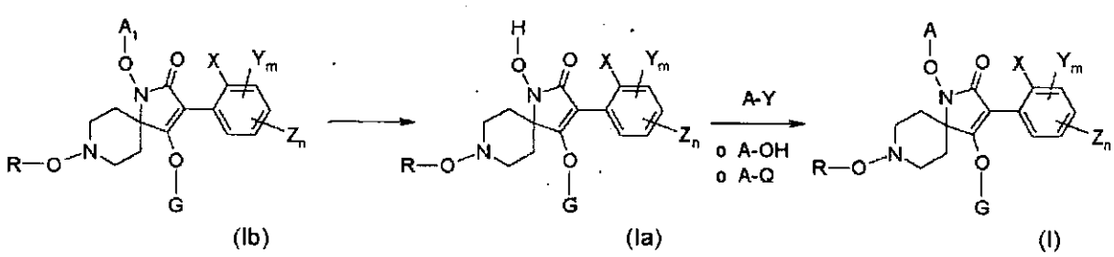
Los compuestos de la fórmula X pueden prepararse ellos mismos haciendo reaccionar nitrilos O–sustituidos de □–hidroxilamino de la fórmula VII con haluros

de fenilacetilo de la fórmula VI, preferentemente en presencia de una base en un solvente adecuado mediante métodos conocidos descritos, por ejemplo, en WO 2000/068196 y JP 200107266.



Estas condiciones de reacción también son aplicables para la situación en particular donde A es hidrógeno, permitiendo preparar los compuestos de la fórmula IVa a partir de nitrilos de □–hidroxilamino de la fórmula VIIa por medio de los compuestos de la fórmula Xa.

Los compuestos de fórmula X, en la cual R_{14} y A son según lo definido anteriormente, pueden obtenerse, adicionalmente, tratando los compuestos de fórmula Xa (A=H) con agentes A–Y, A–OH, A–Q o 2,3–dihidro–furano o 3,4–dihidro–2H–pirano, donde A, Y y Q son según lo definido anteriormente, bajo las mismas condiciones descritas anteriormente para la conversión de los compuestos de la fórmula IVa en compuestos de la fórmula IV.



(Ib) (Ia) (I)

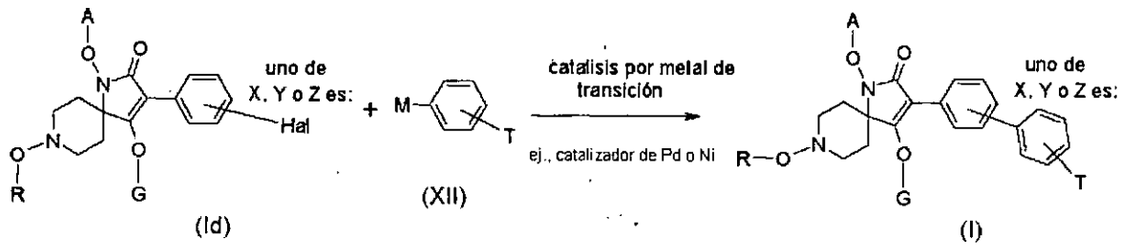
Los compuestos de la fórmula I también pueden prepararse mediante tratamiento de un compuesto de la fórmula Ia (A=H) con un agente de alquilación,

acilación o sulfonilación A–Y o A–Q, donde A es el grupo alquilo, acilo o sulfonilo a ser incorporado y donde Y y Q representa un nucleófugo según lo definido anteriormente, en presencia de por lo menos un equivalente de una base, y bajo las condiciones para la transformación de un compuesto de la fórmula IVa en un compuesto de la fórmula IV descrito anteriormente.

Alternativamente, los compuestos de la fórmula I también pueden prepararse mediante tratamiento de un compuesto de la fórmula Ia (A=H) con un alcohol A–OH, donde A es el grupo alquilo a ser incorporado, bajo las condiciones de reacción Mitsunobu para la transformación de un compuesto de la fórmula IVa en un compuesto de la fórmula IV descrito anteriormente.

Los compuestos de fórmula I, donde A es tetrahidrofuran–2–ilo o tetrahidropiran–2–ilo pueden prepararse mediante tratamiento de un compuesto de fórmula Ia (A=H) con 2,3–dihidro–furano o 3,4–dihidro–2H–pirano preferentemente en presencia de un catalizador ácido (especialmente ácido p–toluensulfónico o p–toluensulfonato de piridinio), bajo condiciones conocidas descritas por ejemplo por Shanzer at al., J.Am.Chem.Soc. 129, 347–354, (2007).

Los compuestos de la fórmula Ia pueden prepararse ellos mismos a partir de los compuestos de la fórmula Ib incorporando un grupo A_1 el cual puede fácilmente disociarse. A_1 representa un subgrupo en particular del grupo A definido anteriormente. Como un ejemplo, para la situación en particular donde A_1 es representado mediante un grupo bencilo, los compuestos de la fórmula Ia pueden obtenerse mediante hidrogenación catalítica de los compuestos de fórmula Ib. Asimismo, para la situación en particular donde A_1 es representado mediante un grupo CH_2OMe, los compuestos de la fórmula Ia pueden obtenerse mediante tratamientos de los compuestos de fórmula Ib con, por ejemplo, yoduro de trimetilsililo o bromuro de trimetilsililo bajo condiciones conocidas.



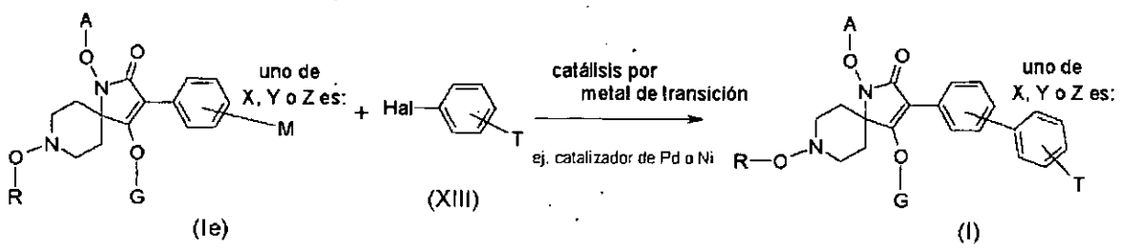
(Id) (XII) (I)

Hal es cloro, bromo o yodo, o un pseudohalógeno tal como triflato

M es B, Sn, Mg, Zn, etc., junto con ligandos y/o sustituyentes

T es alquilo C1-4, haloalquilo C1-4 **halógeno o ciano**

Los compuestos de la fórmula I, donde X, Y o Z es fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_{1-4}, haloalquilo C_{1-4}, halógeno o ciano, pueden prepararse haciendo reaccionar un correspondiente precursor de halógeno de la fórmula Id, donde Hal es cloro, bromo, yodo o un pseudohalógeno tal como haloalquilsulfonato C_{1-4}, especialmente triflato, con una especie de fenilo organometálico apropiado de la fórmula XII, donde T es alquilo C_{1-4}, haloalquilo C_{1-4}, halógeno o ciano y M es por ejemplo B, Sn, Si, Mg o Zn sosteniendo otros ligandos y/o sustituyentes, por medio de una reacción catalizada por metal de transición. La especie organometálica de la fórmula XII es por ejemplo un ácido arilborónico T–Fenil–$B(OH)_2$, o una sal adecuada o éster de la misma, que reaccionará con un compuesto de la fórmula Id bajo condiciones catalizadas por paladio o níquel, tales como por ejemplo las condiciones de Suzuki–Miyaura. Puede utilizarse una variedad de metales, catalizadores y ligandos en este tipo de reacción. Las condiciones de reacción y los sistemas catalíticos para ese tipo de transformación han sido descritos, por ejemplo, en WO08/071405.



(Ie) (XIII) (I)

M es B, Sn, Mg, Zn, etc. junto con ligandos y/o sustituyentes

Hal es cloro, bromo o yodo, o un pseudohalógeno tal como triflato

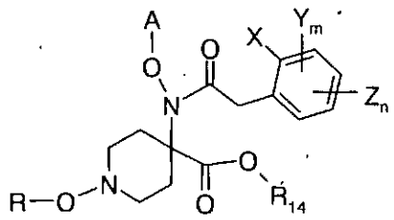
T es alquilo C1-4, haloalquiloC1-4 **halógeno o ciano**

Un experto en la técnica reconocerá que la polaridad en los dos centros de reacción en este proceso de entrecruzamiento puede ser revertida. Los compuestos de la fórmula I, donde X, Y o Z es fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_{1-4}, haloalquilo C_{1-4}, halógeno o ciano, también pueden prepararse haciendo reaccionar una especie organometálica correspondiente de la fórmula Ie, donde M

es por ejemplo B, Sn, Si, Mg o Zn sosteniendo otros ligandos y/o sustituyentes, con un haluro de arilo de la fórmula XIII, donde Hal es cloro, bromo, yodo o un pseudohalógeno tal como haloalquilsulfonato C_{1-4}, especialmente triflato, por medio de una reacción catalizada por un metal de transición y bajo condiciones similares según lo descrito anteriormente.

El estado de oxidación de azufre de los compuestos de la fórmula I, II, III, IV y X, y de los compuestos intermedios de la fórmula V, VII, VIII y XI, donde A está incorporando ese tipo de átomo de S, tal como por ejemplo cuando A es alquiltio C_{1-4} alquilo(C_{1-4}), puede adaptarse fácilmente a partir del estado de oxidación de sulfuro en el nivel de sulfóxido o sulfona por medio de una reacción de oxidación que involucra reactivos tales como, por ejemplo, ácido m–cloroperbenzoico (MCPBA), oxona, peryodato sódico, hipoclorito sódico u hipoclorito de terc–butilo entre muchos otros.

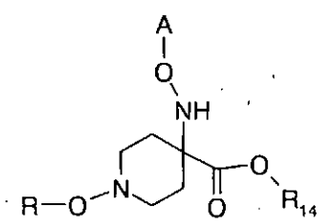
Los compuestos de la fórmula IV, V, VII y X, y sus sales, son novedosos, han sido específicamente diseñados para la síntesis de los compuestos de la fórmula I y como tales forman un aspecto adicional de la invención. Por ende, los compuestos de la fórmula IV



(IV),

y sus sales, donde X, Y, Z, m, n, R y A tienen los significados que se les asigna en lo que antecede y donde R_{14} es alquilo C_{1-6};

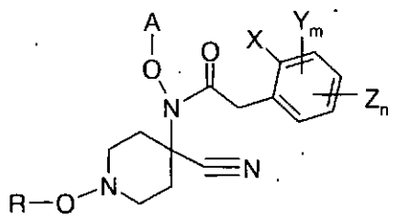
los compuestos de la fórmula V



(V),

y sus sales, donde R y A tienen los significados asignados a los mismos anteriormente y donde R_{14} es alquilo C_1–C_6;

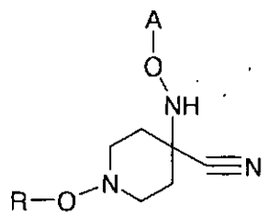
los compuestos de la fórmula X



(X),

y las sales de los mismos, donde X, Y, Z, m, n, R y A tienen los significados asignados a los mismos anteriormente y

los compuestos de la fórmula VII



(VII),

y las sales de los mismos, donde R y A tienen los significados asignados a los mismos anteriormente son novedosos.

Los compuestos de partida remanentes y compuestos intermedios de los esquemas de reacción son conocidos o se pueden preparar de acuerdo con métodos conocidos por un experto en la técnica.

Los reactantes pueden hacerse reaccionar en presencia de una base. Los ejemplos de bases adecuadas son hidróxidos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, amidas de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, alcóxidos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, carbonatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, dialquilamidas de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos o alquilsililamidas de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, alquilaminas, alquilendiaminas, cicloalquilaminas saturadas o insaturadas libres o N–alquiladas, heterociclos básicos, hidróxidos de amonio y aminas carbocíclicas. Los ejemplos que pueden mencionarse son hidróxido sódico, hidruro sódico, amida sódica, metóxido sódico, acetato sódico, carbonato sódico, terc–butóxido de potasio, hidróxido potásico, carbonato potásico, hidruro potásico, diisopropilamida de litio, bis(trimetilsilil)amida de litio, hidruro de calcio, trietilamina, diisopropiletilamina, trietilendiamina, ciclohexilamina, N–ciclohexil–N,N–dimetilamina, N,N–dietilanilina, piridina, 4–

(N,N–dimetilamino)piridina, quinuclidina, N–metilmorfolina, hidróxido de benciltrimetilamonio y 1,8–diazabiciclo[5.4.0]undec–7–eno (DBU).

Los reactantes pueden hacerse reaccionar uno con el otro como tales, es decir, sin agregar un solvente o diluyente. Sin embargo, en la mayoría de los casos, resulta ventajoso agregar un solvente inerte o diluyente o una mezcla de estos. Si la reacción se lleva a cabo en presencia de una base, las bases que son empleadas en exceso, tales como trietilamina, piridina, N–metilmorfolina o N,N–dietilanilina, también pueden actuar como solventes o diluyentes.

La reacción se lleva a cabo, ventajosamente, en un rango de temperatura entre aproximadamente –80°C y aproximadamente +140°C, preferentemente entre aproximadamente –30°C y aproximadamente +100°C, en muchos casos en el rango entre temperatura ambiente y aproximadamente +80°C.

Un compuesto I puede ser convertido de manera conocida per se en otro compuesto I reemplazando uno o más sustituyentes del compuesto de partida I en forma habitual mediante otro u otros sustituyentes de acuerdo con la invención.

Dependiendo de la elección de las condiciones de reacción y de los materiales de partida los cuales son adecuados en cada caso, es posible, por ejemplo, en una etapa de reacción solamente reemplazar un sustituyente por otro sustituyente de acuerdo con la invención, o una pluralidad de sustituyentes pueden reemplazarse con otros sustituyentes de acuerdo con la invención en el mismo paso de reacción.

Las sales de los compuestos I pueden prepararse de manera conocida per se. Por lo tanto, por ejemplo, se obtienen sales de adición de ácido de los compuestos I mediante tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo intercambiador de iones adecuado y sales con bases se obtienen mediante tratamiento con una base adecuada o con un reactivo intercambiador de iones adecuados.

Las sales de los compuestos I pueden convertirse en forma habitual en los compuestos libres I, sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante tratamiento con un compuesto básico adecuado o con un reactivo intercambiador de iones adecuado y sales con bases, por ejemplo, mediante tratamiento con un ácido adecuado o con un reactivo intercambiador de iones adecuado.

Las sales de los compuestos I pueden convertirse en forma conocida per se en otras sales de los compuestos I, sales de adición de ácido, por ejemplo, en otras sales de adición de ácido, por ejemplo mediante tratamiento de una sal de ácido inorgánico tal como clorhidrato con una sal de metal adecuado tal como sal de sodio, bario o plata, de un ácido, por ejemplo con acetato de plata, en un solvente adecuado en el cual una sal inorgánica que se forma, por ejemplo cloruro de plata, es insoluble y así precipita de la mezcla de reacción.

Dependiendo del procedimiento o de las condiciones de reacción, los compuestos I, los cuales tienen propiedades formadoras de sales pueden obtenerse en forma libre o en la forma de sales.

Los compuestos I y, donde resulte apropiado, sus tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden estar presentes en la forma de uno de los isómeros los cuales son posibles o como una mezcla de estos, por ejemplo en la forma de isómeros puros, tales como antípodas y/o diastereómeros, o como mezclas de isómeros, tales como mezclas de enantiómeros, por ejemplo racematos, mezclas de diastereómeros o mezclas de racematos, dependiendo de la cantidad, configuración absoluta y relativa de átomos de carbono asimétricos que se producen en la molécula y/o dependiendo de la configuración de enlaces dobles no aromáticos que se producen en la molécula; la invención se refiere a los isómeros puros y también a todas las mezclas de isómeros que son posibles y debe entenderse en cada caso en este sentido en lo precedente y en lo que sigue, incluso cuando no se mencionan específicamente detalles estereoquímicos en cada caso.

Las mezclas diastereoméricas o mezclas de racematos de los compuestos I, en forma libre o en forma de sal, las cuales pueden obtenerse dependiendo de cuales materiales de partida y procedimientos han sido seleccionados pueden separarse en forma conocida en los diastereómeros puros o racematos sobre la base de las diferencias fisicoquímicas de los componentes, por ejemplo mediante cristalización fraccional, destilación y/o cromatografía.

Las mezclas enantioméricas, tales como racematos, que pueden obtenerse en forma similar pueden resolverse en las antípodas ópticas mediante métodos conocidos, por ejemplo por recristalización a partir de un solvente ópticamente activo, mediante cromatografía sobre adsorbentes quirales, por ejemplo

cromatografía líquida de alto rendimiento (HPLC, según sus siglas en inglés) sobre celulosa de acetilo, con la ayuda de microorganismos adecuados, por disociación con enzimas inmovilizadas específicas, por medio de la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo utilizando éteres de corona quirales, donde solo un enantiómero forma un complejo, o mediante conversión en sales diastereoméricas, por ejemplo haciendo reaccionar un racemato de producto final básico con un ácido ópticamente activo, tal como un ácido carboxílico, por ejemplo alcanfor, ácido tartárico o málico, o ácido sulfónico, por ejemplo ácido canforsulfónico, y separando la mezcla diastereomérica la cual puede obtenerse de este modo, por ejemplo por cristalización fraccionar en base a sus solubilidades diferentes, para dar los diastereómeros, de los cuales puede liberarse el enantiómero deseado mediante la acción de agentes adecuados, por ejemplo agentes básicos.

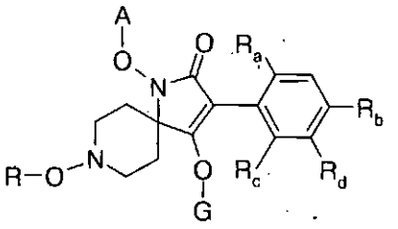
Pueden obtenerse diastereómeros o enantiómeros puros de acuerdo con la invención no solo separando mezclas isoméricas adecuadas, sino además mediante métodos generalmente conocidos de síntesis diastereoselectiva o enantioselectiva, por ejemplo llevando a cabo el proceso de acuerdo con la invención con materiales de partida de una estereoquímica adecuada.

Resulta ventajoso aislar o sintetizar en cada caso el isómero biológicamente más eficaz, por ejemplo enantiómero o diastereómero, o mezcla de isómeros, por ejemplo mezcla de enantiómeros o mezcla de diastereómeros, si los componentes individuales tienen una actividad biológica diferente.

Los compuestos I y, donde resulte apropiado, sus tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal, pueden, en caso apropiado, también obtenerse en la forma de hidratos y/o incluyen otros solventes, por ejemplo aquellos los cuales han sido utilizados para la cristalización de compuestos los cuales están presentes en forma sólida.

Los compuestos de acuerdo con las siguientes Tablas 1 a 102 que aparecen a continuación pueden prepararse de acuerdo con los métodos descritos con anterioridad. Los ejemplos que siguen tienen el propósito de ilustrar la invención y mostrar los compuestos preferidos de fórmula I.

Tabla 1: Esta tabla describe los 132 compuestos T1.001 a T1.132 de la fórmula Ic:



(Ic),

donde R es CH_3, A es hidrógeno, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido a continuación:

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.001	Br	H	H	H
T1.002	Cl	H	H	H
T1.003	CH_3	H	H	H
T1.004	CH_2CH_3	H	H	H
T1.005	OCH_3	H	H	H
T1.006	Br	Cl	H	H
T1.007	Cl	Br	H	H
T1.008	Cl	Cl	H	H
T1.009	Cl	CH_3	H	H
T1.010	CH_3	Cl	H	H
T1.011	CH_3	CH_3	H	H
T1.012	Cl	H	Cl	H
T1.013	Cl	H	CH_3	H
T1.014	Cl	H	CH_2CH_3	H
T1.015	Cl	H	OCH_3	H
T1.016	CH_3	H	CH_3	H
T1.017	CH_3	H	CH_2CH_3	H
T1.018	CH_3	H	OCH_3	H
T1.019	CH_2CH_3	H	CH_2CH_3	H
T1.020	CH_2CH_3	H	OCH_3	H
T1.021	OCH_3	H	OCH_3	H
T1.022	Br	H	H	Cl

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.023	Br	H	H	CH_3
T1.024	Br	H	H	4–Cl–C_6H_4
T1.025	Cl	H	H	Cl
T1.026	Cl	H	H	CH_3
T1.027	Cl	H	H	4–Cl–C_6H_4
T1.028	CH_3	H	H	Br
T1.029	CH_3	H	H	Cl
T1.030	CH_3	H	H	CH_3
T1.031	CH_3	H	H	C_6H_5
T1.032	CH_3	H	H	4–Cl–C_6H_4
T1.033	CH_2CH_3	H	H	CH_3
T1.034	CH_2CH_3	H	H	4–Cl–C_6H_4
T1.035	OCH_3	H	H	CH_3
T1.036	OCH_3	H	H	4–Cl–C_6H_4
T1.037	Cl	H	Cl	Br
T1.038	CH_3	H	CH_3	Br
T1.039	CH_3	H	CH_3	Cl
T1.040	CH_3	H	CH_3	4–Cl–C_6H_4
T1.041	Br	Cl	H	CH_3
T1.042	Br	CH_3	H	CH_3
T1.043	Cl	Cl	H	Cl
T1.044	Cl	Br	H	CH_3
T1.045	Cl	Cl	H	CH_3
T1.046	Cl	CH_3	H	Cl
T1.047	Cl	CH_3	H	CH_3
T1.048	CH_3	Br	H	CH_3
T1.049	CH_3	Cl	H	CH_3
T1.050	CH_3	CH_3	H	CH_3
T1.051	CH_3	CH_3	H	4–Cl–C_6H_4
T1.052	Br	Br	CH_3	H
T1.053	Br	Cl	CH_3	H

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.054	Br	CH_3	Br	H
T1.055	Br	CH_3	Cl	H
T1.056	Cl	Br	CH_3	H
T1.057	Cl	Cl	Cl	H
T1.058	Cl	Cl	CH_3	H
T1.059	Cl	CH_3	Cl	H
T1.060	Cl	CH_3	CH_2CH_3	H
T1.061	Cl	CH_3	OCH_3	H
T1.062	Cl	4–Cl–C_6H_4	Cl	H
T1.063	Cl	4–Cl–C_6H_4	CH_3	H
T1.064	Cl	4–Cl–C_6H_4	CH_2CH_3	H
T1.065	Cl	4–Cl–C_6H_4	OCH_3	H
T1.066	CH_3	Br	CH_3	H
T1.067	CH_3	Cl	CH_3	H
T1.068	CH_3	CH_3	Br	H
T1.069	CH_3	CH_3	Cl	H
T1.070	CH_3	CH_3	CH_3	H
T1.071	CH_3	CH_3	CH_2CH_3	H
T1.072	CH_3	CH_3	OCH_3	H
T1.073	CH_3	4–Cl–C_6H_4	CH_3	H
T1.074	CH_3	4–Cl–C_6H_4	CH_2CH_3	H
T1.075	CH_3	4–Cl–C_6H_4	OCH_3	H
T1.076	CH_2CH_3	Br	Br	H
T1.077	CH_2CH_3	Br	Cl	H
T1.078	CH_2CH_3	Br	CH_3	H
T1.079	CH_2CH_3	Br	CH_2CH_3	H
T1.080	CH_2CH_3	Br	OCH_3	H
T1.081	CH_2CH_3	Cl	Br	H
T1.082	CH_2CH_3	Cl	Cl	H
T1.083	CH_2CH_3	Cl	CH_3	H
T1.084	CH_2CH_3	Cl	CH_2CH_3	H

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.085	CH_2CH_3	Cl	OCH_3	H
T1.086	CH_2CH_3	CH_3	Br	H
T1.087	CH_2CH_3	CH_3	Cl	H
T1.088	CH_2CH_3	CH_3	CH_2CH_3	H
T1.089	CH_2CH_3	CH_3	OCH_3	H
T1.090	CH_2CH_3	CH_2CH_3	CH_3	H
T1.091	CH_2CH_3	CH_2CH_3	CH_2CH_3	H
T1.092	CH_2CH_3	4–Cl–C_6H_4	Br	H
T1.093	CH_2CH_3	4–Cl–C_6H_4	CH_2CH_3	H
T1.094	CH_2CH_3	4–Cl–C_6H_4	OCH_3	H
T1.095	OCH_3	Br	CH_3	H
T1.096	OCH_3	Cl	CH_3	H
T1.097	OCH_3	CH_3	Br	H
T1.098	OCH_3	CH_3	Cl	H
T1.099	OCH_3	CH_3	OCH_3	H
T1.100	OCH_3	4–Cl–C_6H_4	OCH_3	H
T1.101	CH_3	CH_3	CH_3	F
T1.102	CH_3	CH_3	CH_3	Cl
T1.103	CH_3	CH_3	CH_3	Br
T1.104	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.105	CH_3	CH_3	CH_3	4–Cl–C_6H_4
T1.106	Cl	CH_3	CH_3	CH_3
T1.107	CH_3	Cl	CH_3	CH_3
T1.108	CH_3	CH_3	Cl	CH_3
T1.109	CH_2CH_3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.110	OCH_3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.111	Ciclo–C3	CH_3	CH_3	CH_3
T1.112	CH_3	CH_3	Ciclo–C3	H
T1.113	CH_3	F	H	Br
T1.114	CH_3	CH_3	H	Br
T1.115	CH_2CH_3	CH_3	H	CH_3

No.	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.116	OCH_3	CH_3	H	CH_3
T1.117	Ciclo–C3	CH_3	H	CH_3
T1.118	CH_2CH_3	Cl	H	CH_3
T1.119	OCH_3	Cl	H	CH_3
T1.120	Ciclo–C3	Cl	H	CH_3
T1.121	Cl	H	CH_3	CH_3
T1.122	CH_3	H	CH_3	CH_3
T1.123	CH_2CH_3	H	CH_3	CH_3
T1.124	OCH_3	H	CH_3	CH_3
T1.125	Ciclo–C3	H	CH_3	CH_3
T1.126	F	H	Cl	CH_3
T1.127	Cl	H	F	CH_3
T1.128	H	CH_3	CH_3	CH_3
T1.129	Br	CH_3	CH_3	CH_3
T1.130	CH_3	H	Cl	CH_3
T1.131	CH_3	H	Br	CH_3
T1.132	Br	H	CH_3	CH_3

Ciclo–C3 significa ciclopropilo.

Tabla 2: Esta Tabla describe los 132 compuestos T2.001 a T2.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 3: Esta Tabla describe los 132 compuestos T3.001 a T3.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 4: Esta Tabla describe los 132 compuestos T4.001 a T4.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es n–C_3H_7, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

000265

Tabla 5: Esta Tabla describe los 132 compuestos T5.001 a T5.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es i–C_3H_7, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 6: Esta Tabla describe los 132 compuestos T6.001 a T6.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es n–C_4H_9, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 7: Esta Tabla describe los 132 compuestos T7.001 a T7.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es i–C_4H_9, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 8: Esta Tabla describe los 132 compuestos T8.001 a T8.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es t–C_4H_9, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 9: Esta Tabla describe los 132 compuestos T9.001 a T9.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es ciclopropilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 10: Esta Tabla describe los 132 compuestos T10.001 a T10.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es ciclopentilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 11: Esta Tabla describe los 132 compuestos T11.001 a T11.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es ciclohexilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 12: Esta Tabla describe los 132 compuestos T12.001 a T12.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es 2,2–$(CH_3)_2$–propilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 13: Esta Tabla describe los 132 compuestos T13.001 a T13.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es alilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 14: Esta Tabla describe los 132 compuestos T14.001 a T14.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2–CH=$C(CH_3)_2$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 15: Esta Tabla describe los 132 compuestos T15.001 a T15.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2–CH=$C(Cl)_2$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 16: Esta Tabla describe los 132 compuestos T16.001 a T16.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es propargilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 17: Esta Tabla describe los 132 compuestos T17.001 a T17.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2C{\equiv}CCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 18: Esta Tabla describe los 132 compuestos T18.001 a T18.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2–ciclopropilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 19: Esta Tabla describe los 132 compuestos T19.001 a T19.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2CN, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 20: Esta Tabla describe los 132 compuestos T20.001 a T20.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2OCH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 21: Esta Tabla describe los 132 compuestos T21.001 a T21.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2OCH_2CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 22: Esta Tabla describe los 132 compuestos T22.001 a T22.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 23: Esta Tabla describe los 132 compuestos T23.001 a T23.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2OCH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 24: Esta Tabla describe los 132 compuestos T24.001 a T24.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es oxetan–3–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 25: Esta Tabla describe los 132 compuestos T25.001 a T25.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es tetrahidrofuran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 26: Esta Tabla describe los 132 compuestos T26.001 a T26.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es tetrahidrofuran–3–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 27: Esta Tabla describe los 132 compuestos T27.001 a T27.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es tetrahidropiran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 28: Esta Tabla describe los 132 compuestos T28.001 a T28.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es tetrahidropiran–4–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 29: Esta Tabla describe los 132 compuestos T29.001 a T29.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2CHF_2, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 30: Esta Tabla describe los 132 compuestos T30.001 a T30.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2C(O)–CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 31: Esta Tabla describe los 132 compuestos T31.001 a T31.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2C(O)–CH_2CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 32: Esta Tabla describe los 132 compuestos T32.001 a T32.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH(CH_3)C(O)–CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 33: Esta Tabla describe los 132 compuestos T33.001 a T33.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $C(CH_3)_2C(O)–CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 34: Esta Tabla describe los 132 compuestos T34.001 a T34.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es bencilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 35: Esta Tabla describe los 132 compuestos T35.001 a T35.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $C(O)–CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 36: Esta Tabla describe los 132 compuestos T36.001 a T36.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $C(O)–OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 37: Esta Tabla describe los 132 compuestos T37.001 a T37.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es C(O)–ciclopropilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 38: Esta Tabla describe los 132 compuestos T37.001 a T37.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $C(O)–N(CH_3)_2$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 39: Esta Tabla describe los 132 compuestos T39.001 a T39.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es hidrógeno, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 40: Esta Tabla describe los 132 compuestos T40.001 a T40.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 41: Esta Tabla describe los 132 compuestos T41.001 a T41.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es CH_2OCH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 42: Esta Tabla describe los 132 compuestos T42.001 a T42.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es $CH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 43: Esta Tabla describe los 132 compuestos T43.001 a T43.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es propargilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 44: Esta Tabla describe los 132 compuestos T44.001 a T44.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es hidrógeno, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 45: Esta Tabla describe los 132 compuestos T45.001 a T45.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 46: Esta Tabla describe los 132 compuestos T46.001 a T46.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es CH_2OCH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 47: Esta Tabla describe los 132 compuestos T47.001 a T47.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es $CH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 48: Esta Tabla describe los 132 compuestos T48.001 a T48.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es propargilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 49: Esta Tabla describe los 132 compuestos T49.001 a T49.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es hidrógeno, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 50: Esta Tabla describe los 132 compuestos T50.001 a T50.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 51: Esta Tabla describe los 132 compuestos T51.001 a T51.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es CH_2OCH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 52: Esta Tabla describe los 132 compuestos T52.001 a T52.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es $CH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 53: Esta Tabla describe los 132 compuestos T53.001 a T53.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es propargilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 54: Esta Tabla describe los 132 compuestos T54.001 a T54.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es hidrógeno, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 55: Esta Tabla describe los 132 compuestos T55.001 a T55.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 56: Esta Tabla describe los 132 compuestos T56.001 a T56.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es CH_2OCH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 57: Esta Tabla describe los 132 compuestos T57.001 a T57.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es $CH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 58: Esta Tabla describe los 132 compuestos T58.001 a T58.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es propargilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 59: Esta Tabla describe los 132 compuestos T59.001 a T59.132 de la fórmula Ic, donde R es bencilo, A es hidrógeno, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 60: Esta Tabla describe los 132 compuestos T60.001 a T60.132 de la fórmula Ic, donde R es bencilo, A es CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 61: Esta Tabla describe los 132 compuestos T61.001 a T61.132 de la fórmula Ic, donde R es bencilo, A es CH_2OCH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 62: Esta Tabla describe los 132 compuestos T62.001 a T62.132 de la fórmula Ic, donde R es bencilo, A es $CH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 63: Esta Tabla describe los 132 compuestos T63.001 a T63.132 de la fórmula Ic, donde R es bencilo, A es propargilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 64: Esta Tabla describe los 132 compuestos T64.001 a T64.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es ciclobutilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 65: Esta Tabla describe los 132 compuestos T65.001 a T65.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2CH_2CH_2OCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 66: Esta Tabla describe los 132 compuestos T66.001 a T66.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2CH_2O(tetrahidrofuran–2–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 67: Esta Tabla describe los 132 compuestos T67.001 a T67.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2CH_2O(tetrahidropiran–2–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 68: Esta Tabla describe los 132 compuestos T68.001 a T68.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(oxetan–3–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 69: Esta Tabla describe los 132 compuestos T69.001 a T69.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(3–metil–oxetan–3–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 70: Esta Tabla describe los 132 compuestos T70.001 a T70.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(tetrahidrofuran–2–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 71: Esta Tabla describe los 132 compuestos T71.001 a T71.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(tetrahidrofuran–3–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 72: Esta Tabla describe los 132 compuestos T72.001 a T72.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(tetrahidropiran–2–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 73: Esta Tabla describe los 132 compuestos T73.001 a T73.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(tetrahidropiran–3–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 74: Esta Tabla describe los 132 compuestos T74.001 a T74.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(tetrahidropiran–4–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 75: Esta Tabla describe los 132 compuestos T75.001 a T75.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es CH_2CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 76: Esta Tabla describe los 132 compuestos T76.001 a T76.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es alilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 77: Esta Tabla describe los 132 compuestos T77.001 a T77.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es tetrahidrofuran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 78: Esta Tabla describe los 132 compuestos T78.001 a T78.132 de la fórmula Ic, donde R es hidrógeno, A es tetrahidropiran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 79: Esta Tabla describe los 132 compuestos T79.001 a T79.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es CH_2CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 80: Esta Tabla describe los 132 compuestos T80.001 a T80.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es alilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 81: Esta Tabla describe los 132 compuestos T81.001 a T81.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es tetrahidrofuran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 82: Esta Tabla describe los 132 compuestos T82.001 a T82.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2CH_3, A es tetrahidropiran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 83: Esta Tabla describe los 132 compuestos T83.001 a T83.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es CH_2CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 84: Esta Tabla describe los 132 compuestos T84.001 a T84.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es alilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 85: Esta Tabla describe los 132 compuestos T85.001 a T85.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es tetrahidrofuran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 86: Esta Tabla describe los 132 compuestos T86.001 a T86.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_2OCH_3, A es tetrahidropiran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 87: Esta Tabla describe los 132 compuestos T87.001 a T87.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es CH_2CH_3, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 88: Esta Tabla describe los 132 compuestos T88.001 a T88.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es alilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 89: Esta Tabla describe los 132 compuestos T89.001 a T89.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es tetrahidrofuran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 90: Esta Tabla describe los 132 compuestos T90.001 a T90.132 de la fórmula Ic, donde R es $CH_2CH_2OCH_3$, A es tetrahidropiran–2–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 91: Esta Tabla describe los 132 compuestos T91.001 a T91.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2–ciclobutilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 92: Esta Tabla describe los 132 compuestos T92.001 a T92.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2–ciclopentilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 93: Esta Tabla describe los 132 compuestos T93.001 a T93.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2–ciclohexilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 94: Esta Tabla describe los 132 compuestos T94.001 a T94.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(3–etil–oxetan–3–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 95: Esta Tabla describe los 132 compuestos T95.001 a T95.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(furan–2–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 96: Esta Tabla describe los 132 compuestos T96.001 a T96.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(furan–3–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 97: Esta Tabla describe los 132 compuestos T97.001 a T97.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es CH_2(tetrahidro–tiopiran–4–ilo), G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 98: Esta Tabla describe los 132 compuestos T98.001 a T98.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $C(O)–OCH_2CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 99: Esta Tabla describe los 132 compuestos T99.001 a T99.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2CH_2SCH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 100: Esta Tabla describe los 132 compuestos T100.001 a T100.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2CH_2S(O)CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 101: Esta Tabla describe los 132 compuestos T101.001 a T101.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Tabla 102: Esta Tabla describe los 132 compuestos T102.001 a T102.132 de la fórmula Ic, donde R es CH_3, A es 1–metoxi–piperidin–4–ilo, G es hidrógeno y R_a, R_b, R_c y R_d son según lo definido en la Tabla 1.

Los compuestos de acuerdo con la invención son ingredientes activos preventiva y/o curativamente valiosos en el campo del control de pestes, incluso en bajas proporciones de aplicación, los cuales tienen un espectro biocida muy favorable y son bien tolerados por especies de sangre caliente, peces y plantas. Los ingredientes activos de acuerdo con la invención actúan contra todas las etapas del desarrollo o contra etapas del desarrollo individuales de pestes normalmente sensibles o resistentes, tales como insectos o representantes del orden Acarina. La actividad insecticida o acaricida de los ingredientes activos de acuerdo con la invención puede manifestarse directamente, es decir, en la destrucción de las pestes, lo cual se produce ya sea en forma inmediata o solamente después de haber transcurrido algún tiempo, por ejemplo durante la ecdisis, o indirectamente, por ejemplo en un índice reducido de oviposición y/o emergencia del huevo, una buena actividad correspondiente a un índice de destrucción (mortalidad) de por lo menos 50 a 60%.

Los compuestos de fórmula I pueden utilizarse para combatir y controlar infestaciones de pestes de insectos tales como Lepidópteros, Dípteros, Hemípteros, Tisanópteros, Ortópteros, Dictiópteros, Coleópteros, Sifonápteros, Himenópteros e Isópteros y también otras pestes invertebradas, por ejemplo pestes de ácaros, nematodos y moluscos. Los insectos, ácaros, nematodos y moluscos son denominados a continuación colectivamente pestes. Las pestes las cuales pueden combatirse y controlarse mediante el uso de los compuestos de la invención incluyen aquellas pestes asociadas con la agricultura (dicho término incluye el crecimiento de cultivos para alimento y productos fibrosos), horticultura y ganadería, animales de compañía, silvicultura y el almacenamiento de productos de origen vegetal (tales como frutas, granos y maderaje); dichas pestes asociadas

con el daño de estructuras hechas por el hombre y con la transmisión de enfermedades del hombre y animales; y también pestes molestas (tales como moscas).

Los ejemplos de especies de pestes las cuales pueden ser controladas por los compuestos de fórmula I incluyen: Myzus persicae (áfido), Aphis gossypii (áfido), Aphis fabae (áfido), Lygus spp. (cápsidos), Dysdercus spp. (cápsidos), Nilaparvata lugens (saltamontes), Nephotettixc incticeps (saltamontes), Nezara spp. (chinches), Euschistus spp. (chínches), Leptocorisa spp. (chinches), Frankliniella occidentalis (trip), Thrips spp. (trips), Leptinotarsa decemlineata (gorgojo de la papa del Colorado), Anthonomus grandis (gorgojo del algodón), Aonidiella spp. (cochinilla blanca de los cítricos), Trialeurodes spp. (moscas blancas), Bemisia tabaci (mosca blanca), Ostrinia nubilalis (Taladrador europeo del maíz), Spodoptera littoralis (oruga de la hoja del algodón), Heliothis virescens (gusano de las yemas del tabaco), Helicoverpa armigera (gusano bellotero del algodón), Helicoverpa zea (gusano bellotero del algodón), Sylepta derogata (enrolla–hojas del algodón), Pieris brassicae (mariposa blanca), Plutella xylostella (polilla de las crucíferas), Agrotis spp. (gusanos cortadores), Chilo suppressalis (barrenador del tallo del arroz), Locusta migratoria (langosta), Chortiocetes terminifera (langosta), Diabrotica spp. (gusanos de las raíces), Panonychus ulmi (Araña roja europea), Panonychus citri (araña roja de los cítricos), Tetranychus urticae (araña de dos manchas), Tetranychus cinnabarinus (araña roja), Phyllocoptruta oleivora (ácaro de la roya de los cítricos), Polyphagotarsonemus latus (ácaro blanco), Brevipalpus spp. (ácaros planos), Boophilus microplus (garrapata del ganado), Dermacentor variabilis (garrapata del perro americano), Ctenocephalides felis (pulga de los gatos), Liriomyza spp. (gusano minador), Musca domestica (mosca hogareña), Aedes aegypti (mosquito), Anopheles spp. (mosquitos), Culex spp. (mosquitos), Lucillia spp. (moscardones), Blattella germanica (cucaracha), Periplaneta americana (cucaracha), Blatta orientalis (cucaracha), termitas de los Mastotermitidae (por ejemplo Mastotermes spp.), los Kalotermitidae (por ejemplo Neotermes spp.), los Rhinotermitidae (por ejemplo Coptotermes formosanus, Reticulitermes flavipes, R. speratu, R. virginicus, R. hesperus, y R. santonensis) y los Termitidae (por ejemplo Globitermes sulphureus), Solenopsis geminata (hormiga de fuego), Monomorium pharaonis

(hormiga faraona), Damalinia spp. y Linognathus spp. (piojos mordedores y chupadores), *Meloidogyne* spp. (nematodos del nudo de la raíz), *Globodera* spp. y *Heterodera* spp. (nematodos del quiste), *Pratylenchus* spp. (nematodos de lesión), *Rhodopholus* spp. (nematodos barrenadores del banano), *Tylenchulus* spp.(nematodos de cítricos), *Haemonchus contortus* (lombriz "barber pole worm"), *Caenorhabditis elegans*_(nemátodo rabdítido), *Trichostrongylus* spp. (nematodos gastrointestinales) y *Deroceras reticulatum* (babosa).

Otros ejemplos de las pestes antes mencionadas son:

del orden *Acarina*, por ejemplo,

Acarus siro, Aceria sheldoni, Aculus schlechtendali, Amblyomma spp., Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., Bryobia praetiosa, Calipitrimerus spp., Chorioptes spp., Dermanyssus gallinae, Eotetranychus carpini, Eriophyes spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Olygonychus pratensis, Ornithodoros spp., Panonychus spp., Phyllocoptruta oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp. y Tetranychus spp.;

del orden de los *Anópluros*, por ejemplo,

Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Pemphigus spp. y Phylloxera spp.;

del orden de los *Coleópteros*, por ejemplo,

Agriotes spp., Anthonomus spp., Atomaria linearis, Chaetocnema tibialis, Cosmopolites spp., Curculio spp., Dermestes spp., Diabrotica spp., Epilachna spp., Eremnus spp., Leptinotarsa decemLineata, Lissorhoptrus spp., Melolontha spp., Orycaephilus spp., Otiorhynchus spp., Phlyctinus spp., Popillia spp., Psylliodes spp., Rhizopertha spp., Scarabeidae, Sitophilus spp., Sitotroga spp., Tenebrio spp., Tribolium spp. y Trogoderma spp.;

del orden de los *Dípteros*, por ejemplo,

Aedes spp., Antherigona soccata, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomyia spp., Culex spp., Cuterebra spp., Dacus spp., Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastrophilus spp., Glossina spp., Hypoderma spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit,

000280

Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis pomonella, Sciara spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp. y Tipula spp.;

del orden de los *Heterópteros,* por ejemplo,

Cimex spp., Distantiella theobroma, Dysdercus spp., Euchistus spp., Eurygaster spp., Leptocorisa spp., Nezara spp., Piesma spp., Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophara spp. y Triatoma spp.;

del orden de los *Homópteros*, por ejemplo,

Aleurothrixus floccosus, Aleyrodes brassicae, Aonidiella spp., Aphididae, Aphis spp., Aspidiotus spp., Bemisia tabaci, Ceroplaster spp., Chrysomphalus aonidium, Chrysomphalus dictyospermi, Coccus hesperidum, Empoasca spp., Eriosoma larigerum, Erythroneura spp., Gascardia spp., Laodelphax spp., Lecanium corni, Lepidosaphes spp., Macrosiphus spp., Myzus spp., Nephotettix spp., Nilaparvata spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Planococcus spp., Pseudaulacaspis spp., Pseudococcus spp., Psylla spp., Pulvinaria aethiopica, Quadraspidiotus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza erytreae y Unaspis citri;

del orden de los *Himenópteros*, por ejemplo,

Acromyrmex, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Solenopsis spp. y Vespa spp.;

del orden de los *Isópteros*, por ejemplo,

Reticulitermes spp.;

del orden de los *Lepidópteros*, por ejemplo,

Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amilois spp., Anticarsia gemmatalis, Archips spp., Argyrotaenia spp., Autographa spp., Busseola fusca, Cadra cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp., Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydia spp., Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Ephestia spp., Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Grapholita spp., Hedya nubiferana, Heliothis spp., Hellula undalis, Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Leucoptera scitella, Lithocollethis spp., Lobesia botrana, Lymantria

spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Operophtera spp., Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Pectinophora gossypiela, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni y Yponomeuta spp.;

del orden de los *Mallophaga*, por ejemplo,

Damalinea spp. y Trichodectes spp.;

del orden de los *Ortópteros*, por ejemplo,

Blatta spp., Blattella spp., Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Periplaneta spp. y Schistocerca spp.;

del orden de los *Psocópteros*, por ejemplo,

Liposcelis spp.;

del orden de los *Sifonápteros*, por ejemplo,

Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp. y Xenopsylla cheopis;

del orden de los *Tisanópteros*, por ejemplo,

Frankliniella spp., Hercinothrips spp., Scirtothrips aurantii, Taeniothrips spp., Thrips palmi y Thrips tabaci; y

del orden de los *Tisánuros*, por ejemplo,

Lepisma saccharina.

Los ingredientes activos de acuerdo con la invención pueden utilizarse para controlar, es decir, contener o destruir, pestes del tipo antes mencionado que se producen en particular en plantas, especialmente en plantas útiles y plantas decorativas en agricultura, en horticultura y en bosques, o en órganos, tales como frutos, flores, follaje, tallos, tubérculos o raíces, de dichas plantas, y en algunos casos incluso órganos de plantas los cuales son formados en un punto posterior en el tiempo permanecen protegidas contra estas pestes.

Los cultivos objetivo adecuados son, en particular, cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz o sorgo; remolacha, tal como remolacha forrajera o azucarera; fruto, por ejemplo frutas pomáceas, fruta de carozo o fruta blanda, tales como manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas o bayas por ejemplo frutillas, moras o frambuesas; plantas leguminosas, tales como habas, lentejas, arvejas o soja; cultivos oleaginosos,

tales como colza, mostaza, amapola, olivos, girasoles, coco, ricino, semillas de cacao, maní; cucurbitáceas tales como zapallos, pepinos o melones; plantas fibrosas tales como algodón, lino, cáñamo o yute; frutas cítricas tales como naranjas, limones, pomelo o mandarinas; verduras tales como espinaca, lechuga, espárrago, repollos, zanahorias, cebollas, tomates, papas o pimiento picante; lauráceas tales como palta, Canelo o alcanfor; y también tabaco, nueces, café, berenjena, caña de azúcar, té, pimiento, vides, lúpulos, la familia de los plátanos y plantas de cauchos naturales, así como también plantas decorativas.

El término "cultivos" debe entenderse como incluyendo también cultivos que se han tornado tolerantes a herbicidas tales como bromoxinil o clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo primisulfuron, prosulfuron y trifloxisulfuron, inhibidores de EPSPS (5–enol–pirovil–shikimato–3–fosfato–sintasa), inhibidores de GS (glutamina sintetasa)) como resultado de métodos convencionales de mejora genética o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha tornado tolerante a imidazolinonas, por ej. imazamox, mediante métodos convencionales de mejora genética (mutagénesis) es la colza estival Clearfield® (Canola). Ejemplos de cultivos que se han tornado tolerantes a los herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen las variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato disponibles en el comercio bajo las denominaciones comerciales RoundupReady® y LibertyLink®.

El término "cultivos" debe entenderse como incluyendo también plantas de cultivo las cuales se han transformado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sinterizar una o más toxinas de acción selectiva, tales como las conocidas, por ejemplo, de bacterias productoras de toxinas, especialmente aquellas del género Bacillus.

Las toxinas que pueden ser expresadas mediante tales plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas, por ejemplo proteínas insecticidas de Bacillus cereus o Bacillus popliae; o proteínas insecticidas de Bacillus thuringiensis, tales como δ–endotoxinas, por ej. CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c, o proteínas insecticidas vegetativas (VIP, siglas correspondientes a "vegetative insecticidal proteins"), por ej. VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; o proteínas insecticidas de nematodos

colonizadores de bacterias, por ejemplo Photorhabdus spp. o Xenorhabdus spp., tales como Photorhabdus luminescens, Xenorhabdus nematophilus; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnidos, toxinas de avispa y otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de Streptomycetes, lectinas vegetales, tales como lectinas de habas, lectinas de cebada o lectinas de campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, patatina, cistatina, inhibidores de papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP, siglas correspondientes a "ribosome–inactivating proteins"), tales como ricina, RIP del maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de esteroides tales como inhibidores de 3–hidroxisteroidoxidasa, ecdisteroid–UDP–glicosil–transferasa, colesterol oxidasas, ecdisona, HMG–COA–reductasa, bloqueadores de los canales de iones, tales como bloqueadores de los canales de sodio o calcio, esterasa de la hormona juvenil, receptores de la hormona diurética, estilbeno sintasa, bibencil sintasa, quitinasas y glucanasas.

En el contexto de la presente invención se debe entender por δ–endotoxinas, por ejemplo CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c, o proteínas insecticidas vegetativas (VIP, siglas correspondientes a "vegetative insecticidal proteins"), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A, expresamente también toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas son producidas recombinantemente mediante una nueva combinación de dominios diferentes de aquellas proteínas (véase, por ejemplo, el documento WO 02/15701). Las toxinas truncadas, por ejemplo CryIA(b) truncada, son conocidas. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplazan uno o más aminoácidos de la toxina de presentación natural. En tales reemplazos de aminoácidos, preferentemente se insertan en la toxina secuencias de reconocimiento de proteasas no naturalmente presentes, tales como, por ejemplo, en el caso de CryIIIA055, una secuencia de reconocimiento de catepsina–D se inserta en una toxina CryIIIA (véase el documento WO 03/018810).

Ejemplos de ese tipo de toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas se describen, por ejemplo, en EP–A–0 374 753,

WO 93/07278, WO 95/34656, EP–A–0 427 529, EP–A–451 878 y WO 03/052073.

Los procesos para la preparación de ese tipo de plantas transgénicas son en general conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones antes mencionadas. Los ácidos desoxirribonucleicos tipo CryI y su preparación son conocidos, por ejemplo, del documento WO 95/34656, EP–A–0 367 474, EP–A–0 401 979 y WO 90/13651.

La toxina contenida en las plantas transgénicas imparte a las plantas tolerancia frente a insectos dañinos. Ese tipo de insectos pueden presentarse en cualquier grupo taxonómico de insectos, aunque son especialmente encontrados comúnmente en los escarabajos (Coleópteros), insectos de dos alas (Dípteros) y mariposas (Lepidópteros).

Las plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son conocidas y algunas de ellas están disponibles en el comercio. Ejemplos de ese tipo de plantas son: YieldGard® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIA(b) y una toxina CryIIIB(b1)); Starlink® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry9(c)); Herculex I® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIF(a2) y la enzima fosfinotricina N–acetiltransferasa (PAT) para lograr tolerancia al herbicida glufosinato amónico); NuCOTN 33B® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard I® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard II® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c) y CryIIA(b)); VIPCOT® (variedad del algodón que expresa una toxina VIP); NewLeaf® (variedad de la papa que expresa una toxina CryIIIA); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (característica tolerante al glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (característica del gusano del maíz Bt11 (CB)) y Protecta®.

Otros ejemplos de ese tipo de cultivos transgénicos son:

1. Maíz Bt11 de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F–31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Zea mays genéticamente modificada la cual se ha tornado resistente al ataque por el gorgojo del maíz europeo (Ostrinia nubilalis y Sesamia nonagrioides) mediante expresión

transgénica de una toxina CrylA(b) truncada. El maíz Bt11 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr tolerancia frente al herbicida glufosinato amónico.

2. Maíz Bt176 de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F–31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Zea mays genéticamente modificada la cual se ha tornado resistente al ataque por el gorgojo del maíz europeo (Ostrinia nubilalis y Sesamia nonagrioides) mediante expresión transgénica de una toxina CrylA(b). El maíz Bt176 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr tolerancia frente al herbicida glufosinato amónico.

3. Maíz MIR604 de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F–31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Maíz el cual se ha vuelto resistente a insectos mediante expresión transgénica de una toxina CryIIIA modificada. Esta toxina es Cry3A055 modificada por inserción de una secuencia de reconocimiento de catepsina–D–proteasa. La preparación de este tipo de plantas de maíz transgénicas se describe en el documento WO 03/018810.

4. Maíz MON 863 de Monsanto Europe S.A. 270–272 Avenue de Tervuren, B–1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expresa una toxina CryIIIB(b1) y tiene resistencia a ciertos insectos Coleópteros.

5. Algodón IPC 531 de Monsanto Europe S.A. 270–272 Avenue de Tervuren, B–1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/ES/96/02.

6. Maíz 1507 de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B–1160 Bruselas, Bélgica, número de registro C/NL/00/10. Maíz genéticamente modificado para la expresión de la proteína Cry1F para lograr resistencia frente a ciertos insectos Lepidópteros y de la proteína PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato amónico.

7. Maíz NK603 × MON 810 de Monsanto Europe S.A. 270–272 Avenue de Tervuren, B–1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/GB/02/M3/03. Consiste en las variedades de maíz híbridas reproducidas convencionalmente cruzando las variedades genéticamente modificadas NK603 y MON 810. El maíz NK603 × MON 810 expresa transgénicamente la proteína CP4 EPSPS, obtenida de la cepa de Agrobacterium sp. CP4, la cual imparte tolerancia al herbicida Roundup® (contiene glifosato), y también una toxina CrylA(b) obtenida de Bacillus

thuringiensis subesp. kurstaki la cual logra tolerancia a ciertos Lepidópteros, incluyen el gorgojo del maíz europeo.

Los cultivos transgénicos de plantas resistentes a insectos son también descritos en BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Suiza) Informe 2003.

El término "cultivos" debe entenderse como incluyendo también plantas de cultivo las cuales se han transformado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar sustancias antipatógenas que tienen una acción selectiva, tal como, por ejemplo, las llamadas "proteínas relacionadas con patogénesis" ("pathogenesis–related proteins" (PRPs, ver por ej. EP–A–0 392 225). Ejemplos de ese tipo de sustancias antipatógenas y plantas transgénicas capaces de sintetizar ese tipo de sustancias antipatógenas son conocidas, por ejemplo, de EP–A–0 392 225, WO 95/33818, y EP–A–0 353 191. Los métodos para producir ese tipo de plantas transgénicas son generalmente conocidos para el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones antes mencionadas.

Las sustancias antipatógenas las cuales pueden ser expresadas por tales plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, bloqueadores de los canales de iones, tales como bloqueadores de los canales de sodio y calcio, por ejemplo las toxinas KP1, KP4 o KP6 virales; estilben–sintasas; bibencil–sintasas; quitinasas; glucanasas; las llamadas "proteínas relacionadas con patogénesis" (pathogenesis–related proteins") (PRPs; ver por ej. EP–A–0 392 225); sustancias antipatógenas producidas mediante microorganismos, por ejemplo antibióticos péptidos o antibióticos heterocíclicos (ver por ej. WO 95/33818) o factores proteicos o polipéptidos involucrados en la defensa de los patógenos de las plantas (llamados "genes de resistencia a enfermedades de las plantas", según lo descrito en el documento WO 03/000906).

Otras áreas de uso de los compuestos y composiciones de acuerdo con la invención son la protección de mercadería almacenada y de depósitos y la protección de materia prima, tales como madera, textiles, recubrimientos de pisos o construcciones, y también en el sector de la higiene, especialmente la protección de seres humanos, animales domésticos y ganado vacuno productivo contra pestes del tipo mencionado.

En el sector de la higiene, las composiciones de acuerdo con la invención son activas contra ectoparásitos tales como las garrapatas del ganado duras, las garrapatas del ganado blandas, ácaros de sarna, ácaros de la cosecha, moscas (mordedoras y chupadoras), larvas de moscas parasitarias, liendres, liendres del cabello, liendres de aves y piojos.

Ejemplos de tales parásitos son:

Del orden de los Anoplurida: Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp. y Phtirus spp., Solenopotes spp..

Del orden de los Mallophagida: Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp. y Felicola spp..

Del orden de los Dípteros y las subórdenes Nematocerina y Brachycerina, 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., 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. y Melophagus spp..

Del orden de los Sifonaptéridos, por ejemplo Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Del orden de los Heteroptéridos, por ejemplo Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Del orden de los Blatáridos, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattelagermanica y Supella spp..

De la subclase Acaria (Acáridos) y las órdenes Meta– y Meso–stigmata, por ejemplo 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. y Varroa spp..

De los órdenes Actinédidos (Prostigmata) y Acarídidos (Astigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergatesspp., 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. y Laminosioptes spp..

Los compuestos y composiciones de acuerdo con la invención son también adecuados para proteger contra la infestación de insectos en el caso de materiales tales como madera, textiles, plásticos, adhesivos, pegamentos, pinturas, papel y cartón, cuero, recubrimientos de pisos y construcciones.

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden utilizarse, por ejemplo, contra las siguientes pestes: escarabajos tales como Hylotrupes bajulus, Clorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinuspecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthesrugicollis, Xyleborus spec.,Tryptodendron spec., Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. y Dinoderus minutus, y también himenópteros tales como Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus y Urocerus augur, y termitas tales como Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis y Coptotermes formosanus, y lepisma tal como Lepisma saccharina.

Por lo tanto, la invención proporciona un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos el cual comprende aplicar una cantidad eficaz insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de fórmula I, o una composición que contiene un compuesto de fórmula I, a una peste, un locus de peste, o a una planta susceptible al ataque por una peste. Los compuestos de fórmula I son preferentemente utilizados contra insectos o ácaros.

El término "planta" como se utiliza en esta invención incluye plántulas, arbustos y árboles.

Además de exhibir una buen acción y propiedades insecticidas y acaricidas, el ingrediente activo de acuerdo con la invención se caracteriza por una buena compatibilidad por parte de la planta/ cultivo. Bajo diferentes métodos de aplicación, los compuestos de la fórmula I, o sus composiciones de acuerdo con la invención, demuestran buena tolerancia por plantas/ cultivos por lo cual el daño de

las plantas/ cultivos (fitotoxicidad) es significativamente reducido. Los términos "cultivo" y "planta" deben entenderse según lo definido anteriormente, mientras que el término "métodos de aplicación" se explica más adelante.

Por consiguiente, la invención también se refiere a composiciones pesticidas tales como concentrados emulsionables, concentrados en suspensión, soluciones directamente pulverizables o diluibles, pastas esparcibles, emulsiones diluidas, polvos solubles, polvos dispersables, polvos humectables, polvillos, gránulos o encapsulaciones en sustancias poliméricas, los cuales comprenden, por lo menos, uno de los ingredientes activos de acuerdo con la invención y los cuales deben ser seleccionados para adecuarse a los objetivos pretendidos y a las circunstancias prevalecientes.

En estas composiciones, el ingrediente activo es empleado en forma pura, un ingrediente activo sólido por ejemplo en un tamaño de partícula específico, o, preferentemente, junto con – por lo menos – uno de los auxiliares utilizados convencionalmente en la técnica de la formulación, tal como, cargas, por ejemplo solventes o portadores sólidos, o tales como compuestos tensioactivos (surfactantes).

Los ejemplos de solventes adecuados son: hidrocarburos aromáticos no hidrogenados o parcialmente hidrogenados, preferentemente las fracciones C8 a C12 de alquilbencenos, tales como mezclas de xileno, naftalenos alquilados o tetrahidronaftaleno, hidrocarburos alifáticos o cicloalifáticos, tales como parafinas o ciclohexao, alcoholes tales como etanol, propanol o butanol, glicoles y sus éteres y ésteres tales como propilenglicol, éter de dipropilenglicol, etilenglicol o etilenglicol monometil éter o éter monoetílico de etilenglicol, cetonas, tales como ciclohexanona, isoforona o alcohol de diacetona, solventes fuertemente polares, tales como N–metilpirrolid–2–ona, sulfóxido de dimetilo o N,N–dimetilformamida, agua, aceites vegetales no epoxidados o epoxidados, tales como aceite de colza, ricino, coco o soja no epoxidado o epoxidado y aceites de silicona.

Los portadores sólidos los cuales son utilizados, por ejemplo, para polvillos y polvos dispersables son, como una regla general, minerales naturales molidos tales como calcita, talco, caolín, montmorillonita o attapulgita. Para mejorar las propiedades físicas, es también posible agregar sílices altamente dispersados o polímeros absorbentes altamente dispersados. Los portadores adsorbentes en

partículas adecuados para gránulos son tipos porosos, tales como piedra pómez, arenisca de ladrillo, sepiolita o bentonita, y los materiales portadores no absorbentes adecuados son calcita o arena. Por añadidura, puede utilizarse una gran cantidad de materiales granulados de naturaleza inorgánica u orgánica, en particular dolomita o residuos vegetales triturados.

Los compuestos tensioactivos adecuados son, dependiendo del tipo del ingrediente activo a ser formulado, surfactantes o mezclas de surfactantes formulados, no iónicos, catiónicos y/o aniónicos que tienen buenas propiedades emulsionantes, dispersantes y humectantes. Los surfactantes mencionados a continuación solo deben ser considerados como ejemplos; una gran cantidad de otros surfactantes los cuales son utilizados convencionalmente en la técnica de la formulación y son adecuados de acuerdo con la invención son descritos en la bibliografía relevante.

Los surfactantes no iónicos adecuados son, especialmente, derivados de poliglicol éter de alcoholes alifáticos o cicloalifáticos, de ácidos grasos saturados o insaturados o de alquilfenoles los cuales pueden contener aproximadamente 3 a aproximadamente 30 grupos glicol éter y aproximadamente 8 a aproximadamente 20 átomos de carbono en el radical de hidrocarburo (ciclo)alifático o aproximadamente 6 hasta aproximadamente 18 átomos de carbono en la porción alquilo de los alquilfenoles. También son adecuados los aductos de óxido de polietileno hidrosolubles con polipropilenglicol, etilendiaminopolipropilenglicol o alquilpolipropilenglicol con 1 a aproximadamente 10 átomos de carbono en la cadena alquílica y aproximadamente 20 hasta aproximadamente 250 grupos etilenglicol éter y aproximadamente 10 hasta aproximadamente 100 grupos propilenglicol éter. Normalmente, los compuestos antes mencionados contienen de 1 a aproximadamente 5 unidades etilenglicol por cada unidad propilenglicol. Los ejemplos que pueden mencionarse son nonilfenoxipolietoxietanol, éter poliglicólico de aceite de ricino, aductos de polipropilenglicol/óxido de polietileno, tributilfenoxipolietoxietanol, polietilenglicol u octilfenoxipolietoxietanol. Son también adecuados los ésteres de ácido graso de polioxietilen–sorbitán, tales como trioleato de polioxietilen–sorbitán.

Los surfactantes catiónicos son, especialmente, sales de amonio cuaternario las cuales tienen en general por lo menos un radical alquilo de

aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C como sustituyentes y como sustituyentes adicionales, radicales alquilo inferior o hidroxialquilo o bencilo (no halogenados o halogenados). Las sales están preferentemente en la forma de haluros, metilsulfatos o etilsulfatos. Los ejemplos son cloruro de estearoltrimetilamonio y bromuro de bencilbis(2–cloroetil)etilamonio.

Los ejemplos de surfactantes aniónicos adecuados son jabones solubles en agua o compuestos tensioactivos sintéticos solubles en agua. Los ejemplos de jabones adecuados son sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio (no sustituido o sustituido) de ácidos grasos que tienen aproximadamente 10 a aproximadamente 22 átomos de C, tales como las sales de sodio o potasio de ácido oleico o esteárico, o de mezclas naturales de ácido graso las cuales son obtenibles por ejemplo de aceite de coco o sebo; deben mencionarse a los tauratos de metilo de ácido graso. Sin embargo, se utiliza más frecuentemente los surfactantes sintéticos, en particular los solufonatos grasos, sulfatos grasos, derivados de bencimidazol sulfonados o alquilaril sulfonatos. Como regla general, los sulfonatos grasos y sulfatos grasos están presentes como sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio (sustituido o no sustituido) y en general tienen un radical alquilo de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C, alquilo debe entenderse que también incluye la porción alquilo de radicales acilo; los ejemplos que pueden mencionarse son las sales de sodio o calcio de ácido lignosulfónico, del éster dodecilsulfúrico o de una mezcla de sulfatos de alcoholes grasos preparada a partir de ácidos grasos naturales. Este grupo también incluye a las sales de los ésteres sulfúricos y ácidos sulfónicos de aductos de alcohol graso/ óxido de etileno. Los derivados de bencimidazol sulfonados preferentemente contienen 2 grupos sulfonilo y un radical ácido graso de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C. Los ejemplos de alquilarilsulfonatos son las sales de sodio, calcio o trietanolamonio de ácido decilbencensulfónico, de ácido dibutilnaftalensulfónico o de un condensado de ácido naftalensulfónico/ formaldehído. También son posibles, adicionalmente, los fosfatos adecuados, tales como sales del éster fosfórico de un aducto de óxido de p–nonilfenol/(4–14)etileno, o fosfolípidos. Fosfatos adecuados adicionales son los tris–ésteres de ácido fosfórico con alcoholes alifáticos o aromáticos y/o bis–ésteres de ácidos alquilfosfónicos con alcoholes alifáticos o aromáticos, los cuales

son un adyuvante del tipo aceite de alto rendimiento. Estos tris–ésteres han sido descritos, por ejemplo, en WO0147356, WO0056146, EP–A–0579052 o EP–A–1018299 o están disponibles en el mercado bajo su denominación química. Los tris–ésteres preferidos de ácido fosfórico para utilizar en las nuevas composiciones son tris–(2–etilhexil) fosfato, tris–n–octil fosfato y tris–butoxietil fosfato, donde tris–(2–etilhexil) fosfato es el más preferido. El bis–éster adecuado de ácidos alquilfosfónicos son bis–(2–etilhexil)–(2–etilhexil)–fosfonato, bis–(2–etilhexil)–(n–octil)–fosfonato, dibutil–butil fosfonato y bis(2–etilhexil)–tripropilen–fosfonato, donde bis–(2–etilhexil)–(n–octil)–fosfonato es particularmente preferido.

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden incluir preferentemente adicionalmente un aditivo que comprende un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, alquilésteres de dichos aceites o mezclas de dichos aceites y derivados de aceite. La cantidad de aditivo de aceite utilizada en la composición de acuerdo con la invención es generalmente de 0,01 a 10%, en base a la mezcla de fumigación. Por ejemplo, puede agregarse el aditivo oleoso al tanque de fumigación en la concentración deseada después de que la mezcla de fumigación ha sido preparada. Los aditivos oleosos preferidos comprenden aceites minerales o un aceite de origen vegetal, por ejemplo aceite de semilla de colza tal como ADIGOR® y MERO®, aceite de oliva o aceite de girasol, aceite vegetal emulsionado, tal como AMIGO® (Rhône–Poulenc Canada Inc.), alquil ésteres de aceites de origen vegetal, por ejemplo los derivados de metilo, o un aceite de origen animal, tal como aceite de pescado o sebo de carne vacuna. Un aditivo preferido contiene, por ejemplo, como componentes activos esencialmente 80% en peso de ésteres de alquilo de aceites de pescado y 15% en peso de aceite de semilla de colza metilado y además 5% en peso de emulsionantes habituales y modificadores del pH. Los aditivos de aceite especialmente preferidos comprenden ésteres de alquilo de ácidos grasos C_8–C_{22}, especialmente los derivados de metilo de ácidos grasos C_{12}–C_{18}, por ejemplo los ésteres de metilo de ácido láurico, ácido palmítico y ácido oleico, son importantes. Dichos ésteres son conocidos como laurato de metilo (CAS–111–82–0), palmitato de metilo (CAS–112–39–0) y oleato de metilo (CAS–112–62–9). Un derivado de éster de metilo de ácido graso preferido es Emery® 2230 y 2231 (Cognis GmbH). Esos y otros derivados de aceites son también conocidos del Compendio de Adyuvantes

Herbicidas (Compendium of Herbicide Adjuvants), 5ta Edición, Southern Illinois University, 2000. Asimismo, pueden utilizarse ácidos grasos alcoxilados como aditivos en las composiciones de la invención así como también aditivos a base de polimetilsiloxano, los cuales han sido descritos en WO08/037373.

La aplicación y la acción de los aditivos de aceite pueden mejorarse adicionalmente combinándolos con sustancias tensioactivas, tales como surfactantes no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los ejemplos de surfactantes aniónicos, no iónicos y catiónicos adecuados son enlistados en las páginas 7 y 8 de WO 97/34485. Las sustancias tensioactivas preferidas son surfactantes aniónicos del tipo dodecilbencilsulfonato, especialmente sus sales de calcio, y también surfactantes no iónicos del tipo etoxilato de alcohol graso. Se prefieren especialmente a los alcoholes grasos C_{12}–C_{22} etoxilados que tienen un grado de etoxilación de entre 5 y 40. Los ejemplos de surfactantes disponibles en el mercado son los tipos Genapol (Clariant AG). También se prefieren los surfactantes de silicona, especialmente los heptametiltrisiloxanos modificados con óxido de polialquilo, los cuales están disponibles en el mercado, por ej. como Silwet L–77®, y también los surfactantes perfluorados. La concentración de sustancias tensioactivas con relación al aditivo total es generalmente de 1 a 30% en peso. Los ejemplos de aditivos de aceite que consisten en mezclas de aceites o aceites minerales o sus derivados con surfactantes son Edenor ME SU®, Turbocharge® (Syngenta AG, CH) y Actipron® (BP Oil UK Limited, GB).

Dichas sustancias tensioactivas también pueden utilizarse en las formulaciones solas, es decir, sin aditivos de aceite.

Adicionalmente, la adición de un solvente orgánico a la mezcla de aditivo oleoso/ surfactante puede contribuir con una mejora adicional de la acción. Los solventes adecuados son, por ejemplo, Solvesso® (ESSO) y Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). La concentración de ese tipo de solventes puede ser entre 10 y 80% en peso del peso total. Ese tipo de aditivos oleosos, los cuales pueden estar en mezcla con los solventes, son descritos, por ejemplo, en US–A–4 834 908. Un aditivo de aceite disponible en el mercado descrito en dicho documento es conocido por la denominación MERGE® (BASF Corporation). Un

aditivo de aceite adicional que es preferido de acuerdo con la invención es SCORE® (Syngenta Crop Protection Canadá.)

Además de los aditivos oleosos mencionados anteriormente, a fin de aumentar la actividad de las composiciones de acuerdo con la invención es también posible que las formulaciones de alquilpirrolidonas, (por ej. Agrimax®) sean agregadas a la mezcla de fumigación. También pueden utilizarse formulaciones de látex sintéticos, tales como, por ejemplo, poliacrilamida, compuestos de polivinilo o poli–1–p–menteno (por ej. Bond®, Courier® o Emerald®). Las soluciones que contienen ácido propiónico, por ejemplo Eurogkem Pen–e–trate®, también pueden mezclarse en la mezcla de fumigación como agentes potenciadores de la actividad.

Como regla general, las composiciones comprenden de 0,1 a 99%, especialmente de 0,1 a 95%, de ingrediente activo de la fórmula I y de 1 a 99,9%, especialmente de 5 a 99,9%, de por lo menos un adyuvante sólido o líquido, siendo posible como regla general que un 0 a 25%, especialmente de 0,1 a 20%, de la composición sean surfactantes (% en cada caso significa por ciento en peso). Si bien las composiciones concentradas tienden a ser preferidas para los productos comerciales, el consumidor final, como regla general, utiliza composiciones diluidas las cuales tienen concentraciones sustancialmente inferiores de ingrediente activo. Las composiciones preferidas están compuestas en particular de la siguiente manera (% = por ciento en peso):

Concentrados emulsionables:

ingrediente activo:	1 a 95%, preferentemente 5 a 50%, más preferentemente 5 a 20%
surfactante:	1 a 30%, preferentemente 10 a 20%
solvente:	5 a 98%, preferentemente 70 a 85%

Polvillos:

ingrediente activo:	0,1 a 10%, preferentemente 0,1 a 1%
portador sólido:	99,9 a 90%, preferentemente 99,9 a 99%

Concentrados en suspensión:

ingrediente activo:	5 a 75%, preferentemente 10 a 50%, más preferentemente 10 a 40%
agua:	94 a 24%, preferentemente 88 a 30%
surfactante:	1 a 40%, preferentemente 2 a 30%

Concentrados en suspensión con base oleosa:

ingrediente activo:	2 a 75%, preferentemente 5 a 50%
aceite:	94 a 24%, preferentemente 88 a 30%
surfactante:	1 a 40%, preferentemente 2 a 30%

Polvos humectables:

ingrediente activo:	0,5 a 90%, preferentemente 1 a 80%, más preferentemente 25 a 75%
surfactante:	0,5 a 20%, preferentemente 1 a 15%
portador sólido:	5 a 99%, preferentemente 15 a 98%

Granulados:

ingrediente activo:	0,5 a 30%, preferentemente 3 a 25%, más preferentemente 3 a 15%
portador sólido:	99,5 a 70%, preferentemente 97 a 85%

Preferentemente, el término "ingrediente activo" se refiere a uno de los compuestos seleccionados de las Tablas 1 a 102 mostradas en lo que antecede. También se refiere a mezclas del compuesto de fórmula I, en particular un compuesto seleccionado de dichas Tablas 1 a 102, con otros insecticidas, fungicidas, herbicidas, antídotos, adyuvantes y similares, mezclas que están específicamente descritas más adelante.

Las composiciones también pueden comprender auxiliares sólidos o líquidos adicionales, tales como estabilizantes, por ejemplo aceites vegetales no epoxidados o epoxidados (por ejemplo aceite de coco epoxidado, aceite de semilla de colza o aceite de soja), antiespumantes, por ejemplo aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o agentes de la

pegajosidad; fertilizantes, en particular fertilizantes que contienen nitrógeno tales como nitratos de amonio y urea según lo descrito en WO08/017388, los cuales pueden aumentar la eficacia de los compuestos de la invención; u otros ingredientes activos para lograr efectos específicos, por ejemplo sales de amonio o fosfonio, en particular haluros, (hidrógeno)sulfatos, nitratos, (hidrógeno)carbonatos, citratos, tartratos, formiatos y acetatos, según lo descrito en WO07/068427 y WO07/068428, los cuales también pueden aumentar la eficacia de los compuestos inventivos y los cuales pueden utilizarse en combinación con potenciadores de la penetración tales como ácidos grasos alcoxilados; bactericidas, fungicidas, nematicidas, activadores vegetales, molusquicidas o herbicidas.

Las composiciones de acuerdo con la invención se preparan de una manera conocida per se, en ausencia de auxiliares por ejemplo mediante trituración, tamizado y/o compresión de un ingrediente activo sólido y en presencia de por lo menos un auxiliar por ejemplo mezclando íntimamente y/o triturando el ingrediente activo con el auxiliar (auxiliares). Estos procesos para la preparación de las composiciones y el uso de los compuestos I para la preparación de estas composiciones son también un objeto de la invención.

Los métodos de aplicación para las composiciones, es decir, los métodos para controlar pestes del tipo antes mencionadas, tales como fumigación, atomización, espolvoreo, cepillado, recubrimiento, esparcido o vertido, los cuales deben ser seleccionados para adecuarse a los objetivos pretendidos de las circunstancias prevalecientes, y el uso de las composiciones para controlar pestes del tipo antes mencionado son otros objetos de la invención. Las proporciones típicas de concentración son entre 0,1 y 1000 ppm, preferentemente entre 0,1 y 500 ppm, de ingrediente activo. La proporción de aplicación por hectárea es generalmente de 1 a 2000 g de ingrediente activo por hectárea, en particular de 10 a 1000 g/ha, preferentemente de 10 a 600 g/ha.

Un método preferido de aplicación en el campo de la protección de cultivos es la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), siendo posible seleccionar la frecuencia y proporción de aplicación para que coincida con el peligro de infestación con la peste en cuestión. Alternativamente, el ingrediente activo puede alcanzar las plantas por medio del sistema de raíces (acción

000297

sistémica), por empapado del locus de las plantas con una composición líquida o incorporando el ingrediente activo en forma sólida en el locus de las plantas, por ejemplo en el suelo, por ejemplo en la forma de gránulos (aplicación en suelo). En el caso de los cultivos de arrozales, dichos gránulos pueden medirse en los arrozales inundados.

Las composiciones de acuerdo con la invención son también adecuadas para la protección de material de propagación de plantas, por ejemplo semillas, tales como el fruto, tubérculos o granos, o plantas de invernadero, contra pestes del tipo antes mencionado. El material de propagación puede ser tratado con las composiciones con anterioridad al plantado, por ejemplo la semilla puede ser tratada con anterioridad a la siembra. Alternativamente, las composiciones pueden ser aplicadas a los núcleos de la semilla (recubrimiento), ya se empapando los núcleos en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. También es posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación es plantado al sitio de aplicación, por ejemplo en el surco de la semilla durante el plantado. Estos métodos de tratamiento para el material vegetal de propagación y el material vegetal de propagación así tratado son objetivos adicionales de la invención.

Otros métodos de aplicación de las composiciones de acuerdo con la invención comprenden aplicación por goteo en la tierra, sumergiendo partes de las plantas tales como bulbos de raíces o tubérculos, remojo de la tierra, así como también inyección del suelo. Estos métodos son conocidos en la técnica.

A fin de aplicar un compuesto de fórmula I como un insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida a una peste, un locus de peste, o a una planta susceptible al ataque por una peste, un compuesto de fórmula I es generalmente formulado en una composición la cual incluye, además del compuesto de fórmula I, un diluyente inerte adecuado o portador y, opcionalmente, un adyuvante de la formulación en forma de un agente tensioactivo (SFA, según sus siglas en inglés) según lo descrito en esta invención o, por ejemplo, en EP–B–1062217. SFAs son químicos los cuales son capaces de modificar las propiedades de una interfase (por ejemplo, interfases líquido/ sólido, líquido/ aire o líquido/ líquido) reduciendo la tensión interfacial y de ese modo conduciendo a cambios en otras propiedades (por ejemplo dispersión, emulsificación y humectación). Se prefiere que todas las

composiciones (tanto las formulaciones sólidas como líquidas) comprendan, en peso, de 0,0001 a 95%, más preferentemente de 1 a 85%, por ejemplo de 5 a 60%, de un compuesto de fórmula I. La composición es generalmente utilizada para el control de las pestes de modo que un compuesto de fórmula I sea aplicado en una proporción de entre 0,1g y 10kg por hectárea, preferentemente entre 1g y 6kg por hectárea, más preferentemente entre 1g y 1kg por hectárea.

Cuando se utiliza en un recubrimiento de semilla, un compuesto de fórmula I se utiliza en una proporción de 0,0001g a 10g (por ejemplo 0,001g o 0,05g), preferentemente 0,005g a 10g, más preferentemente 0,005g a 4g, por kilogramo de semilla.

En otro aspecto, la presente invención proporciona una composición insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida que comprende una cantidad eficaz insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de fórmula I y un portador o diluyente adecuado para el mismo.

En un aspecto adicional, la invención proporciona un método para combatir y controlar pestes en un locus el cual comprende tratar a las pestes o al locus de las pestes con una cantidad eficaz insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de una composición que comprende un compuesto de fórmula I.

Las composiciones pueden seleccionarse entre una cantidad de tipos de formulación, incluyendo polvos espolvoreables (DP, según sus siglas en inglés), polvos solubles (SP, según sus siglas en inglés), gránulos solubles en agua (SG, según sus siglas en inglés), gránulos dispersables en agua (WG, según sus siglas en inglés), polvos humectables (WP, según sus siglas en inglés), gránulos (GR, según sus siglas en inglés) (liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL, según sus siglas en inglés), líquidos miscibles en aceite (OL, según sus siglas en inglés), líquidos de volumen ultrabajo (UL, según sus siglas en inglés), concentrados emulsionables (EC, según sus siglas en inglés), concentrados dispersables (DC, según sus siglas en inglés), emulsiones (tanto aceite en agua (EW, según sus siglas en inglés) como agua en aceite (EO, según sus siglas en inglés)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (SC, según sus siglas en inglés), concentrados en suspensión con base oleosa (OD, según sus siglas en inglés), aerosoles, formulaciones de nebulizado/ humo, suspensiones en cápsula (CS) y formulaciones para el tratamiento de la semilla. El tipo de

formulación escogida en cualquier caso, dependerá del propósito en particular previsto y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de fórmula I.

Los polvos espolvoreables (DP) pueden prepararse mezclando un compuesto de fórmula I con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo, arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, kieselguhr, creta, tierras de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros portadores sólidos orgánicos e inorgánicos) y triturando mecánicamente la mezcla hasta un polvo fino.

Los polvos solubles (SP) pueden prepararse mezclando un compuesto de fórmula I con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tal como bicarbonato sódico, carbonato sódico o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes, o una mezcla de dichos agentes para mejorar la dispersabilidad/ solubilidad en agua. Luego, la mezcla se tritura hasta un polvo fino. Composiciones similares también pueden ser granuladas para formar gránulos solubles en agua (SG).

Los polvos humectables (WP) pueden prepararse mezclando un compuesto de fórmula I con uno o más diluyentes o portadores sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferentemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. Luego, la mezcla se tritura hasta un polvo fino. Pueden granularse además composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (WG).

Los gránulos (GR) pueden formarse ya sea granulando una mezcla de un compuesto de fórmula I y uno o más diluyentes o portadores en polvo, o de gránulos blanco preformados absorbiendo un compuesto de fórmula I (o su solución, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de attapulguita, tierra de fuller, kieselguhr, tierras diatomáceas o mazorcas de maíz trituradas) o adsorbiendo un compuesto de fórmula I (o una solución del mismo, en un agente adecuado) sobre un material núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos minerales, sulfatos o fosfatos) y secado en caso de ser necesario. Los agentes que son utilizados comúnmente para ayudar a

la absorción o adsorción incluyen solventes (tales como solventes de petróleo alifáticos y aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes de la pegajosidad (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes de polivinilo, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También pueden incluirse uno o más otros aditivos en gránulos (por ejemplo un agente emulsionante, agente humectante o agente de dispersión).

Los concentrados dispersables (DC) pueden prepararse disolviendo un compuesto de fórmula I en agua o un solvente orgánico, tal como una cetona, alcohol o glicoléter. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo para mejorar la dilución en agua o para evitar la cristalización en un tanque de fumigación).

Pueden prepararse concentrados emulsionables (EC) o emulsiones aceite en agua (EW) disolviendo un compuesto de fórmula I en un solvente orgánico (opcionalmente conteniendo uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los solventes orgánicos adecuados para utilizar en ECs incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, ejemplificados por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una Marca Comercial Registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), N–alquilpirrolidonas (tales como N–metilpirrolidona o N–octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de ácido graso C_8–C_{10}) e hidrocarburos clorados. Un producto EC puede emulsionarse espontáneamente con la adición a agua, para producir una emulsión con suficiente estabilidad para permitir la aplicación por fumigación a través de un equipo apropiado. La preparación de una EW involucra obtener un compuesto de fórmula I ya sea como un líquido (en caso de no ser un líquido a temperatura ambiente, puede fundirse a una temperatura razonable, típicamente por debajo de 70°C) o en solución (disolviéndolo en un solvente apropiado) y luego emulsionando el líquido o solución resultante en agua que contiene uno o más SFAs, bajo alto corte, para producir una emulsión. Los solventes adecuados para utilizar en EWs incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), solventes aromáticos (tales

como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros solventes orgánicos apropiados los cuales tienen una baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) pueden prepararse mezclando agua con una mezcla de uno o más solventes con uno o más SFAs, para producir en forma espontánea una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un compuesto de fórmula I está presente inicialmente en el agua o en la mezcla de solvente/SFA. Los solventes adecuados para utilizar en MEs incluyen aquellos descritos anteriormente en la presente para utilizar en ECs o en EWs. Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (cuál sistema está presente puede determinarse mediante mediciones de conductividad) y pueden ser adecuadas para mezclar pesticidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Una ME es adecuada para dilución en agua, ya sea permaneciendo como una microemulsión o formando una emulsión de aceite en agua convencional.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula I. SCs pueden ser preparados mediante molido de bolas o de perlas del compuesto sólido de fórmula I en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Puede incluirse uno o más agentes humectantes en la composición y puede incluirse un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual las partículas se asientan. Alternativamente, un compuesto de fórmula I puede ser molido en seco y agregado al agua, conteniendo agentes descritos con anterioridad en la presente, para producir el producto final deseado.

Puede prepararse similarmente un concentrado en suspensión con base oleosa (OD) suspendiendo partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula I en un fluido orgánico (por ejemplo por lo menos un aceite mineral o aceite vegetal). ODs pueden comprender además por lo menos un promotor de la penetración (por ejemplo un etoxilato de alcohol o un compuesto relacionado), por lo menos un surfactante no iónico y/o por lo menos un surfactante aniónico, y opcionalmente por lo menos un aditivo del grupo de los emulsionantes, agentes inhibidores de espuma, conservantes, antioxidantes,

colorantes y/o materiales de relleno inertes. Un OD está destinado y es adecuado para la dilución con agua antes de su utilización para producir una solución para fumigación con estabilidad suficiente para permitir la aplicación por fumigación a través de un equipo apropiado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de fórmula I y un propulsor adecuado (por ejemplo *n*–butano). Un compuesto de fórmula I también puede ser disuelto o dispersado en un medio adecuado (por ejemplo agua o un líquido miscible en agua, tal como *n*–propanol) para proporcionar composiciones en bombas no presurizadas, de fumigación accionadas manualmente.

Un compuesto de fórmula I puede ser mezclado en el estado seco con una mezcla pirotécnica para formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contiene el compuesto.

Pueden prepararse suspensiones en cápsulas (CS) en forma similar a la preparación de las formulaciones EW aunque con una etapa de polimerización adicional de modo que se obtenga una dispersión acuosa de gotas de aceite, en la cual cada gota de aceite está encapsulada por una vaina polimérica y contiene un compuesto de fórmula I y, opcionalmente, un portador o diluyente para el mismo. La vaina polimérica puede ser producida mediante ya sea una reacción de policondensación interfacial o mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar una liberación controlada del compuesto de fórmula I y pueden utilizarse para el tratamiento de la semilla. Un compuesto de fórmula I también puede ser formulado en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación lenta, controlada, del compuesto.

Un compuesto de fórmula I puede ser formulado también para utilizar como un tratamiento de la semilla, por ejemplo como una composición en polvo, incluyendo un polvo para el tratamiento de la semilla en seco (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para el tratamiento de una suspensión (WS), o como una composición líquida, incluyendo un concentrado fluible (FS), una solución (LS) o una suspensión en cápsula (CS). Las preparaciones de las composiciones DS, SS, WS, FS y LS son muy similares a aquellas de, respectivamente, las composiciones DP, SP, WP, SC, OD y DC descritas anteriormente. Las composiciones para tratar la semilla pueden incluir un

agente para ayudar a la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de película).

Una composición de la presente invención puede incluir uno o más aditivos para mejorar el rendimiento biológico de la composición (por ejemplo mejorando la humectación, retención o distribución en superficies; resistencia a la lluvia en las superficies tratadas; o captación o movilidad de un compuesto de fórmula I). Dichos aditivos incluyen agentes tensioactivos (SFAs), aditivos de la pulverización a base de aceites, por ejemplo ciertos aceites minerales, aceites vegetales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja y aceite de semilla de colza), y mezclas de estos con otros adyuvantes bio–potenciadores (ingredientes los cuales pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de fórmula I).

El aumento del efecto de un compuesto de fórmula I puede lograrse, por ejemplo, agregando sales de amonio y/o fosfonio, y/u opcionalmente por lo menos un promotor de la penetración tal como alcoxilatos de alcohol graso (por ejemplo éster metílico de aceite de colza) o ésteres de aceites vegetales.

Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser agentes tensioactivos (SFAs) del tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

Los SFAs adecuados del tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo bromuro de cetiltrimetil amonio), imidazolinas y sales de amina.

Los SFA aniónicos adecuados incluyen sales de metales alcalinos de ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo laurilsulfato sódico), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecilbencensulfonato sódico, dodecilbencensulfonato cálcico, sulfonato de butilnaftaleno y mezclas de di–*iso*propil– y tri–*iso*propil–naftalensulfonatos sódicos), éter sulfatos, éter sulfatos de alcohol (por ejemplo lauret–3–sulfato sódico), éter carboxilatos (por ejemplo lauret–3–carboxilato sódico), ésteres de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (predominantemente mono–ésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente di–ésteres), por ejemplo la reacción entre lauril alcohol y

ácido tetrafosfórico; adicionalmente estos productos pueden ser etoxilados), sulfosuccinamatos, sulfonatos de parafina u olefina, tauratos y lignosulfonatos.

Los SFA adecuados del tipo anfóteros incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

Los SFA adecuados del tipo no iónico incluyen productos de condensación de óxidos de alquileno, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquilfenoles (tales como octilfenol, nonilfenol o octilcresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo ésteres de polietilenglicol de ácido graso); óxidos de amina (por ejemplo óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.

Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa sódica) y arcillas de dilatación (tales como bentonita o atapulgita).

Un compuesto de fórmula I puede aplicarse mediante cualquier medio conocido de aplicación de compuestos pesticidas. Por ejemplo, puede aplicarse, formulado o no formulado, a las pestes o al locus de las pestes (tal como un hábitat de las pestes, o a una planta en crecimiento que puede ser infestada por las pestes) o a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, tallos, ramas o raíces, a la semilla antes de ser plantada o a otro medio en el cual las plantas están creciendo o van a plantarse (tal como a la tierra que rodea las raíces, la tierra en general, arrozal o sistemas de cultivo hidropónicos), directamente o puede pulverizarse, espolvorearse, aplicarse por inmersión, aplicarse como una formulación en crema o pasta, aplicarse como un vapor o aplicarse a través de la distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granulada o una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en tierra o un medio ambiente acuoso.

Un compuesto de fórmula I también puede ser inyectado en las plantas o fumigado sobre la vegetación utilizando técnicas de fumigación electrodinámica u

otros métodos de bajo volumen, o puede aplicarse por sistemas de riego terrestres o aéreos.

Las composiciones para utilizar como preparaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) son generalmente suministradas en la forma de un concentrado que contiene una elevada proporción del ingrediente activo, siendo agregado el concentrado al agua antes del uso. Estos concentrados, los cuales pueden incluir DCs, SCs, ODs, ECs, EWs, MEs SGs, SPs, WPs, WGs y CSs, son a menudo requeridos para soportar el almacenamiento durante períodos prolongados y, después de dicho almacenamiento, poderse agregar al agua para formar preparaciones acuosas las cuales permanecen homogéneas durante un tiempo suficiente para permitirles ser aplicados por equipos de fumigación convencionales. Dichas preparaciones acuosas pueden contener diversas cantidades de un compuesto de fórmula I (por ejemplo de 0,0001 a 10%, en peso) dependiendo del propósito para el cual deben utilizarse.

Un compuesto de fórmula I puede utilizarse en mezclas con fertilizantes (por ejemplo fertilizantes que contienen nitrógeno, potasio o fósforo, y más particularmente fertilizantes de nitrato de amonio y/o urea). Los tipos de formulaciones adecuados incluyen gránulos de fertilizante. Las mezclas contienen, adecuadamente, hasta 25% en peso del compuesto de fórmula I.

Por lo tanto, la invención también proporciona una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de fórmula I.

Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos que tienen actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o compuestos que tienen actividad fungicida o los cuales poseen actividad reguladora del crecimiento de las plantas, herbicida, antídoto, insecticida, nematicida o acaricida.

El compuesto de fórmula I puede ser el único ingrediente activo de la composición o puede estar mezclado con uno o más ingredientes activos adicionales tales como un pesticida (pesticida de insectos, ácaros, moluscos y nematodos), fungicida, sinergista, herbicida, antídoto o regulador del crecimiento vegetal donde resulte apropiado. La actividad de las composiciones de acuerdo con la invención puede por ende ser ampliada considerablemente y puede tener ventajas sorprendentes las cuales también pueden ser descritas, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Un ingrediente activo adicional puede:

proporcionar una composición que tiene un espectro más amplio de actividad o mayor persistencia en un locus; proporcionar una composición que demuestra mejor tolerancia a las plantas/ cultivos reduciendo la fitotoxicidad; proporcionar una composición que controla insectos en sus diferentes estadios de desarrollo; sinergizar la actividad o complementar la actividad (por ejemplo aumentando la velocidad de efecto o superando la repelencia) del compuesto de fórmula I; o ayudar a superar o prevenir el desarrollo de resistencia a los componentes individuales. El ingrediente activo adicional particular dependerá de la utilidad pretendida de la composición. Los ejemplos de pesticidas adecuados incluyen los siguientes:

a) Piretroides, tales como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cihalotrina (en particular lambda–cihalotrina), bifentrina, fenpropatrina, ciflutrina, teflutrina, piretroides seguros para los peces (por ejemplo etofenprox), piretrina natural, tetrametrina, s–bioaletrina, fenflutrina, praletrina o carboxilato de 5–bencil–3–furilmetil–(E)–(1R,3S)–2,2–dimetil– 3–(2–oxotiolan–3–ilidenmetil)ciclopropano;

b) Organofosfatos, tales como, profenofos, sulprofos, acefato, metil paration, azinfos–metilo, demeton–s–metilo, heptenofos, tiometon, fenamifos, monocrotofos, profenofos, triazofos, metamidofos, dimetoato, fosfamidon, malation, clorpirifos, fosalona, terbufos, fensulfotion, fonofos, forato, foxim, pirimifos–metilo, pirimifos–etilo, fenitrotion, fostiazato o diazinon;

c) Carbamatos (incluyendo arilcarbamatos), tales como pirimicarb, triazamato, cloetocarb, carbofuran, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbosulfan, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomil u oxamil;

d) Benzoilureas, tales como diflubenzuron, triflumuron, hexaflumuron, flufenoxuron o clorfluazuron;

e) Compuestos de estaño orgánicos, tales como cihexatina, óxido de fenbutatina o azociclotina;

f) Pirazoles, tales como tebufenpirad y fenpiroximato;

g) Macrólidos, tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, o espinosad, espinetoram o azadiractina;

h) Hormonas o feromonas;

i) Compuestos de organocloro tales como endosulfan, hexacloruro de benceno, DDT, clordano o dieldrina;

j) Amidinas, tales como clordimeform o amitraz;

k) Agentes de la fumigación, tales como cloropicrina, dicloropropano, bromuro de metilo o metam;

l) Compuesto neonicotinoides, tales como imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid, clotianidina, nitenpiram, dinotefuran o tiametoxam;

m) Diacilhidrazinas, tales como tebufenozida, cromafenozida o metoxifenozida;

n) Difenil éteres, tales como diofenolan o piriproxifen;

o) Indoxacarb;

p) Clorfenapir;

q) Pimetrozina o pirifluquinazon;

r) Espirotetramato, espirodiclofeno o espiromesifeno;

s) Flubendiamida, clorantraliniprol, o ciantraniliprol;

t) Cienopirafeno o ciflumetofeno; o

u) Sulfoxaflor.

Además de las clases químicas principales de pesticidas enlistados más arriba, pueden emplearse en la composición otros pesticidas que tienen objetivos particulares, en caso apropiado, para la utilidad pretendida de la composición. Por ejemplo, pueden emplearse insecticidas selectivos para cultivos particulares, por ejemplo insecticidas específicos del taladrador del tallo (tales como cartap) o insecticidas específicos de saltamontes (tales como buprofezina) para utilizar en el arroz. Alternativamente, también pueden incluirse en las composiciones insecticidas o acaricidas específicos para la especie/ estadio de insecto en particular (por ejemplo ovo–larvicidas acaricidas, tales como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifon; motilicidas acaricidas, tales como dicofol o propargita; acaricidas, tales como bromopropilato o clorobencilato; o reguladores del crecimiento, tales como hidrametilnon, ciromazina, metopreno, clorfluazuron o diflubenzuron).

Las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula I con ingredientes activos son preferidas, donde, preferentemente, el término "COMPUESTO DE FÓRMULA I" se refiere a un compuesto seleccionado de las Tablas 1 a 102:

un adyuvante seleccionado del grupo de sustancias formado por un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres de alquilo de dichos aceites o mezclas de dichos aceites, y aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un acaricida seleccionado del grupo de sustancias formado por 1,1–bis(4–clorofenil)–2–etoxietanol (nombre del IUPAC) (910) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2,4–diclorofenil bencensulfonato (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–fluor–*N*–metil–*N*–1–naftilacetamida (nombre del IUPAC) (1295) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 4–clorofenil fenil sulfona (nombre del IUPAC) (981) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, abamectina (1) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acequinocil (3) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetoprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acrinatrina (9) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aldicarb (16) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aldoxicarb (863) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alfa–cipermetrina (202) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amidition (870) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amidoflumet [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amidotioato (872) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amiton (875) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amiton hidrógeno oxalato (875) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amitraz (24) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aramita (881) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, óxido arsenoso (882) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, AVI 382 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, AZ 60541 (código de. compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azinfos–etilo (44) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azinfos–metilo (45) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azobenceno (nombre del IUPAC) (888) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azociclotina (46) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azotoato (889) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benomil (62) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benoxafos (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benzoximato (71) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benzoato de bencilo (nombre del IUPAC) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bifenazato (74) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bifentrina (76) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, binapacril (907) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, brofenvalerato (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromo-ciclen (918) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromofos (920) + COMPUESTO

DE FÓRMULA I, bromofos–etilo (921) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromopropilato (94) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, buprofezin (99) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butocarboxim (103) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butoxicarboxim (104) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butilpiridabeno (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, polisulfuro cálcico (nombre del IUPAC) (111) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, canfeclor (941) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbanolato (943) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbarilo (115) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbofurano (118) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbofenotion (947) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quinometionato (126) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorbensida (959) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clordimeform (964) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorhidrato de clordimeform (964) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfenapir (130) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfenetol (968) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfenson (970) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfensulfuro (971) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfenvinfos (131) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorobencilato (975) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloromebuform (977) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorometiuron (978) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloropropilato (983) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorpirifos (145) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorpirifos–metilo (146) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clortiofos (994) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cinerina I (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cinerina II (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cinerinas (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clofentezina (158) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, closantel (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cumafos (174) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, crotamiton (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, crotoxifos (1010) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cufraneb (1013) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ciantoato (1020) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cienopirafen [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ciflumetofen (Nº de Reg. CAS: 400882–07–7) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cihalotrina (196) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cihexatina (199) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cipermetrina (201) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DCPM (1032) +

COMPUESTO DE FÓRMULA I, DDT (219) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demefion (1037) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demefion–O (1037) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demefion–S (1037) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton (1038) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–metilo (224) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–O (1038) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–O–metilo (224) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–S (1038) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–S–metilo (224) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–S–metilsulfon (1039) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diafentiuron (226) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dialifos (1042) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diazinon (227) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclofluanida (230) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclorvos (236) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclifos (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dicofol (242) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dicrotofos (243) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dienoclor (1071) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diflovidazina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimefox (1081) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetoato (262) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinactina (nombre alternativo) (653) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinex (1089) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinex–diclexina (1089) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinobuton (269) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinocap (270) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinocap–4 [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinocap–6 [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinocton (1090) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinopenton (1092) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinosulfon (1097) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinoterbon (1098) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dioxation (1102) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, difenilsulfona (nombre del IUPAC) (1103) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, disulfiram (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, disulfoton (278) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DNOC (282) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dofenapin (1113) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, endosulfan (294) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, endotion (1121) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, EPN (297) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etion (309) + COMPUESTO

DE FÓRMULA I, etoato–metilo (1134) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etoxazol (320) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etrimfos (1142) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenazaflor (1147) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenazaquin (328) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, óxido de fenbutatina (330) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenotiocarb (337) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenpropatrina (342) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenpirad (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenpiroximato (345) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenson (1157) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fentrifanil (1161) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenvalerato (349) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fipronil (354) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluacripirim (360) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluazuron (1166) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flubenzimina (1167) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flucicloxuron (366) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flucitrinato (367) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluenetilo (1169) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flufenoxuron (370) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flumetrina (372) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluorbensida (1174) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluvalinato (1184) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formetanato (405) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorhidrato de formetanato (405) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formotion (1192) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formparanato (1193) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, gamma–HCH (430) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, gliodina (1205) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, halfenprox (424) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, heptenofos (432) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexadecil ciclopropancarboxilato (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexitiazox (441) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, IKA 2002 (Nº de Reg. CAS: 211923–74–9) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, yodometano (nombre del IUPAC) (542) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isocarbofos (nombre alternativo) (473) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *O*–(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre del IUPAC) (473) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, jasmolina I (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, jasmolina II (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, jodfenfos (1248) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lindano (430) +

COMPUESTO DE FÓRMULA I, lufenuron (490) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, malation (492) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, malonoben (1254) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mecarbam (502) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mefosfolan (1261) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mesulfen (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metacrifos (1266) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metamidofos (527) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metidation (529) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metiocarb (530) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metomil (531) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromuro de metilo (537) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metolcarb (550) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mevinfos (556) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mexacarbato (1290) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, milbemectina (557) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mipafox (1293) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, monocrotofos (561) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, morfotion (1300) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, naled (567) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NC–184 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NC–512 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nifluridide (1309) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nikkomicinas (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nitrilacarb (1313) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, complejo de nitrilacarb 1:1 cloruro de zinc (1313) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NNI–0101 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NNI–0250 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ometoato (594) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxamil (602) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxideprofos (1324) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxidisulfoton (1325) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pp'–DDT (219) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, paration (615) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, permetrina (626) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenkapton (1330) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fentoato (631) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, forato (636) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosalona (637) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfolan (1338) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosmet (638) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfamidon

(639) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, foxim (642) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimifos–metilo (652) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, polinactinas (nombre alternativo) (653) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, proclonol (1350) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, profenofos (662) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, promacil (1354) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, propargita (671) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, propetanfos (673) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, propoxur (678) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, protidation (1360) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, protoato (1362) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piretrina I (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piretrina II (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piretrinas (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piridabeno (699) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piridafention (701) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimidifeno (706) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimitato (1370) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quinalfos (711) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quintiofos (1381) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, R–1492 (código de desarrollo) (1382) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, RA–17 (código de desarrollo) (1383) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, rotenona (722) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, schradan (1389) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sebufos (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SI–0009 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sofamida (1402) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espirodiclofen (738) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espiromesifen (739) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SSI–121 (código de desarrollo) (1404) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfiram (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfluramida (750) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfotep (753) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azufre (754) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SZI–121 (código de desarrollo) (757) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tau–fluvalinato (398) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tebufenpirad (763) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, TEPP (1417) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, terbam (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetraclorvinfos (777) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetradifon (786) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetranactina (nombre

alternativo) (653) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetrasul (1425) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiafenox (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiocarboxima (1431) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiofanox (800) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiometon (801) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tioquinox (1436) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triamifos (1441) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triarateno (1443) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triazofos (820) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triazuron (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triclorfon (824) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trifenofos (1455) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trinactina (nombre alternativo) (653) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, vamidotion (847) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, vaniliprol [CCN] y YI–5302 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un alguicida seleccionado del grupo de sustancias formado por betoxazina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dioctanoato de cobre (nombre del IUPAC) (170) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfato de cobre (172) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cibutrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclona (1052) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclorofen (232) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, endotal (295) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fentina (347) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cal hidratada [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nabam (566) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quinoclamina (714) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quinonamida (1379) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, simazina (730) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetato de trifenilestaño (nombre del IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre del IUPAC) (347) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un antihelmíntico seleccionado del grupo de sustancias formado por abamectina (1) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, crufomato (1011) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, emamectina (291) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benzoato de emamectina (291) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piperazina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espinosad (737) y tiofanato (1435) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un avicida seleccionado del grupo de sustancias formado por cloralosa (127) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, endrina (1122) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fention (346) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piridin–4–amina (nombre del IUPAC) (23) y estriqunina (745) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un bactericida seleccionado del grupo de sustancias formado por 1–hidroxi–1*H*–piridin–2–tiona (nombre del IUPAC) (1222) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 4–(quinoxalin–2–ilamino)bencensulfonamida (nombre del IUPAC) (748) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfato de 8–hidroxiquinolina (446) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bronopol (97) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dioctanoato de cobre (nombre del IUPAC) (170) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hidróxido de cobre (nombre del IUPAC) (169) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cresol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclorofeno (232) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dipiritiona (1105) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dodicina (1112) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenaminosulf (1144) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formaldehído (404) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hidrargafen (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, kasugamicina (483) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorhidrato de kasugamicina hidrato (483) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel (nombre del IUPAC) (1308) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nitrapirina (580) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, octilinona (590) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ácido oxolínico (606) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxitetraciclina (611) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfato de hidroxiquinolina potásica (446) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, probenazol (658) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, estreptomicina (744) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sesquisulfato de estreptomicina (744) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tecloftalam (766) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, y tiomersal (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un agente biológico seleccionado del grupo de sustancias formado por *Adoxophyes orana* GV (nombre alternativo) (12) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

Agrobacterium radiobacter (nombre alternativo) (13) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Amblyseius* spp. (nombre alternativo) (19) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Anagrapha falcifera* NPV (nombre alternativo) (28) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Anagrus atomus* (nombre alternativo) (29) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Aphelinus abdominalis* (nombre alternativo) (33) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Aphidius colemani* (nombre alternativo) (34) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Aphidoletes aphidimyza* (nombre alternativo) (35) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Autographa californica* NPV (nombre alternativo) (38) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus firmus* (nombre alternativo) (48) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus sphaericus* Neide (nombre científico) (49) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus thuringiensis* Berliner (nombre científico) (51) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai* (nombre científico) (51) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus thuringiensis* subesp. *israelensis* (nombre científico) (51) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus thuringiensis* subesp. *japonensis* (nombre científico) (51) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki* (nombre científico) (51) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Bacillus thuringiensis* subesp. *tenebrionis* (nombre científico) (51) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Beauveria bassiana* (nombre alternativo) (53) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Beauveria brongniartii* (nombre alternativo) (54) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Chrysoperla carnea* (nombre alternativo) (151) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Cryptolaemus montrouzieri* (nombre alternativo) (178) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Cydia pomonella* GV (nombre alternativo) (191) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Dacnusa sibirica* (nombre alternativo) (212) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Diglyphus isaea* (nombre alternativo) (254) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Encarsia formosa* (nombre científico) (293) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Eretmocerus eremicus* (nombre alternativo) (300) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Helicoverpa zea* NPV (nombre alternativo) (431) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Heterorhabditis bacteriophora* y *H. megidis* (nombre alternativo) (433) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Hippodamia convergens* (nombre alternativo) (442) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Leptomastix dactylopii* (nombre alternativo) (488) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Macrolophus caliginosus* (nombre alternativo) (491) + COMPUESTO DE

000317

FÓRMULA I, *Mamestra brassicae* NPV (nombre alternativo) (494) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Metaphycus helvolus* (nombre alternativo) (522) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (nombre científico) (523) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (nombre científico) (523) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Neodiprion sertifer* NPV y *N. lecontei* NPV (nombre alternativo) (575) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Orius* spp. (nombre alternativo) (596) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Paecilomyces fumosoroseus* (nombre alternativo) (613) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Phytoseiulus persimilis* (nombre alternativo) (644) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, virus de polihedrosis nuclear multicápside de *Spodoptera exigua* (nombre científico) (741) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema bibionis* (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema carpocapsae* (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema feltiae* (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema glaseri* (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema riobrave* (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema riobravis* (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema scapterisci* (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Steinernema* spp. (nombre alternativo) (742) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Trichogramma* spp. (nombre alternativo) (826) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *Typhlodromus occidentalis* (nombre alternativo) (844) y *Verticillium lecanii* (nombre alternativo) (848) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un esterilizante del suelo seleccionado del grupo de sustancias formado por yodometano (nombre del IUPAC) (542) y bromuro de metilo (537) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un quimioesterilizante seleccionado del grupo de sustancias formado por afolato [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bisazir (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, busulfan (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diflubenzuron (250) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimatif (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hemel [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hempa [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metepa [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

metiotepa [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, afolato de metilo [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, morzid [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, penfluron (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tepa [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiohempa (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiotepa (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tretamina (nombre alternativo) [CCN] y uredepa (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

una feromona de insecto seleccionada del grupo de sustancias formado por (*E*)–dec–5–en–1–il acetato con (*E*)–dec–5–en–1–ol (nombre del IUPAC) (222) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*E*)–tridec–4–en–1–il acetato (nombre del IUPAC) (829) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*E*)–6–metilhept–2–en–4–ol (nombre del IUPAC) (541) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*E,Z*)–tetradeca–4,10–dien–1–il acetato (nombre del IUPAC) (779) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*Z*)–dodec–7–en–1–il acetato (nombre del IUPAC) (285) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*Z*)–hexadec–11–enal (nombre del IUPAC) (436) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*Z*)–hexadec–11–en–1–il acetato (nombre del IUPAC) (437) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*Z*)–hexadec–13–en–11–in–1–il acetato (nombre del IUPAC) (438) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*Z*)–icos–13–en–10–ona (nombre del IUPAC) (448) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (Z)–tetradec–7–en–1–al (nombre del IUPAC) (782) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (*Z*)–tetradec–9–en–1–ol (nombre del IUPAC) (783) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (Z)–tetradec–9–en–1–il acetato (nombre del IUPAC) (784) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (7*E*,9*Z*)–dodeca–7,9–dien–1–il acetato (nombre del IUPAC) (283) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (9*Z*,11*E*)–tetradeca–9,11–dien–1–il acetato (nombre del IUPAC) (780) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, (9*Z*,12*E*)–tetradeca–9,12–dien–1–il acetato (nombre del IUPAC) (781) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 14–metiloctadec–1–eno (nombre del IUPAC) (545) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 4–metilnonan–5–ol con 4–metilnonan–5–ona (nombre del IUPAC) (544) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alfa–multistriatina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, brevicomin (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, codlelure (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, codlemone (nombre alternativo) (167) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cuelure (nombre alternativo) (179) +

COMPUESTO DE FÓRMULA I, disparlure (277) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dodec–8–en–1–il acetato (nombre del IUPAC) (286) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dodec–9–en–1–il acetato (nombre del IUPAC) (287) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dodeca–8 + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 10–dien–1–il acetato (nombre del IUPAC) (284) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dominicalure (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 4–metiloctanoato de etilo (nombre del IUPAC) (317) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, eugenol (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, frontalin (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, gossyplure (nombre alternativo) (420) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, grandlure (421) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, grandlure I (nombre alternativo) (421) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, grandlure II (nombre alternativo) (421) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, grandlure III (nombre alternativo) (421) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, grandlure IV (nombre alternativo) (421) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexalure [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ipsdienol (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ipsenol (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, japonilure (nombre alternativo) (481) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lineatin (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, litlure (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, looplure (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, medlure [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ácido megatomoico (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metil eugenol (nombre alternativo) (540) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, muscalure (563) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, octadeca–2,13–dien–1–il acetato (nombre del IUPAC) (588) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, octadeca–3,13–dien–1–il acetato (nombre del IUPAC) (589) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, orfralure (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oryctalure (nombre alternativo) (317) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ostramone (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, siglure [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sordidin (nombre alternativo) (736) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulcatol (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetradec–11–en–1–il acetato (nombre del IUPAC) (785) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trimedlure (839) + COMPUESTO

DE FÓRMULA I, trimedlure A (nombre alternativo) (839) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trimedlure B_1 (nombre alternativo) (839) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trimedlure B_2 (nombre alternativo) (839) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trimedlure C (nombre alternativo) (839) y trunc–call (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un repelente de insectos seleccionado del grupo de sustancias formado por 2–(octiltio)etanol (nombre del IUPAC) (591) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butopironoxil (933) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butoxi(polipropilenglicol) (936) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dibutil adipato (nombre del IUPAC) (1046) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dibutil ftalato (1047) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dibutil succinato (nombre del IUPAC) (1048) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dietiltoluamida [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetil carbato [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetilftalato [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexanodiol de etilo (1137) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexamida [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metoquin–butilo (1276) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metilneodecanamida [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxamato [CCN] y picaridina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un insecticida seleccionado del grupo de sustancias formado por 1–dicloro–1–nitroetano (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1,1–dicloro–2,2–bis(4–etilfenil)etano (nombre del IUPAC) (1056), + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1,2–dicloropropano (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1,2–dicloropropano con 1,3–dicloropropeno (nombre del IUPAC) (1063) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1–bromo–2–cloroetano (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2,2,2–tricloro–1–(3,4–diclorofenil)etil acetato (nombre del IUPAC) (1451) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2,2–diclorovinil 2–etilsulfiniletil metil fosfato (nombre del IUPAC) (1066) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–(1,3–ditiolan–2–il)fenil dimetilcarbamato (IUPAC/ Chemical Abstracts name) (1109) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–(2–butoxietoxi)etiltiocianato (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–(4,5–dimetil–1,3–dioxolan–2–il)fenil metilcarbamato (nombre del IUPAC/ Chemical

Abstracts) (1084) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–(4–cloro–3,5–xililoxi)etanol (nombre del IUPAC) (986) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–clorovinil dietil fosfato (nombre del IUPAC) (984) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–imidazolidona (nombre del IUPAC) (1225) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–isovalerilindan–1,3–diona (nombre del IUPAC) (1246) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–metil(prop–2–inil)aminofenilmetilcarbamato (nombre del IUPAC) (1284) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 2–tiocianatoetil–laurato (nombre del IUPAC) (1433) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 3–bromo–1–cloroprop–1–eno (nombre del IUPAC) (917) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 3–metil–1–fenilpirazol–5–il dimetilcarbamato (nombre del IUPAC) (1283) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 4–metil(prop–2–inil)amino–3,5–xilil metilcarbamato (nombre del IUPAC) (1285) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 5,5–dimetil–3–oxociclohex–1–enil dimetilcarbamato (nombre del IUPAC) (1085) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, abamectina (1) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acefato (2) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetamiprid (4) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetion (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetoprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acrinatrina (9) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acrilonitrilo (nombre del IUPAC) (861) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alanicarb (15) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aldicarb (16) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aldoxicarb (863) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aldrina (864) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aletrina (17) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alosamidina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alixicarb (866) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alfa–cipermetrina (202) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alfa–ecdisona (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alfa–endosulfan [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfuro de aluminio (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amidition (870) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amidotioato (872) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aminocarb (873) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amiton (875) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amiton hidrógeno oxalato (875) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, amitraz (24) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, anabasina (877) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, atidation (883) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, AVI 382 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, AZ 60541 (código de compuesto) +

COMPUESTO DE FÓRMULA I, azadiractina (nombre alternativo) (41) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azametifos (42) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azinfos–etilo (44) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azinfos–metilo (45) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, azotoato (889) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, delta endotoxinas de *Bacillus thuringiensis* (nombre alternativo) (52) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexafluorsilicato de bario (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, polisulfuro de bario (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bartrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I; Bayer 22/190 (código de desarrollo) (893) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, Bayer 22408 (código de desarrollo) (894) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bendiocarb (58) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benfuracarb (60) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bensultap (66) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, beta–ciflutrina (194) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, beta–cipermetrina (203) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bifentrina (76) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bioaletrina (78) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isómero de *S*–ciclopentenilo de bioaletrina (nombre alternativo) (79) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bioetanometrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, biopermetrina (908) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bioresmetrina (80) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bis(2–cloroetil) éter (nombre del IUPAC) (909) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bistrifluron (83) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, borax (86) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, brofenvalerato (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromfenvinfos (914) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromociclen (918) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromo–DDT (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromofos (920) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromofos–etilo (921) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bufencarb (924) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, buprofezina (99) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butacarb (926) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butatiofos (927) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butocarboxim (103) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butonato (932) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butoxicarboxim (104) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butilpiridabeno (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cadusafos (109) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenato de calcio [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianuro de calcio

(444) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, polisulfuro de calcio (nombre del IUPAC) (111) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, canfeclor (941) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbanolato (943) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbarilo (115) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbofurano (118) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, disulfuro de carbono (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetraclorur de carbono (nombre del IUPAC) (946) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbofenotion (947) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbosulfan (119) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cartap (123) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorhidrato de cartap (123) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cevadina (nombre alternativo) (725) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorantraniliprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorbiciclen (960) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clordano (128) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clordecona (963) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clordimeform (964) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorhidrato de clordimeform (964) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloretoxifos (129) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfenapir (130) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfenvinfos (131) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfluazuron (132) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clormefos (136) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloroformo [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloropicrina (141) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorfoxim (989) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorprazofos (990) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorpirifos (145) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorpirifos–metilo (146) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clortiofos (994) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cromafenozida (150) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cinerina I (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cinerina II (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cinerinas (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cis–resmetrina (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cismetrina (80) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clocitrina (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloetocarb (999) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, closantel (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clotianidina (165) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetoarsenita de cobre [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenato de cobre [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oleato de cobre [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cumafos (174) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cumitoato (1006)

+ COMPUESTO DE FÓRMULA I, crotamiton (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, crotoxifos (1010) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, crufomato (1011) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, criolita (nombre alternativo) (177) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianofenfos (1019) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianofos (184) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ciantoato (1020) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ciantraniliprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cicletrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cicloprotrina (188) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ciflutrina (193) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cihalotrina (196) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cipermetrina (201) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cifenotrina (206) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ciromazina (209) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, citioato (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *d*–limoneno (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *d*–tetrametrina (nombre alternativo) (788) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DAEP (1031) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dazomet (216) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DDT (219) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, decarbofurano (1034) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, deltametrina (223) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demefion (1037) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demefion–O (1037) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demefion–S (1037) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton (1038) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–metilo (224) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–O (1038) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–O–metilo (224) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–S (1038) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–S–metilo (224) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, demeton–S–metilsulfon (1039) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diafentiuron (226) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dialifos (1042) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diamidafos (1044) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diazinon (227) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dicapton (1050) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclofention (1051) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclorvos (236) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclifos (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dicresilo (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dicrotofos (243) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diciclanil (244) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dieldrina (1070)

+ COMPUESTO DE FÓRMULA I, 5–metilpirazol–3–il fosfato de dietilo (nombre del IUPAC) (1076) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diflubenzuron (250) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dilor (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimeflutrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimefox (1081) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetan (1085) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetoato (262) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetrina (1083) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetilvinfos (265) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetilan (1086) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinex (1089) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinex–diclexina (1089) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinoprop (1093) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinosam (1094) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinoseb (1095) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dinotefuran (271) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diofenolan (1099) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dioxabenzofos (1100) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dioxacarb (1101) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dioxation (1102) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, disulfoton (278) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diticrofos (1108) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DNOC (282) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DSP (1115) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ecdisterona (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, EI 1642 (código de desarrollo) (1118) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, emamectina (291) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benzoato de emamectina (291) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, EMPC (1120) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, empentrina (292) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, endosulfan (294) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, endotion (1121) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, endrina (1122) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, EPBP (1123) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, EPN (297) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, epofenonano (1124) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, esfenvalerato (302) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etafos (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etiofencarb (308) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etion (309) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etiprol (310) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etoato–metilo (1134) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etoprofos (312) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formiato de etilo

(nombre del IUPAC) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etil–DDD (nombre alternativo) (1056) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dibromuro de etileno (316) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dicloruro de etileno (nombre químico) (1136) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, óxido de etileno [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etofenprox (319) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etrimfos (1142) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, EXD (1143) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, famfur (323) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenamifos (326) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenazaflor (1147) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenclorfos (1148) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenetacarb (1149) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenflutrina (1150) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenitrotion (335) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenobucarb (336) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenoxacrim (1153) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenoxicarb (340) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenpiritrina (1155) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenpropatrina (342) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenpirad (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fensulfotion (1158) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fention (346) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fention–etilo [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenvalerato (349) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fipronil (354) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flonicamida (358) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flubendiamida (Nº de Reg. CAS.: 272451–65–7) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flucofuron (1168) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flucicloxuron (366) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flucitrinato (367) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluenetilo (1169) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flufenerim [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flufenoxuron (370) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flufenprox (1171) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flumetrina (372) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluvalinato (1184) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fonofos (1191) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formetanato (405) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorhidrato de formetanato (405) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formotion (1192) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, formparanato (1193) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosmetilan (1194) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fospirato (1195) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fostiazato (408) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fostietan (1196) + COMPUESTO DE

FÓRMULA I, furatiocarb (412) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, furetrina (1200) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, gamma–cihalotrina (197) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, gamma–HCH (430) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, guazatina (422) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetatos de guazatina (422) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, GY–81 (código de desarrollo) (423) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, halfenprox (424) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, halofenozida (425) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, HCH (430) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, HEOD (1070) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, heptaclor (1211) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, heptenofos (432) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, heterofos [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexaflumuron (439) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, HHDN (864) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hidrametilnon (443) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianuro de hidrógeno (444) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hidropreno (445) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hiquincarb (1223) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, imidacloprid (458) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, imiprotrina (460) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, indoxacarb (465) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, yodometano (nombre del IUPAC) (542) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, IPSP (1229) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isazofos (1231) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isobenzan (1232) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isocarbofos (nombre alternativo) (473) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isodrina (1235) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isofenfos (1236) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isolano (1237) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isoprocarb (472) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *O*–(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre del IUPAC) (473) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isoprotiolano (474) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isotioato (1244) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isoxation (480) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, jasmolina I (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, jasmolina II (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, jodfenfos (1248) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hormona juvenil I (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hormona juvenil II (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hormona juvenil III (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, kelevan (1249) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

kinopreno (484) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lambda–cihalotrina (198) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenato de plomo [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lepimectina (CCN) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, leptofos (1250) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lindano (430) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lirimfos (1251) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lufenuron (490) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, litidation (1253) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metilcarbamato de *m*–cumenilo (nombre del IUPAC) (1014) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfuro de magnesio (nombre del IUPAC) (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, malation (492) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, malonoben (1254) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mazidox (1255) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mecarbam (502) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mecarfon (1258) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, menazon (1260) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mefosfolan (1261) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloruro mercuroso (513) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mesulfenfos (1263) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metaflumizona (CCN) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metam (519) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metam–potásico (nombre alternativo) (519) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metam–sódico (519) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metacrifos (1266) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metamidofos (527) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluoruro de metansulfonilo (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metidation (529) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metiocarb (530) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metocrotofos (1273) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metomil (531) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metopreno (532) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metoquin–butilo (1276) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metotrina (nombre alternativo) (533) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metoxiclor (534) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metoxifenozida (535) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromuro de metilo (537) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isotiocianato de metilo (543) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metilcloroformo (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloruro de metileno [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metoflutrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metolcarb (550) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metoxadiazona (1288) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mevinfos (556) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mexacarbato (1290) + COMPUESTO DE

FÓRMULA I, milbemectina (557) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mipafox (1293) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mirex (1294) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, monocrotofos (561) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, morfotion (1300) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, naftalofos (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, naled (567) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, naftaleno (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NC–170 (código de desarrollo) (1306) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NC–184 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nicotina (578) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfato de nicotina (578) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nifluridida (1309) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nitenpiram (579) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nitiazina (1311) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nitrilacarb (1313) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, complejo de nitrilacarb 1:1 cloruro de zinc (1313) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NNI–0101 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NNI–0250 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, novaluron (585) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, noviflumuron (586) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *O*–5–dicloro–4–yodofenil *O*–etil etilfosfonotioato (nombre del IUPAC) (1057) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *O,O*–dietil *O*–4–metil–2–oxo–2*H*–cromen–7–il fosforotioato (nombre del IUPAC) (1074) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *O,O*–dietil *O*–6–metil–2–propilpirimidin–4–il fosforotioato (nombre del IUPAC) (1075) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, *O,O,O',O'*–tetrapropil ditiopirofosfato (nombre del IUPAC) (1424) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ácido oleico (nombre del IUPAC) (593) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ometoato (594) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxamilo (602) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxidemeton–metilo (609) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxideprofos (1324) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxidisulfoton (1325) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pp'–DDT (219) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, para–diclorobenceno [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, paration (615) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, paration–metilo (616) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, penfluron (nombre

alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pentaclorofenol (623) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, laurato de pentaclorofenilo (nombre del IUPAC) (623) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, permetrina (626) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, PH 60–38 (código de desarrollo) (1328) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenkapton (1330) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenotrina (630) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fentoato (631) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, forato (636) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosalona (637) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfolan (1338) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosmet (638) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosniclor (1339) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfamidon (639) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfina (nombre del IUPAC) (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, foxim (642) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, foxim–metilo (1340) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimetafos (1344) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimicarb (651) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimifos–etilo (1345) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimifos–metilo (652) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isómeros de policlorodiciclopentadieno (nombre del IUPAC) (1346) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenita potásica [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiocianato potásico [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, praletrina (655) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, precoceno I (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, precoceno II (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, precoceno III (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, primidofos (1349) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, profenofos (662) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, proflutrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, promacil (1354) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, promecarb (1355) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, propafos (1356) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, propetamfos (673) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, propoxur (678) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, protidation (1360) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, protiofos (686) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, protoato (1362) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, protrifenbute [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pimetrozina (688) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piraclofos (689) + COMPUESTO DE

FÓRMULA I, pirafluprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirazofos (693) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piresmetrina (1367) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piretrina I (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piretrina II (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piretrinas (696) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piridabeno (699) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piridalil (700) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piridafention (701) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirifluquinazon [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimidifeno (706) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirimitato (1370) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piriprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piriproxifeno (708) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cuasia (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quinalfos (711) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quinalfos–metilo (1376) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quinotion (1380) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, quintiofos (1381) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, R–1492 (código de desarrollo) (1382) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, rafoxanida (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, resmetrina (719) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, rotenona (722) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, RU 15525 (código de desarrollo) (723) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, RU 25475 (código de desarrollo) (1386) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, riania (nombre alternativo) (1387) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, rianodina (nombre tradicional) (1387) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sabadilla (nombre alternativo) (725) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, schradan (1389) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sebufos (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SI–0009 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SI–0205 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SI–0404 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SI–0405 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, silafluofen (728) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenita sódica [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianuro sódico (444) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluoruro sódico (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, hexafluorsilicato sódico (1400) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pentaclorofenóxido de sodio (623) + COMPUESTO DE

FÓRMULA I, selenato sódico (nombre del IUPAC) (1401) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiocianato sódico [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sofamida (1402) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espinetoram [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espinosad (737) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espiromesifen (739) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espirotetramato [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulcofuron (746) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulcofuron–sódico (746) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfluramida (750) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfotep (753) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfoxaflor [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluoruro de sulfurilo (756) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulprofos (1408) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aceites de alquitrán (nombre alternativo) (758) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tau–fluvalinato (398) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tazimcarb (1412) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, TDE (1414) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tebufenozida (762) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tebufenpirad (763) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tebupirimfos (764) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, teflubenzuron (768) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, teflutrina (769) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, temefos (770) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, TEPP (1417) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, teraletrina (1418) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, terbam (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, terbufos (773) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetracloroetano [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetraclorvinfos (777) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetrametrina (787) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetrametilflutrina (Nº de Reg. CAS.: 84937–88–2) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, teta–cipermetrina (204) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiacloprid (791) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiafenox (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiametoxam (792) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ticrofos (1428) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiocarboxima (1431) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiociclam (798) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiociclam hidrógeno oxalato (798) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiodicarb (799) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiofanox (800) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiometon (801) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tionazina (1434) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiosultap (803) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

tiosultap–sódico (803) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tolfenpirad (809) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tralometrina (812) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, transflutrina (813) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, transpermetrina (1440) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triamifos (1441) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triazamato (818) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triazofos (820) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triazuron (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triclorfon (824) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triclormetafos–3 (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tricloronato (1452) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trifenofos (1455) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triflumuron (835) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trimetacarb (840) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tripreno (1459) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, vamidotion (847) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, vaniliprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, veratridina (nombre alternativo) (725) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, veratrina (nombre alternativo) (725) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, XMC (853) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, xililcarb (854) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, YI–5302 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, zeta–cipermetrina (205) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, zetametrina (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfuro de zinc (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, zolaprofos (1469) y ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un molusquicida seleccionado del grupo de sustancias formado por óxido de bis(tributilestaño) (nombre del IUPAC) (913) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromoacetamida [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenato de calcio [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloetocarb (999) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetoarsenita de cobre [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfato de cobre (172) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fentina (347) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfato férrico (nombre del IUPAC) (352) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metaldehído (518) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metiocarb (530) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, niclosamida (576) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, niclosamida–olamina (576) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pentaclorofenol (623) + COMPUESTO DE

FÓRMULA I, pentaclorofenóxido sódico (623) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tazimcarb (1412) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiodicarb (799) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tralopiril [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, óxido de tributilestaño (913) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trifenmorf (1454) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trimetacarb (840) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetato de trifenilestaño (nombre del IUPAC) (347) y hidróxido de trifenilestaño (nombre del IUPAC) (347) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un nematicida seleccionado del grupo de sustancias formado por AKD–3088 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1,2–dibromo–3–cloropropano (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1,2–dicloropropano (nombre de IUPAC/ Chemical Abstracts) (1062) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1,2–dicloropropano con 1,3–dicloropropeno (nombre del IUPAC) (1063) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1,3–dicloropropeno (233) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 1m1–dióxido de 3,4–diclorotetrahidrotiofeno (nombre del IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 3–(4–clorofenil)–5–metilrodanina (nombre del IUPAC) (980) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ácido 5–metil–6–tioxo–1,3,5–tiadiazinan–3–ilacético (nombre del IUPAC) (1286) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 6–isopentenilaminopurina (nombre alternativo) (210) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, abamectina (1) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetoprol [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alanicarb (15) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aldicarb (16) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, aldoxicarb (863) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, AZ 60541 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benclotiaz [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benomil (62) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butilpiridabeno (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cadusafos (109) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbofuran (118) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, disulfuro de carbono (945) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbosulfan (119) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloropicrina (141) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorpirifos (145) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloetocarb (999) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, citoquininas (nombre alternativo) (210) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dazomet (216) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DBCP (1045) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, DCIP (218) + COMPUESTO DE

FÓRMULA I, diamidafos (1044) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclofention (1051) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diclifos (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dimetoato (262) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, emamectina (291) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, benzoato de emamectina (291) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, etoprofos (312) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, dibromuro de etileno (316) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenamifos (326) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fenpirad (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fensulfotion (1158) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluensulfona (Nº de Reg. CAS.: 318290–98–1) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fostiazato (408) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fostietan (1196) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, furfural (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, GY–81 (código de desarrollo) (423) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, heterofos [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, imiciafos [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, yodometano (nombre del IUPAC) (542) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isamidofos (1230) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isazofos (1231) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, kinetina (nombre alternativo) (210) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, mecarfon (1258) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metam (519) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metam–potásico (nombre alternativo) (519) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metam–sódico (519) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromuro de metilo (537) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isotiocianato de metilo (543) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, composición de *Myrothecium verrucaria* (nombre alternativo) (565) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, NC–184 (código de compuesto) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxamil (602) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, forato (636) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfamidon (639) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfocarb [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sebufos (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, espinosad (737) +

COMPUESTO DE FÓRMULA I, terbam (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, terbufos (773) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tetraclorotiofeno (nombre del IUPAC/ Chemical Abstracts) (1422) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiafenox (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tionazin (1434) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triazofos (820) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, triazuron (nombre alternativo) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, xilenoles [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, YI–5302 (código de compuesto) y zeatina (nombre alternativo) (210) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias formado por etilxantato de potasio [CCN] y nitrapirina (580) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un activador vegetal seleccionado del grupo de sustancias formado por acibenzolar (6) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acibenzolar–*S*–metilo (6) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (nombre alternativo) (720) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un rodenticida seleccionado del grupo de sustancias formado por 2–isovalerilindan–1,3–diona (nombre del IUPAC) (1246) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 4–(quinoxalin–2–ilamino)bencensulfonamida (nombre del IUPAC) (748) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, alfa–clorohidrina [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfuro de aluminio (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, antu (880) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, óxido arsenoso (882) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, carbonato de bario (891) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bistiosemi (912) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, brodifacoum (89) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromadiolona (91) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, brometalina (92) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianuro cálcico (444) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloralosa (127) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorofacinona (140) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, colecalciferol (nombre alternativo) (850) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cumaclor (1004) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cumafurilo (1005) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cumatetralilo (175) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, crimidina (1009) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, difenacum (246) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, difetialona (249) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, difacinona (273) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, ergocalciferol

(301) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flocumafen (357) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluoracetamida (379) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, flupropadina (1183) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, clorhidrato de flupropadina (1183) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, gamma–HCH (430) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, HCH (430) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianuro de hidrógeno (444) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, yodometano (nombre del IUPAC) (542) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, lindano (430) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfuro de magnesio (nombre del IUPAC) (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, bromuro de metilo (537) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, norbormida (1318) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosacetim (1336) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fosfina (nombre del IUPAC) (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fósforo [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pindone (1341) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenita potásica [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, pirinuron (1371) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, scilirosida (1390) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, arsenita sódica [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cianuro de sodio (444) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, fluoracetato de sodio (735) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, estricnina (745) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sulfato de talio [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

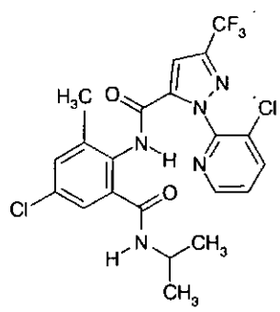
un sinergista seleccionado del grupo de sustancias formado por piperonilato de 2–(2–butoxietoxi)etilo (nombre del IUPAC) (934) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, 5–(1,3–benzodioxol–5–il)–3–hexilciclohex–2–enona (nombre del IUPAC) (903) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, farnesol con nerolidol (nombre alternativo) (324) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, MB–599 (código de desarrollo) (498) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, MGK 264 (código de desarrollo) (296) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, butóxido de piperonilo (649) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piprotal (1343) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, isómero de propilo (1358) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, S421 (código de desarrollo) (724) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sesamex (1393) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, sesasmolina (1394) y sulfóxido (1406) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un repelente de animales seleccionado del grupo de sustancias formado por antraquinona (32) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, cloralosa (127) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, naftenato de cobre [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I, oxicloruro de cobre (171) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diazinon (227) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, diciclopentadieno (nombre químico) (1069) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, guazatina (422) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, acetato de guazatina (422) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, metiocarb (530) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, piridin–4–amina (nombre del IUPAC) (23) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, tiram (804) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, trimetacarb (840) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, naftenato de zinc [CCN] y ziram (856) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un virucida seleccionado del grupo de sustancias formado por imanina (nombre alternativo) [CCN] y ribavirina (nombre alternativo) [CCN] + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

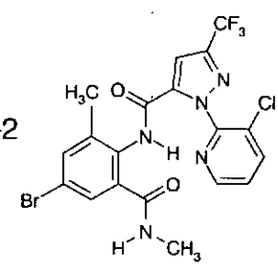
un protector de heridas seleccionado del grupo de sustancias formado por óxido mercúrico (512) + COMPUESTO DE FÓRMULA I, octilinona (590) y tiofanato–metilo (802) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

un insecticida seleccionado del grupo formado por el compuesto de la fórmula A–1

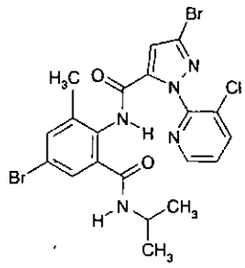


(A–1) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–2

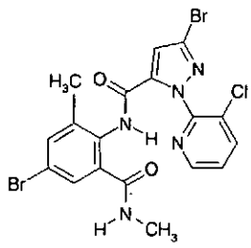


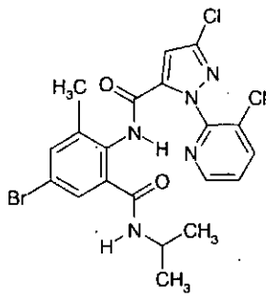
(A–2) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,



(A–3) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

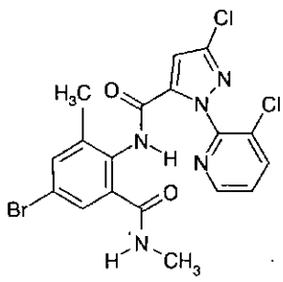
la fórmula A–3

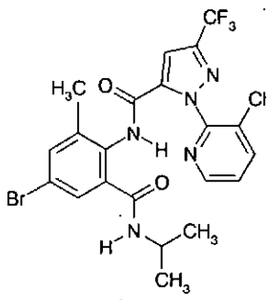
la fórmula A–4  (A–4) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,



(A–5) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

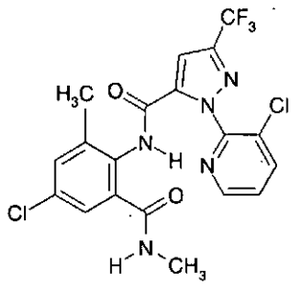
la fórmula A–5

la fórmula A–6  (A–6) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

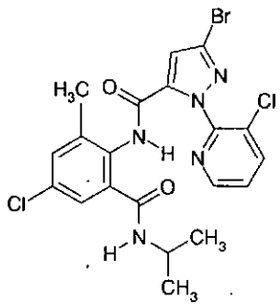


(A–7) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–7

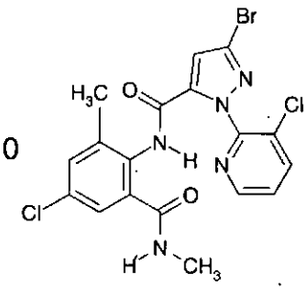


la fórmula A–8 (A–8) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,



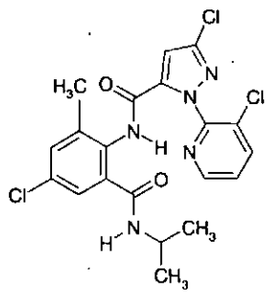
(A–9) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–9



la fórmula A–10 (A–10) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

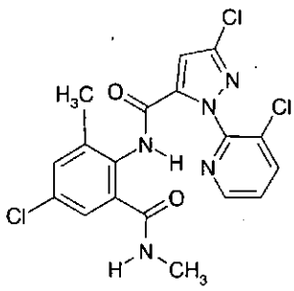
5



(A–11) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

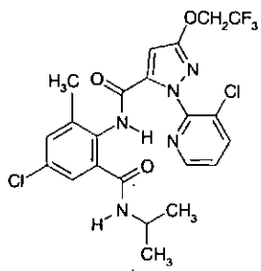
la fórmula A–11

la fórmula A–12



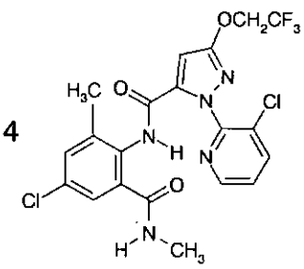
(A–12) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–13

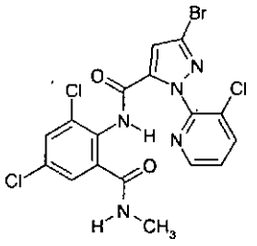


(A–13) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–14

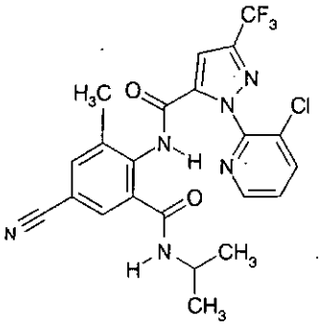


(A–14) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

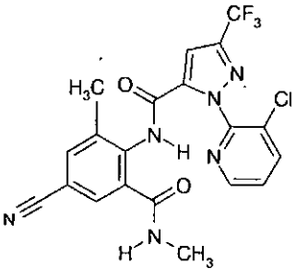


(A–15) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–15

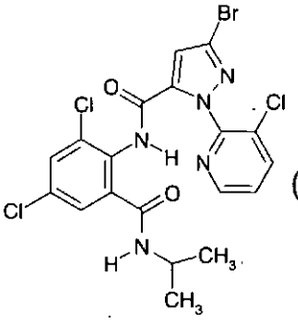


la fórmula A–16 (A–16) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,



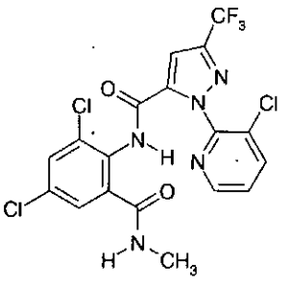
(A–17) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–17



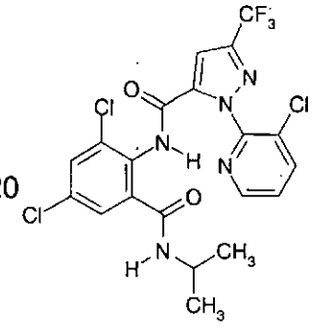
la fórmula A–18 (A–18) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

5

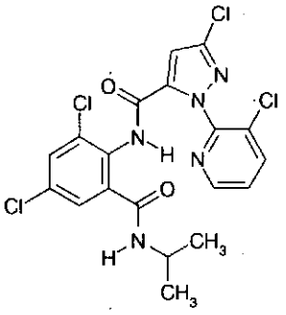


(A–19) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–19

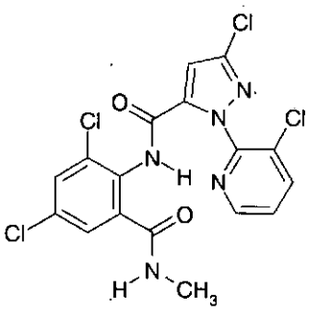


la fórmula A–20 (A–20) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

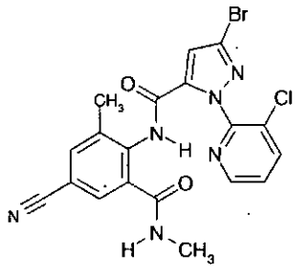


(A–21) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–21

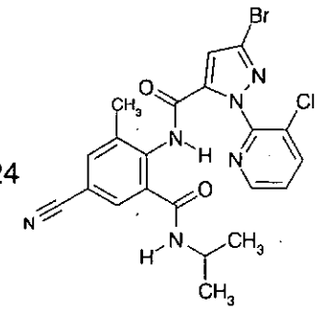


la fórmula A–22 (A–22) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

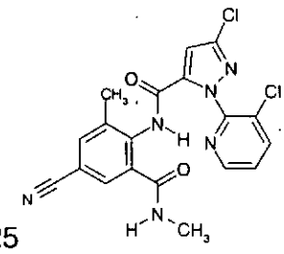


(A–23) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–23

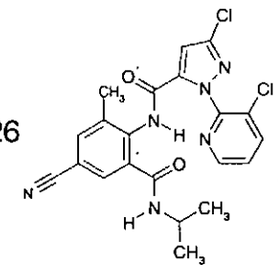


la fórmula A–24 (A–24) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

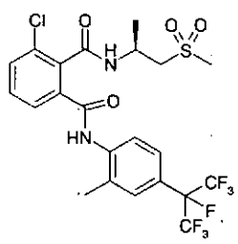


(A–25) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,

la fórmula A–25



la fórmula A–26 (A–26) + COMPUESTO DE FÓRMULA I,



y la fórmula A–27 (A–27) + COMPUESTO DE FÓRMULA I.

Las referencias brindadas entre corchetes después de los ingredientes activos, por ej. *[3878–19–1]* se refiere al número de Registro en Chemical

Abstracts. Los compuestos de la fórmula A–1 a A–26 son descritos en WO 03/015518 o en WO 04/067528. El compuesto de la fórmula A–27 es descrito en WO 06/022225 y en WO 07/112844. Los socios del mezclado antes descritos son conocidos. Donde se incluyen los ingredientes activos en "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual – A World Compendium; Decimotercera Edición; Editor: C. D. S. TomLin; The British Crop Protection Council], se describen en dicho documento bajo el número de entrada proporcionado entre paréntesis en lo que antecede para el compuesto en particular; por ejemplo, el compuesto "abamectina" es descrito bajo el número de entrada (1). Donde se agrega "[CCN]" en lo que antecede al compuesto en particular, el compuesto en cuestión está incluido en "Compendium of Pesticide Common Names" ("El Compendio de Nombres Comunes de Pesticidas"), el cual es accesible en la Internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995–2004]; por ejemplo, el compuesto "acetoprol" es descrito bajo la dirección de Internet http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.htmL.

La mayoría de los ingredientes activos descritos anteriormente son mencionados en lo que antecede por un "nombre común", el "nombre común del ISO" relevante u otro "nombre común" que se utilice en casos individuales. Si la designación no es un "nombre común", la naturaleza de la designación utilizada en cambio se brinda entre paréntesis para el compuesto en particular; en ese caso, se emplea el nombre del IUPAC, el nombre de IUPAC/Chemical Abstracts, un "nombre químico", un "nombre tradicional", un "nombre de compuesto" o un "código de desarrollo" o, si no se utiliza ninguna de esas designaciones ni un "nombre común", se emplea un "nombre alternativo". "Nº de Reg. CAS" significa el Número de Registro en el Chemical Abstracts.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también pueden emplearse en combinación con uno o más fungicidas. En particular, en las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula I con fungicidas, el término COMPUESTO DE FÓRMULA I preferentemente se refiere a un compuesto seleccionado entre uno de las Tablas 1 a 102:

COMPUESTO DE FÓRMULA I + (*E*)–*N*–metil–2–[2–(2,5–dimetilfenoximetil)fenil]–2–metoxi–iminoacetamida (SSF–129), COMPUESTO DE FÓRMULA I + 4–bromo–2–ciano–*N*,*N*–dimetil–6–trifluormetilbencimidazol–1–

sulfonamida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + α–[*N*–(3–cloro–2,6–xilil)–2–metoxi-acetamido]–γ–butirolactona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + 4–cloro–2–ciano–*N*,*N*–dimetil–5–*p*–tolilimidazol–1–sulfonamida (IKF–916, ciamidazosulfamida), COMPUESTO DE FÓRMULA I + 3–5–dicloro–*N*–(3–cloro–1–etil–1–metil–2–oxopropil)–4–metilbenzamida (RH–7281, zoxamida), COMPUESTO DE FÓRMULA I + *N*–alil–4,5,–dimetil–2–trimetilsililtiofen–3–carboxamida (MON65500), COMPUESTO DE FÓRMULA I + *N*–(1–ciano–1,2–dimetilpropil)–2–(2,4–diclorofenoxi)propionamida (AC382042), COMPUESTO DE FÓRMULA I + *N*–(2–metoxi–5–piridil)–ciclopropancarboxamida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + acibenzolar, COMPUESTO DE FÓRMULA I + alanicarb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + aldimorf, COMPUESTO DE FÓRMULA I + amisulbrom, COMPUESTO DE FÓRMULA I + anilazina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + azaconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + azoxistrobina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + benalaxil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + benalaxil–M, COMPUESTO DE FÓRMULA I + benomil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + bentiavalicarb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + biloxazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + bitertanol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + bixafen, COMPUESTO DE FÓRMULA I + blasticidina S, COMPUESTO DE FÓRMULA I + boscalid, COMPUESTO DE FÓRMULA I + bromuconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + bupirimato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + captafol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + captan, COMPUESTO DE FÓRMULA I + carbendazim, COMPUESTO DE FÓRMULA I + clorhidrato de carbendazim, COMPUESTO DE FÓRMULA I + carboxina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + carpropamida, carvona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + CGA41396, COMPUESTO DE FÓRMULA I + CGA41397, COMPUESTO DE FÓRMULA I + quinometionato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + clazafenona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + clorotalonil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + clorozolinato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + clozilacon, COMPUESTO DE FÓRMULA I + compuestos que contienen cobre tales como oxicloruro de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre y mezcla de Bordeaux, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ciazofamida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ciflufenamida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + cimoxanil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ciproconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ciprodinil, COMPUESTO DE FÓRMULA I +

debacarb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + di–2–piridil disulfuro 1,1'–dióxido, COMPUESTO DE FÓRMULA I + diclofluanida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + diclomezina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dicloran, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dietofencarb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + difenoconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + difenzoquat, COMPUESTO DE FÓRMULA I + diflumetorim, COMPUESTO DE FÓRMULA I + *O,O*–di–*iso*–propil–*S*–bencil tiofosfato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dimefluazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dimetconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dimetomorf, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dimetirimol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dimoxistrobina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + diniconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dinocap, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ditianon, COMPUESTO DE FÓRMULA I + cloruro de dodecil dimetil amonio, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dodemorf, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dodina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + doguadina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + edifenfos, COMPUESTO DE FÓRMULA I + epoxiconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + etirimol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + etil(*Z*)–*N*–bencil–*N*([metil(metil–tioetilidenaminooxicarbonil)amino]tio)–β–alaninato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + etridiazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + famoxadona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenamidona (RPA407213), COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenarimol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenbuconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenfuram, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenhexamida (KBR2738), COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenoxanil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenpiclonil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenpropidina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenpropimorf, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fenpirazamina/ipfenpirazolona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + acetato de fentina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + hidróxido de fentina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ferbam, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ferimzona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fluazinam, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fludioxonil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + flumetover, COMPUESTO DE FÓRMULA I + flumorf, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fluopicolida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fluopiram, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fluoxastrobina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fluorimida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fluquinconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + flusilazol, COMPUESTO DE

FÓRMULA I + flutianil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + flutolanil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + flutriafol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fluxapiroxad, COMPUESTO DE FÓRMULA I + folpet, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fuberidazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + furalaxil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + furametpir, COMPUESTO DE FÓRMULA I + guazatina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + hexaconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + hidroxiisoxazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + himexazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + imazalil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + imibenconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + iminoctadina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triacetato de iminoctadina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ipconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + iprobenfos, COMPUESTO DE FÓRMULA I + iprodiona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + iprovalicarb (SZX0722), COMPUESTO DE FÓRMULA I + isopropanil butil carbamato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + isoprotiolano, COMPUESTO DE FÓRMULA I + isopirazam, COMPUESTO DE FÓRMULA I + isotianil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + kasugamicina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + kresoxim–metilo, COMPUESTO DE FÓRMULA I + LY186054, COMPUESTO DE FÓRMULA I + LY211795, COMPUESTO DE FÓRMULA I + LY248908, COMPUESTO DE FÓRMULA I + mancozeb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + mandipropamida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + maneb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + mefenoxam, COMPUESTO DE FÓRMULA I + mepanipirim, COMPUESTO DE FÓRMULA I + mepronil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + meptildinocap, COMPUESTO DE FÓRMULA I + metalaxil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + metconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + metiram, COMPUESTO DE FÓRMULA I + metiram–zinc, COMPUESTO DE FÓRMULA I + metominostrobina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + metrafenona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + miclobutanil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + neoasozina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + dimetilditiocarbamato de níquel, COMPUESTO DE FÓRMULA I + nicobifen, COMPUESTO DE FÓRMULA I + nitrotal–*iso*propilo, COMPUESTO DE FÓRMULA I + nuarimol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ofurace, COMPUESTO DE FÓRMULA I + compuestos de organomercurio, COMPUESTO DE FÓRMULA I + orisastrobina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + oxadixil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + oxasulfuron, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ácido oxolínico,

COMPUESTO DE FÓRMULA I + oxpoconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + oxicarboxina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + pefurazoato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + penconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + pencicuron, COMPUESTO DE FÓRMULA I + pentiopirad, COMPUESTO DE FÓRMULA I + óxido de fenazina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + fosetil–Al, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ácido fosforoso, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ftalida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + picoxistrobina (ZA1963), COMPUESTO DE FÓRMULA I + polioxina D, COMPUESTO DE FÓRMULA I + poliram, COMPUESTO DE FÓRMULA I + probenazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + procloraz, COMPUESTO DE FÓRMULA I + procimidona, COMPUESTO DE FÓRMULA I + propamocarb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + propiconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + propineb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + ácido propiónico, COMPUESTO DE FÓRMULA I + proquinazid, COMPUESTO DE FÓRMULA I + protioconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + piraclostrobina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + pirazofos, COMPUESTO DE FÓRMULA I + piribencarb, COMPUESTO DE FÓRMULA I + pirifenox, COMPUESTO DE FÓRMULA I + pirimetanil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + piroquilon, COMPUESTO DE FÓRMULA I + piroxifur, COMPUESTO DE FÓRMULA I + pirrolnitrina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + compuestos de amonio cuaternario, COMPUESTO DE FÓRMULA I + quinometionato, COMPUESTO DE FÓRMULA I + quinoxifen, COMPUESTO DE FÓRMULA I + quintoceno, COMPUESTO DE FÓRMULA I + sedaxane, COMPUESTO DE FÓRMULA I + sipconazol (F–155), COMPUESTO DE FÓRMULA I + pentaclorofenato de sodio, COMPUESTO DE FÓRMULA I + espiroxamina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + estreptomicina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + azufre, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tebuconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tecloftalam, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tecnaceno, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tetraconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tiabendazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tifluzamida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + 2–(tiocianometiltio)benzotiazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tiofanato–metilo, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tiram, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tiadinil, COMPUESTO DE FÓRMULA I + timibenconazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tolclofos–metilo, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tolilfluanida, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triadimefon,

COMPUESTO DE FÓRMULA I + triadimenol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triazbutilo, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triazóxido, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triciclazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + tridemorf, COMPUESTO DE FÓRMULA I + trifloxistrobina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triforina, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triflumizol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + triticonazol, COMPUESTO DE FÓRMULA I + validamicina A, COMPUESTO DE FÓRMULA I + valifenal, COMPUESTO DE FÓRMULA I + vapam, COMPUESTO DE FÓRMULA I + vinclozolin, COMPUESTO DE FÓRMULA I + zineb y COMPUESTO DE FÓRMULA I + ziram.

Los compuestos de fórmula I pueden mezclarse con tierra, turba u otro medio de enraizamiento para la protección de plantas contra enfermedades fúngicas portadas en la semilla, en el suelo o en el follaje.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también pueden utilizarse en combinación con uno o más otros sinergistas. En particular, las siguientes mezclas del COMPUESTO DE FÓRMULA I, donde este término preferentemente se refiere a un compuesto seleccionado entre una de las Tablas 1 a 102, son importantes:

COMPUESTO DE FÓRMULA I + butóxido de piperonilo, COMPUESTO DE FÓRMULA I + sesamex, COMPUESTO DE FÓRMULA I + safroxan y COMPUESTO DE FÓRMULA I + dodecilimidazol.

Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención también pueden emplearse en combinación con uno o más otros herbicidas. En particular, las siguientes mezclas del compuesto de fórmula I, donde este término preferentemente se refiere a un compuesto seleccionado entre uno de las Tablas 1 a 102, son importantes:

compuesto de fórmula I + acetoclor, compuesto de fórmula I + acifluorfen, compuesto de fórmula I + acifluorfen–sódico, compuesto de fórmula I + aclonifen, compuesto de fórmula I + acroleína, compuesto de fórmula I + alaclor, compuesto de fórmula I + aloxidim, compuesto de fórmula I + alcohol de alilo, compuesto de fórmula I + ametrina, compuesto de fórmula I + amicarbazona, compuesto de fórmula I + amidosulfuron, compuesto de fórmula I + aminociclopiraclor, compuesto de fórmula I + aminopiralid, compuesto de fórmula I + amitrol, compuesto de fórmula I + sulfamato de amonio, compuesto de fórmula I + anilofos,

compuesto de fórmula I + asulam, compuesto de fórmula I + atraton, compuesto de fórmula I + atrazina, compuesto de fórmula I + azimsulfuron, compuesto de fórmula I + BCPC, compuesto de fórmula I + beflubutamida, compuesto de fórmula I + benazolina, compuesto de fórmula I + bencarbazona, compuesto de fórmula I + benfluralina, compuesto de fórmula I + benfuresato, compuesto de fórmula I + bensulfuron, compuesto de fórmula I + bensulfuron–metilo, compuesto de fórmula I + bensulide, compuesto de fórmula I + bentazona, compuesto de fórmula I + benzfendizona, compuesto de fórmula I + benzobiciclon, compuesto de fórmula I + benzofenap, compuesto de la fórmula I + biciclopirona, compuesto de fórmula I + bifenox, compuesto de fórmula I + bilanafos, compuesto de fórmula I + bispiribac, compuesto de fórmula I + bispiribac–sódico, compuesto de fórmula I + borax, compuesto de fórmula I + bromacil, compuesto de fórmula I + bromobutida, compuesto de fórmula I + bromoxinil, compuesto de fórmula I + butaclor, compuesto de fórmula I + butafenacil, compuesto de fórmula I + butamifos, compuesto de fórmula I + butralina, compuesto de fórmula I + butroxidim, compuesto de fórmula I + butilato, compuesto de fórmula I + ácido cacodílico, compuesto de fórmula I + clorato de calcio, compuesto de fórmula I + cafenstrol, compuesto de fórmula I + carbetamida, compuesto de fórmula I + carfentrazona, compuesto de fórmula I + carfentrazona–etilo, compuesto de fórmula I + CDEA, compuesto de fórmula I + CEPC, compuesto de fórmula I + clorflurenol, compuesto de fórmula I + clorflurenol–metilo, compuesto de fórmula I + cloridazon, compuesto de fórmula I + clorimuron, compuesto de fórmula I + clorimuron–etilo, compuesto de fórmula I + ácido cloroacético, compuesto de fórmula I + clorotoluron, compuesto de fórmula I + clorprofam, compuesto de fórmula I + clorsulfuron, compuesto de fórmula I + clortal, compuesto de fórmula I + clortal–dimetilo, compuesto de fórmula I + cinidon–etilo, compuesto de fórmula I + cinmetilina, compuesto de fórmula I + cinosulfuron, compuesto de fórmula I + cisanilida, compuesto de fórmula I + cletodim, compuesto de fórmula I + clodinafop, compuesto de fórmula I + clodinafop–propargilo, compuesto de fórmula I + clomazona, compuesto de fórmula I + clomeprop, compuesto de fórmula I + clopiralid, compuesto de fórmula I + cloransulam, compuesto de fórmula I + cloransulam–metilo, compuesto de fórmula I + CMA, compuesto de fórmula I + 4–CPB, compuesto de fórmula I + CPMF, compuesto de fórmula I + 4–CPP,

compuesto de fórmula I + CPPC, compuesto de fórmula I + cresol, compuesto de fórmula I + cumiluron, compuesto de fórmula I + cianamida, compuesto de fórmula I + cianazina, compuesto de fórmula I + cicloato, compuesto de fórmula I + ciclosulfamuron, compuesto de fórmula I + cicloxidim, compuesto de fórmula I + cihalofop, compuesto de fórmula I + cihalofop–butilo, compuesto de fórmula I + 2,4–D, compuesto de fórmula I + 3,4–DA, compuesto de fórmula I + daimuron, compuesto de fórmula I + dalapon, compuesto de fórmula I + dazomet, compuesto de fórmula I + 2,4–DB, compuesto de fórmula I + 3,4–DB, compuesto de fórmula I + 2,4–DEB, compuesto de fórmula I + desmedifam, compuesto de fórmula I + dicamba, compuesto de fórmula I + diclobenil, compuesto de fórmula I + orto–diclorobenceno, compuesto de fórmula I + para–diclorobenceno, compuesto de fórmula I + diclorprop, compuesto de fórmula I + diclorprop–P, compuesto de fórmula I + diclofop, compuesto de fórmula I + diclofop–metilo, compuesto de fórmula I + diclosulam, compuesto de fórmula I + difenzoquat, compuesto de fórmula I + metilsulfato de difenzoquat, compuesto de fórmula I + diflufenican, compuesto de fórmula I + diflufenzopir, compuesto de fórmula I + dimefuron, compuesto de fórmula I + dimepiperato, compuesto de fórmula I + dimetaclor, compuesto de fórmula I + dimetametrina, compuesto de fórmula I + dimetenamida, compuesto de fórmula I + dimetenamida–P, compuesto de fórmula I + dimetipin, compuesto de fórmula I + ácido dimetilarsínico, compuesto de fórmula I + dinitramina, compuesto de fórmula I + dinoterb, compuesto de fórmula I + difenamida, compuesto de fórmula I + diquat, compuesto de fórmula I + dibromuro de diquat, compuesto de fórmula I + ditiopir, compuesto de fórmula I + diuron, compuesto de fórmula I + DNOC, compuesto de fórmula I + 3,4–DP, compuesto de fórmula I + DSMA, compuesto de fórmula I + EBEP, compuesto de fórmula I + endotal, compuesto de fórmula I + EPTC, compuesto de fórmula I + esprocarb, compuesto de fórmula I + etalfluralina, compuesto de fórmula I + etametsulfuron, compuesto de fórmula I + etametsulfuron–metilo, compuesto de fórmula I + etofumesato, compuesto de fórmula I + etoxifen, compuesto de fórmula I + etoxisulfuron, compuesto de fórmula I + etobenzanida, compuesto de fórmula I + fenoxaprop–P, compuesto de fórmula I + fenoxaprop–P–etilo, compuesto de fórmula I + fentrazamida, compuesto de fórmula I + sulfato ferroso, compuesto de fórmula I + flamprop–M, compuesto de fórmula I + flazasulfuron, compuesto de

fórmula I + florasulam, compuesto de fórmula I + fluazifop, compuesto de fórmula I + fluazifop–butilo, compuesto de fórmula I + fluazifop–P, compuesto de fórmula I + fluazifop–P–butilo, compuesto de fórmula I + flucarbazona, compuesto de fórmula I + flucarbazona sódica, compuesto de fórmula I + flucetosulfuron, compuesto de fórmula I + flucloralina, compuesto de fórmula I + flufenacet, compuesto de fórmula I + flufenpir, compuesto de fórmula I + flufenpir–etilo, compuesto de fórmula I + flumetsulam, compuesto de fórmula I + flumiclorac, compuesto de fórmula I + flumiclorac–pentilo, compuesto de fórmula I + flumioxazina, compuesto de fórmula I + fluometuron, compuesto de fórmula I + fluorglicofen, compuesto de fórmula I + fluorglicofen–etilo, compuesto de fórmula I + flupropanato, compuesto de fórmula I + flupirsulfuron, compuesto de fórmula I + flupirsulfuron–metil–sódico, compuesto de fórmula I + flurenol, compuesto de fórmula I + fluridona, compuesto de fórmula I + flurocloridona, compuesto de fórmula I + fluroxipir, compuesto de fórmula I + flurtamona, compuesto de fórmula I + flutiacet, compuesto de fórmula I + flutiacet–metilo, compuesto de fórmula I + fomesafen, compuesto de fórmula I + foramsulfuron, compuesto de fórmula I + fosamina, compuesto de fórmula I + glufosinato, compuesto de fórmula I + glufosinato sódico, compuesto de fórmula I + glufosinato–P, compuesto de fórmula I + glifosato, compuesto de fórmula I + glifosato–trimésico, compuesto de fórmula I + halosulfuron, compuesto de fórmula I + halosulfuron–metilo, compuesto de fórmula I + haloxifop, compuesto de fórmula I + haloxifop–P, compuesto de fórmula I + HC–252, compuesto de fórmula I + hexazinona, compuesto de fórmula I + imazametabenz, compuesto de fórmula I + imazametabenz–metilo, compuesto de fórmula I + imazamox, compuesto de fórmula I + imazapic, compuesto de fórmula I + imazapir, compuesto de fórmula I + imazaquin, compuesto de fórmula I + imazetapir, compuesto de fórmula I + imazosulfuron, compuesto de fórmula I + indanofan, compuesto de fórmula I + indaziflam, compuesto de fórmula I + yodometano, compuesto de fórmula I + yodosulfuron, compuesto de fórmula I + yodosulfuron–metil–sódico, compuesto de fórmula I + ioxinil, compuesto de fórmula I + ipfencarbazona, compuesto de fórmula I + isoproturon, compuesto de fórmula I + isouron, compuesto de fórmula I + isoxaben, compuesto de fórmula I + isoxaclortol, compuesto de fórmula I + isoxaflutol, compuesto de fórmula I + karbutilato, compuesto de fórmula I + lactofen, compuesto de fórmula I + lenacil, compuesto de fórmula I + linuron,

compuesto de fórmula I + MAA, compuesto de fórmula I + MAMA, compuesto de fórmula I + MCPA, compuesto de fórmula I + MCPA–tioetilo, compuesto de fórmula I + MCPB, compuesto de fórmula I + mecoprop, compuesto de fórmula I + mecoprop–P, compuesto de fórmula I + mefenacet, compuesto de fórmula I + mefluidide, compuesto de fórmula I + mesosulfuron, compuesto de fórmula I + mesosulfuron–metilo, compuesto de fórmula I + mesotriona, compuesto de fórmula I + metam, compuesto de fórmula I + metamifop, compuesto de fórmula I + metamitron, compuesto de fórmula I + metazaclor, compuesto de fórmula I + metabenztiazuron, compuesto de fórmula I + ácido metilarsónico, compuesto de fórmula I + metildimron, compuesto de fórmula I + metil isotiocianato, compuesto de fórmula I + metobenzuron, compuesto de fórmula I + metolaclor, compuesto de fórmula I + S–metolaclor, compuesto de fórmula I + metosulam, compuesto de fórmula I + metoxuron, compuesto de fórmula I + metribuzin, compuesto de fórmula I + metsulfuron, compuesto de fórmula I + metsulfuron–metilo, compuesto de fórmula I + MK–616, compuesto de fórmula I + molinato, compuesto de fórmula I + monolinuron, compuesto de fórmula I + MSMA, compuesto de fórmula I + naproanilida, compuesto de fórmula I + napropamida, compuesto de fórmula I + naptalam, compuesto de fórmula I + neburon, compuesto de fórmula I + nicosulfuron, compuesto de fórmula I + ácido nonanoico, compuesto de fórmula I + norflurazon, compuesto de fórmula I + ácido oleico (ácidos grasos), compuesto de fórmula I + orbencarb, compuesto de fórmula I + ortosulfamuron, compuesto de fórmula I + orizalin, compuesto de fórmula I + oxadiargil, compuesto de fórmula I + oxadiazon, compuesto de fórmula I + oxasulfuron, compuesto de fórmula I + oxaziclomefona, compuesto de fórmula I + oxifluorfen, compuesto de fórmula I + paraquat, compuesto de fórmula I + dicloruro de paraquat, compuesto de fórmula I + pebulato, compuesto de fórmula I + pendimetalin, compuesto de fórmula I + penoxsulam, compuesto de fórmula I + pentaclorofenol, compuesto de fórmula I + pentanoclor, compuesto de fórmula I + pentoxazona, compuesto de fórmula I + petoxamida, compuesto de fórmula I + aceites de petróleo, compuesto de fórmula I + fenmedifam, compuesto de fórmula I + fenmedifam–etilo, compuesto de fórmula I + picloram, compuesto de fórmula I + picolinafen, compuesto de fórmula I + pinoxaden, compuesto de fórmula I + piperofos, compuesto de fórmula I + arsenita de potasio, compuesto de fórmula I + azida de potasio, compuesto de fórmula I +

pretilaclor, compuesto de fórmula I + primisulfuron, compuesto de fórmula I + primisulfuron–metilo, compuesto de fórmula I + prodiamina, compuesto de fórmula I + profluazol, compuesto de fórmula I + profoxidim, compuesto de fórmula I + prometon, compuesto de fórmula I + prometrina, compuesto de fórmula I + propaclor, compuesto de fórmula I + propanil, compuesto de fórmula I + propaquizafop, compuesto de fórmula I + propazina, compuesto de fórmula I + profam, compuesto de fórmula I + propisoclor, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona, compuesto de fórmula I + propoxicarbazona sódica, compuesto de fórmula I + propirisulfuron, compuesto de fórmula I + propizamida, compuesto de fórmula I + prosulfocarb, compuesto de fórmula I + prosulfuron, compuesto de fórmula I + piraclonil, compuesto de fórmula I + piraflufen, compuesto de fórmula I + piraflufen–etilo, compuesto de la fórmula I + pirasulfotol, compuesto de fórmula I + pirazolinato, compuesto de fórmula I + pirazosulfuron, compuesto de fórmula I + pirazosulfuron–etilo, compuesto de fórmula I + pirazoxifen, compuesto de fórmula I + piribenzoxim, compuesto de fórmula I + piributicarb, compuesto de fórmula I + piridafol, compuesto de fórmula I + piridato, compuesto de fórmula I + puriftalida, compuesto de fórmula I + piriminobac, compuesto de fórmula I + piriminobac–metilo, compuesto de fórmula I + pirimisulfan, compuesto de fórmula I + piritiobac, compuesto de fórmula I + piritiobac sódico, compuesto de fórmula I + piroxsulam, compuesto de fórmula I + piroxasulfona, compuesto de fórmula I + quinclorac, compuesto de fórmula I + quinmerac, compuesto de fórmula I + quinoclamina, compuesto de fórmula I + quizalofop, compuesto de fórmula I + quizalofop–P, compuesto de fórmula I + rimsulfuron, compuesto de fórmula I + saflufenacil, compuesto de fórmula I + setoxidim, compuesto de fórmula I + siduron, compuesto de fórmula I + simazina, compuesto de fórmula I + simetrina, compuesto de fórmula I + SMA, compuesto de fórmula I + arsenita sódica, compuesto de fórmula I + azida de sodio, compuesto de fórmula I + clorato sódico, compuesto de fórmula I + sulcotriona, compuesto de fórmula I + sulfentrazona, compuesto de fórmula I + sulfometuron, compuesto de fórmula I + sulfometuron–metilo, compuesto de fórmula I + sulfosato, compuesto de fórmula I + sulfosulfuron, compuesto de fórmula I + ácido sulfúrico, compuesto de fórmula I + aceites de alquitrán, compuesto de fórmula I + 2,3,6–TBA, compuesto de fórmula I + TCA, compuesto de fórmula I + TCA–sodio, compuesto de fórmula I + tebutiuron, compuesto de

fórmula I + tefuriltriona, compuesto de fórmula I + tembotriona, compuesto de fórmula I + tepraloxidim, compuesto de fórmula I + terbacil, compuesto de fórmula I + terbumeton, compuesto de fórmula I + terbutilazina, compuesto de fórmula I + terbutrina, compuesto de fórmula I + tenilclor, compuesto de fórmula I + tiazopir, compuesto de fórmula I + tiencarbazona, compuesto de fórmula I + tifensulfuron, compuesto de fórmula I + tifensulfuron-metilo, compuesto de fórmula I + tiobencarb, compuesto de fórmula I + tiocarbazil, compuesto de fórmula I + topramezona, compuesto de fórmula I + tralcoxidim, compuesto de fórmula I + tri-alato, compuesto de fórmula I + triasulfuron, compuesto de fórmula I + triaziflam, compuesto de fórmula I + tribenuron, compuesto de fórmula I + tribenuron-metilo, compuesto de fórmula I + tricamba, compuesto de fórmula I + triclopir, compuesto de fórmula I + trietazina, compuesto de fórmula I + trifloxisulfuron, compuesto de fórmula I + trifloxisulfuron sódico, compuesto de fórmula I + trifluralina, compuesto de fórmula I + triflusulfuron, compuesto de fórmula I + triflusulfuron-metilo, compuesto de fórmula I + trihidroxitriazina, compuesto de fórmula I + tritosulfuron, compuesto de fórmula I + éster etílico del ácido [3-[2-cloro-4-fluor-5-(1-metil-6-trifluormetil-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahidropirimidin-3-il)fenoxi]-2-piridiloxi]acético (CAS RN 353292-31-6), compuesto de fórmula I + ácido 4-[(4,5-dihidro-3-metoxi-4-metil-5-oxo)-1H-1,2,4-triazol-1-ilcarbonilsulfamoil]-5-metiltiofen-3-carboxílico (BAY636), compuesto de fórmula I + BAY747 (CAS RN 335104-84-2), compuesto de fórmula I + topramezona (CAS RN 210631-68-8), compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-[(2-metoxietoxi)metil]-6-(trifluormetil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona (CAS RN 352010-68-5), y compuesto de fórmula I + 4-hidroxi-3-[[2-(3-metoxipropil)-6-(difluormetil)-3-piridinil]carbonil]-biciclo[3.2.1]oct-3-en-2-ona.

Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención también pueden emplearse en combinación con antídotos (safeners). Preferentemente, en estas mezclas, el compuesto de la fórmula (I) es uno de esos compuestos enlistados en las Tablas 1 a 102 antes mencionadas. Las siguientes mezclas con antídotos, especialmente, entran en consideración:

compuesto de fórmula (I) + cloquintocet-mexil, compuesto de fórmula (I) + ácido cloquintocet y las sales del mismo, compuesto de fórmula (I) + fenclorazol-etilo, compuesto de fórmula (I) + ácido fenclorazol y las sales del mismo,

compuesto de fórmula (I) + mefenpir–dietilo, compuesto de fórmula (I) + mefenpir diácido, compuesto de fórmula (I) + isoxadifen–etilo, compuesto de fórmula (I) + ácido isoxadifen, compuesto de fórmula (I) + furilazol, compuesto de fórmula (I) + isómero R de furilazol, compuesto de fórmula (I) + benoxacor, compuesto de fórmula (I) + diclormid, compuesto de fórmula (I) + AD–67, compuesto de fórmula (I) + oxabetrinil, compuesto de fórmula (I) + ciometrinil, compuesto de fórmula (I) + isómero Z de ciometrinil, compuesto de fórmula (I) + fenclorim, compuesto de fórmula (I) + ciprosulfamida, compuesto de fórmula (I) + anhídrido naftálico, compuesto de fórmula (I) + flurazol, compuesto de fórmula (I) + N–(2–metoxibenzoil)–4–[(metilaminocarbonil)amino]bencensulfonamida, compuesto de fórmula (I) + CL 304,415, compuesto de fórmula (I) + diciclonon, compuesto de fórmula (I) + fluxofenim, compuesto de fórmula (I) + DKA–24, compuesto de fórmula (I) + R–29148 y compuesto de fórmula (I) + PPG–1292. Un efecto protector también puede observarse para las mezclas de compuesto de la fórmula (I) + dimron, compuesto de la fórmula (I) + MCPA, compuesto de la fórmula (I) + mecoprop y compuesto de la fórmula (I) + mecoprop–P.

Los socios del mezclado del compuesto de fórmula I también pueden estar en la forma de ésteres o sales, según lo mencionado, por ej. en The Pesticide Manual, décimosegunda Edición (BCPC), 2000.

En las diferentes listas que aparecieron anteriormente de ingredientes activos a ser mezclados con un COMPUESTO DE FÓRMULA I, el compuesto de la fórmula I es preferentemente un compuesto de las Tablas 1 a 102; y más preferentemente, un compuesto seleccionado entre T2.011, T2.016, T2.023, T2.026, T2.030, T2.042, T2.047, T2.049, T2.050, T2.066, T2.067, T2.068, T2.069, T2.070, T2.071, T2.072, T2.104, T2.116, T2.117, T2.118, T2.120, T2.121, T2.125, T2.130, T2.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T3.011, T3.016, T3.023, T3.026, T3.030, T3.042, T3.047, T3.049, T3.050, T3.066, T3.067, T3.068, T3.069, T3.070, T3.071, T3.072, T3.104, T3.116, T3.117, T3.118, T3.120, T3.121, T3.125, T3.130, T3.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T13.011, T13.016, T13.023, T13.026, T13.030, T13.042, T13.047, T13.049, T13.050, T13.066, T13.067, T13.068, T13.069, T13.070, T13.071, T13.072, T13.104, T13.116, T13.117, T13.118, T13.120, T13.121, T13.125, T13.130,

T13.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T20.011, T20.016, T20.023, T20.026, T20.030, T20.042, T20.047, T20.049, T20.050, T20.066, T20.067, T20.068, T20.069, T20.070, T20.071, T20.072, T20.104, T20.116, T20.117, T20.118, T20.120, T20.121, T20.125, T20.130, T20.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T22.011, T22.016, T22.023, T22.026, T22.030, T22.042, T22.047, T22.049, T22.050, T22.066, T22.067, T22.068, T22.069, T22.070, T22.071, T22.072, T22.104, T22.116, T22.117, T22.118, T22.120, T22.121, T22.125, T22.130, T22.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T25.011, T25.016, T25.023, T25.026, T25.030, T25,042, T25.047, T25.049, T25.050, T25.066, T25.067, T25.068, T25.069, T25.070, T25.071, T25.072, T25.104, T25.116, T25.117, T25.118, T25.120, T25.121, T25.125, T25.130, T25.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T27.011, T27.016, T27.023, T27.026, T27.030, T27.042, T27.047, T27.049, T27.050, T27.066, T27.067, T27.068, T27.069, T27.070, T27.071, T27.072, T27.104, T27.116, T27.117, T27.118, T27,120, T27.121, T27.125, T27.130, T27.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T70.011, T70.016, T70.023, T70.026, T70.030, T70.042, T70.047, T70.049, T70.050, T70.066, T70.067, T70.068, T70.069, T70.070, T70.071, T70.072, T70.104, T70.116, T70.117, T70.118, T70.120, T70.121, T70.125, T70.130, T70.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T71.011, T71.016, T71.023, T71.026, T71.030, T71.042, T71.047, T71.049, T71.050, T71.066, T71.067, T71.068, T71.069, T71.070, T71.071, T71.072, T71.104, T71.116, T71.117, T71.118, T71.120, T71.121, T71.125, T71.130, T71.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T74.011, T74.016, T74.023, T74.026, T74.030, T74.042, T74.047, T74.049, T74.050, T74.066, T74.067, T74.068, T74.069, T74.070, T74.071, T74.072, T74.104, T74.116, T74.117, T74.118, T74.120, T74.121, T74.125, T74.130, T74.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T95.011, T95.016, T95.023, T95.026, T95.030, T95.042, T95.047, T95.049, T95.050, T95.066, T95.067, T95.068, T95.069, T95.070, T95.071, T95.072,

T95.104, T95.116, T95.117, T95.118, T95.120, T95.121, T95.125, T95.130, T95.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr; o un compuesto seleccionado entre T96.011, T96.016, T96.023, T96.026, T96.030, T96.042, T96.047, T96.049, T96.050, T96.066, T96.067, T96.068, T96.069, T96.070, T96.071, T96.072, T96.104, T96.116, T96.117, T96.118, T96.120, T96.121, T96.125, T96.130, T96.131, por lo cual G puede ser hidrógeno, C(O)OEt o C(O)OiPr;

y aun más preferentemente, un compuesto de las Tablas P1 a P2.

En las mezclas antes mencionadas de los compuestos de fórmula I, en particular un compuesto seleccionado entre dichas Tablas 1 a 102, con otros insecticidas, fungicidas, herbicidas, antídotos, adyuvantes y similares, las relaciones de mezclado pueden variar en un amplio rango y son, preferentemente

100:1 a 1:6000; especialmente 50:1 a 1:50, más especialmente 20:1 a 1:20, aun más especialmente 10:1 a 1:10. Dichas relaciones de mezcla se entiende que incluyen, por un lado, relaciones en peso y también, por otro lado, relaciones molares.

Las mezclas pueden emplearse, ventajosamente, en las formulaciones antes mencionadas (en cuyo caso "ingrediente activo" se refiere a la mezcla respectiva de compuesto de fórmula I con el socio del mezclado).

Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos los cuales tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes de modo que no se prestan fácilmente al mismo tipo de formulación convencional. En estos casos, pueden prepararse otros tipos de formulación. Por ejemplo, donde un ingrediente activo es un sólido insoluble en agua y el otro un líquido insoluble en agua, no obstante puede ser posible dispersar cada ingrediente activo en la misma fase acuosa continua dispersando el ingrediente activo sólido como una suspensión (utilizando una preparación análoga a aquella de un SC (concentrado en suspensión)) pero dispersando el ingrediente activo líquido como una emulsión (utilizando una preparación análoga a aquella de una EW (emulsión aceite en agua). La composición resultante es una formulación en suspoemulsión (SE).

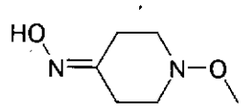
Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I seleccionado de las Tablas 1 a 102 y uno o más ingredientes activos según lo descrito anteriormente pueden aplicarse, por ejemplo, en una forma simple de "mezcla

lista", en una mezcla de fumigación combinada compuesta por formulaciones separadas de los componentes de ingrediente activo único, tal como una "mezcla en tanque", y en un uso combinado de los ingredientes activos únicos cuando se aplican en forma consecutiva, es decir, uno después del otro con un período razonablemente corto, tal como de una pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de fórmula I seleccionados de las Tablas 1 a 102 y los ingredientes activos según lo descrito anteriormente no es esencial para la elaboración de la presente invención.

La invención es ilustrada mediante los siguientes ejemplos de preparación. Los datos de H RMN de ciertos compuestos de esta invención muestran una ampliación de línea a temperatura ambiente, lo cual sugiere la existencia de isómeros conformacionales plurales debido a, por ejemplo tautomerismo ceto–enólico, rotación impedida, inversión de anillo en la porción piperidina o inversión de nitrógeno en el centro N–OR de piperidina. Las señales amplias han sido marcadas con 'br' (de la palabra en inglés "broad") concordantemente.

EJEMPLO 1: Preparación de éster etílico de 3–(2,5–dimetil–fenil)–8–metoxi–1–metoxi–metoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del ácido carbónico (compuesto P1.2)

Paso 1: Preparación de la oxima de 1–metoxi–piperidin–4–ona



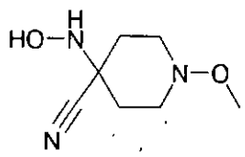
A una solución de 1–metoxi–piperidin–4–ona [preparada de acuerdo con Journal of Organic Chemistry (1961), 26, 1867–74] (258 g, 2,0 mol) y trietilamina (305,2 ml, 221,9 g, 4,4 mol) en metanol (3000 ml) se agregó clorhidrato de hidroxilamina (277,6 g, 4,0 mol), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 1,5 horas. El solvente se evaporó, el residuo se diluyó con éter dietílico y la suspensión se filtró. El líquido filtrado se lavó con agua y salmuera, se secó sobre sulfato sódico y se concentró. Rendimiento: 286,25 g de la oxima de 1–

metoxi–piperidin–4–ona en forma de un aceite viscoso, incoloro. Este material se utilizó sin más purificación en el siguiente paso.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 2,2–3,45 (señales br, total 8H), 3,55 (s, 3H), 8,65 (br s, 1H).

LC/MS (ES+): 145 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo (compuesto P4.1)

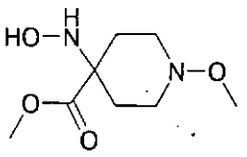


A una suspensión de la oxima de 1–metoxi–piperidin–4–ona (240 g, 1,66 mol) y dihidrógeno fosfato de potasio (792,9 g, 5,83 mol) en agua (200 ml) a 0–5°C se agregó una solución de cianuro de potasio (195,1 g, 3,0 mol) en agua (200 ml) por goteo (cuidado). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche (frasco tapado), se trató con otra porción de dihidrógeno fosfato de potasio (79,3 g, 0,58 mol) y se agitó a temperatura ambiente durante otra noche. La mezcla se lavó con nitrógeno, el semisólido se descartó por filtración y se disolvió en acetato de etilo. La capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo, todas las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con agua y salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se trituró con éter dietílico frío, se filtró y se secó. Rendimiento: 230,8 g de 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo en forma de un sólido tostado, pf 130–131°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,55–2,35 (señales br, 4H total), 2,60–3,45 (señales br, 4H total), 3,52 (s, 3H), 5,19 (br s, 1H) , 5,42 (br s, 1H).

IR (CN): □ 2227,8 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 172 $(M+H)^+$

Paso 3: Preparación de éster metílico del ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto 4.3)

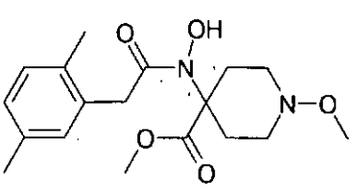


A una suspensión de 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo (230 g, 1,34 mol) en diclorometano (2400 ml) a temperatura ambiente se agregó ácido sulfúrico concentrado (358 ml, 658,8 g, 6,72 mol) por goteo, y la mezcla de reacción se agitó a 40°C durante una hora. Se agregó metanol (925,1 ml, 731,7 g, 22,8 mol) a 40°C por goteo, y la mezcla se agitó a 40°C durante 4 horas. El diclorometano se separó por destilación permitiendo el calentamiento de la mezcla de reacción a 60°C durante 24 horas. La mezcla de reacción se vertió sobre hielo (3kg) y neutralizó mediante la adición cuidadosa de hidróxido de sodio acuoso concentrado en primer lugar, seguido por hidrógeno carbonato sódico acuoso saturado. La fase acuosa se saturó con cloruro de sodio, se extrajo con *ter*–butil metil éter (10x 300 ml), las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron para proporcionar un primer cultivo de producto (163,8 g). La extracción adicional de la capa acuosa con acetato de etilo proporcionó otros 35 g de producto en bruto. Rendimiento: 198,8 g de éster metílico del ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico en forma de un aceite viscoso, de color marrón rojizo. Este material se empleó sin más purificación en el siguiente paso.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,50–2,40 (señales br, 4H total), 2,76 (br m, 2H), 3,01–3,32 (br m, 2H), 3,52 (s, 3H), 3,76 (s, 3H), 5,58 (br s, 2H).

IR (COOMe): □ 1731,3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 205 $(M+H)^+$

Paso 4: Preparación de éster metílico del ácido 4–{[2–(2,5–dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.1)



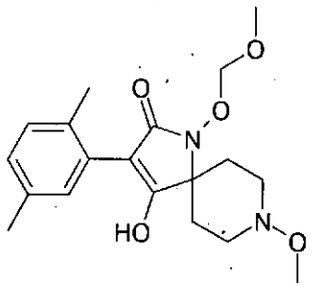
A una solución de éster metílico del ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (50 g, 244,8 mmol) en tetrahidrofurano (500 ml) a 0°C se agregó hidrógeno carbonato sódico (34,96 g, 416,2 mmol), seguido por una solución de cloruro de (2,5–dimetil–fenil)–acetilo [preparado mediante tratamiento ácido (2,5–dimetil–fenil)–acético con cloruro de oxalilo en diclorometano bajo condiciones estándares] (44,72g, 244,8 mmol) en tetrahidrofurano (500 ml) por goteo. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante una hora y a temperatura ambiente durante dos horas. El solvente se evaporó, el residuo se diluyó con agua y acetato de etilo y las capas se separaron. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (6x 250 ml), las capas orgánicas combinadas se lavaron con una solución acuosa de hidrógeno carbonato sódico y salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El producto en bruto se trituró con una solución fría de éter dietílico/ hexano 1:1, se filtró y se seçó para proporcionar 36,4 g en forma de un sólido blanco. El licor madre se concentró y purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:1) para proporcionar adicionalmente 4,2 g de producto. Rendimiento: 40,6 g de éster metílico del ácido 4–{[2–(2,5–dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.1), pf 137–139°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,99–3,32 (señales br, total 8H), 2,23 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 3,53 (s, 3H), 3,72 (s, 3H), 3,83 (s, 2H), 6,43 (br s, 1H), 6,98 (d, 1H), 6,99 (s, 1H), 7,06 (d, 1H).

LC/MS (ES+): 351 $(M+H)^+$

Paso 5: Preparación de 3–(2,5–dimetil–fenil)–4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.2)

[dos pasos (O–alquilación de ácido hidroxámico y ciclación), procedimiento de un recipiente]

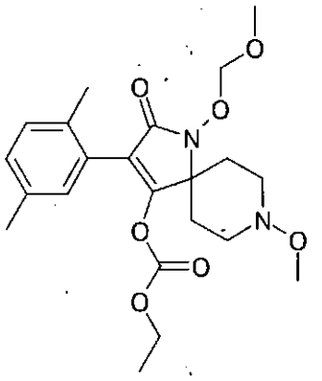


A una solución de éster metílico del ácido 4–{[2–(2,5–dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (35 g, 100,0 mmol) en dimetilformamida (300 ml) a 0°C se agregó hidruro sódico (5,02 g, 55% p/p dispersión en aceite mineral, 115,0 mmol) en 5 porciones. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 30 minutos, se trató con clorometil metil éter (8,96 ml, 9,5 g, 118,0 mmol) por goteo, y se agitó a 0°C durante una hora y a temperatura ambiente durante 1,5 horas. A la mezcla reenfriada a 0°C se le agregó metóxido sódico (8,1 g, 150 mmol) en una porción, y la agitación continuó a temperatura ambiente durante 2,5 horas. La mezcla de reacción se vertió sobre agua helada (500 ml), se acidificó hasta pH 5–6 con una solución de HCl acuosa y se extrajo vigorosamente con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El producto oleoso en bruto se trituró con una solución fría de éter dietílico /hexano 1:1, se filtró y se secó para proporcionar 15,8 g en forma de un sólido blanco. El licor madre se concentró y se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 2:1) para brindar adicionalmente 2,1 g de producto. Rendimiento: 17,9 g de 3–(2,5–dimetil–fenil)–4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.2), p.f. 136–138°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,44–2,72 (señales br, 4H total), 2,27 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,78–3,48 (señales br, 4H total), 3,59 (s, 3H), 3,64 (s, 3H), 4,41 (s, 1H), 5,12 (br m, 2H), 6,76 (s, 1H), 7,02 (d, 1H), 7,10 (d, 1H) (mezcla de tautómeros de ceto–enol, señales de isómero de forma diceto principales mostradas).

LC/MS (ES+): 363 $(M+H)^+$, LC/MS (ES–): 361 $(M–H)^-$

Paso 6: Preparación de éster etílico de 3–(2,5–dimetil–fenil)–8–metoxi–1–metoxi–metoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del ácido carbónico (compuesto del título P1.2)



A una solución de 3–(2,5–dimetil–fenil)–4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (9,0 g, 24,83 mmol), trietilamina (6,9 ml, 5,0 g, 49,66 mmol) y 4–dimetilaminopiridina (100 mg, 0,82 mmol) en tetrahidrofurano (250 ml) a 0°C se agregó una solución de cloroformiato de etilo (3,09 ml, 3,5 g, 32,28 mmol) en tetrahidrofurano (20 ml) por goteo. La suspensión se agitó a 0°C durante una hora, y a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla de reacción se evaporó, se diluyó con acetato de etilo y se filtró para eliminar las sales. El líquido filtrado se lavó con una solución acuosa saturada de hidrógeno carbonato sódico (2x 100 ml) y salmuera, se secó sobre sulfato sódico y se concentró. El residuo oleoso se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:1). Rendimiento: 9,63 g de éster etílico de 3–(2,5–dimetil–fenil)–8–metoxi–1–metoxi–metoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del ácido carbónico (compuesto del título P1.2) en forma de un sólido blanco, pf 109–111°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,06 (t, 3H), 1,75–2,05 (br m, 2H), 2,20 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,47 (br m, 2H), 2,89 (br m, 1H), 3,15–3,45 (br m, 3H), 3,59 (s, 3H), 3,64 (s, 3H), 3,99 (q, 2H), 5,07 (br s, 2H), 6,96 (s, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,09 (d, 1H).

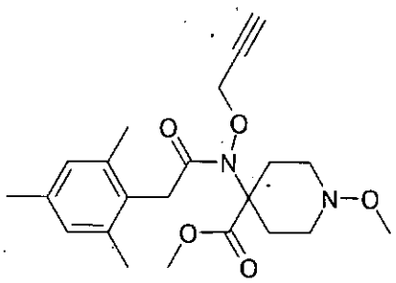
LC/MS (ES+): 435 $(M+H)^+$

EJEMPLO 2: Preparación de 4–Hidroxi–8–metoxi–1–prop–2–iniloxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.8)

(O–alquilación y ciclación de ácido hidroxámico en porciones)

000366

Paso 1: Preparación de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{prop–2–iniloxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.4)

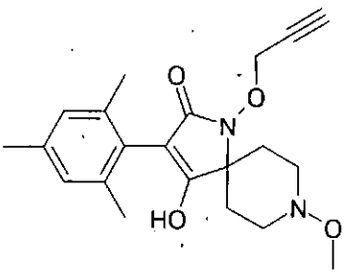


A una solución de éster metílico del ácido 4–{hidroxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.3 obtenido de manera análoga al ejemplo de preparación 1, paso 4) (500 mg, 1,37 mmol) en tetrahidrofurano (3 ml) a 0°C se agregó hidruro sódico (66 mg, 55% p/p dispersión en aceite mineral, 1,51 mmol) en 2 porciones. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante una hora, se trató con bromuro de propargilo (202 mg, 1,65 mmol) por goteo, y se agitó adicionalmente a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se evaporó, se diluyó con acetato de etilo y se filtró para eliminar las sales. El líquido filtrado se lavó dos veces con salmuera, se secó sobre sulfato sódico y se concentró. El residuo oleoso se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:2). Rendimiento: 321 mg de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{prop–2–iniloxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.4) en forma de una goma incolora.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,90–3,34 (señales br, total 8H), 2,21 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,68 (t, 1H), 3,53 (s, 3H), 3,68 (s, 3H), 3,77 (d, 1H), 4,03 (m, 1H), 4,65–4,89 (br m, 2H), 6,84 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 403 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 4–hidroxi–8–metoxi–1–prop–2–iniloxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto del título P2.8)



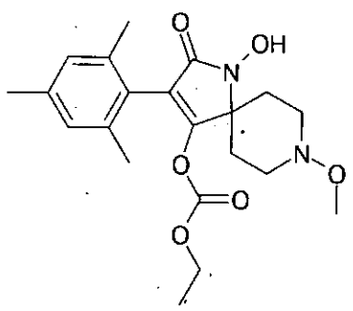
A una solución de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{prop–2–iniloxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (150 mg, 0,41 mmol) en dimetilformamida (2 ml) a 0°C se agregó metóxido sódico (33 mg, 0,62 mmol) en una porción y la agitación continuó a temperatura ambiente durante 4 horas. La mezcla de reacción se vertió sobre agua helada, se acidificó a pH 5–6 con una solución de HCl acuosa, se saturó con cloruro sódico y se extrajo vigorosamente con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 2:1). Rendimiento: 14 mg de 4–hidroxi–8–metoxi–1–prop–2–iniloxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto del título P2.8) en forma de un sólido tostado.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,97–2,08 (m, 2H), 2,10 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,23–2,32 (m, 2H), 3,04 (br s, 1H), 3,20 (m, 2H), 3,38 (m, 2H), 3,54 (s, 3H), 4,76 (br s, 2H), 6,89 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 371 $(M+H)^+$

EJEMPLO 3: Preparación de 8–metoxi–2–oxo–1–(tetrahidro–furan–2–iloxi)–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del éster etílico del ácido carbónico (compuesto P1.9)

Paso 1: Preparación de 1–hidroxi–8–metoxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto P1.11)

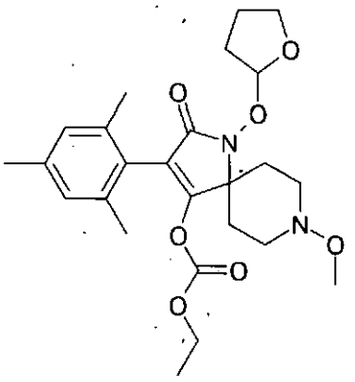


A una solución de 8–metoxi–1–metoximetoxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del éster etílico de ácido carbónico (compuesto P1.7 obtenido de manera análoga que en el ejemplo preparativo 1, paso 6) (1,0 g, 2,23 mmol) en bromotrimetilsilano (4,33 ml, 5,12 g, 33,44 mmol) bajo atmósfera de argón se agregó tamices moleculares 3Å (0,5 g) y la mezcla de reacción se agitó a 75°C durante toda la noche. La mezcla se diluyó con diclorometano, se filtró, el líquido filtrado se evaporó, el residuo se trituró con éter dietílico frío, se filtró y se secó. El producto en bruto se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (gradiente diclorometano → diclorometano/metanol 20:1 → 10:1). Rendimiento: 580 mg de 1–hidroxi–8–metoxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto P1.11) en forma de un sólido blanco, p.f. 154–155°C.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,03 (t, 3H), 2,03 (br m, 2H), 2,13 (s, 6H), 2,22 (br m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,94 (br m, 1H), 3,28 (br m, 2H), 3,44 (br m, 1H), 3,54 (s, 3H), 4,00 (q, 2H), 6,87 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 405 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 8–metoxi–2–oxo–1–(tetrahidro–furan–2–iloxi)–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto del título P1.9)

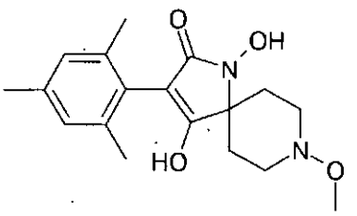


A una solución de 1–hidroxi–8–metoxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (150 mg, 0,37 mmol) en diclorometano (3 ml) bajo atmósfera de argón se agregó 2,3–dihidro–furano (56 □l, 52 mg, 0,74 mmol) y una cantidad catalítica de monohidrato del ácido p–toluensulfónico (2 mg). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas, se diluyó con diclorometano, se lavó dos veces con salmuera, se secó sobre sulfato sódico y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 2:1). Rendimiento: 114 mg de 8–metoxi–2–oxo–1–(tetrahidro–furan–2–iloxi)–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto del título P1.9) en forma de una goma incolora.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,02 (t, 3H), 1,70–2,22 (señales br, total 6H), 2,12 (s, 3H), 2,13 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 2,31–2,68 (br m, 2H), 2,86 (br m, 1H), 3,20 (br m, 1H), 3,39 (br m, 2H), 3,54 (s, 3H), 3,96 (m, 1H), 4,00 (q, 2H), 4,18 (q, 1H), 5,62 (br s, 1H), 6,88 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 475 $(M+H)^+$

EJEMPLO 4: Preparación de 1,4–Dihidroxi–8–metoxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.4)

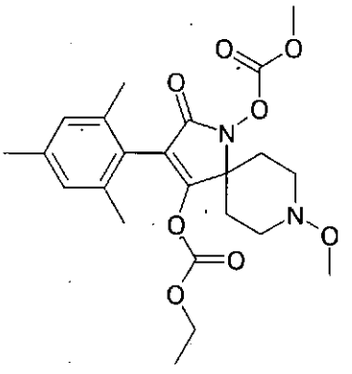


A una solución de 4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.6 obtenido de manera análoga al ejemplo de preparación 1, paso 5) (500 mg, 1,33 mmol) en diclorometano (10 ml) bajo atmósfera de argón a 0°C se agregó tamices moleculares 3Å (0,5 g), seguido por bromotrimetilsilano (1,72 ml, 2,03 g, 13,28 mmol) por goteo y la mezcla de reacción se agitó a 0°C durante una hora y a temperatura ambiente durante 48 horas. La mezcla se vertió sobre agua helada, la capa de agua se saturó con cloruro sódico y se extrajo vigorosamente con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo). Rendimiento: 40 mg de 1,4–dihidroxi–8–metoxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto del título P2.4) en forma de un sólido blanco, p.f. 152–154°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,82–2,58 (señales br, 4H total), 2,12 (s, 6H), 2,27 (s, 3H), 2,93–3,46 (señales br, 4H total), 3,57 (br s, 3H), 6,89 (s, 2H), 9,97 (br s, 1H).

LC/MS (ES+): 333 $(M+H)^+$

EJEMPLO 5: Preparación de 8–metoxi–1–metoxicarboniloxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto P1.13)



A una solución de 1–hidroxi–8–metoxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (ejemplo de preparación 3, paso 1; compuesto P1.11) (140 mg, 0,33 mmol), trietilamina (93

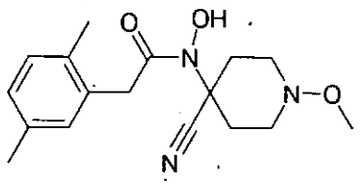
□l, 68 mg, 0,67 mmol) y 4–dimetilaminopiridina (2 mg) en tetrahidrofurano (3 ml) a 0°C se agregó una solución de cloroformiato de metilo (33 □l, 41 mg, 0,43 mmol) en tetrahidrofurano (2 ml) por goteo. La suspensión se agitó a 0°C durante una hora, y a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla de reacción se evaporó, se diluyó con acetato de etilo y se filtró para eliminar las sales. El líquido filtrado se lavó con una solución acuosa saturada de hidrógeno carbonato sódico (2x 15 ml) y salmuera, se secó sobre sulfato sódico y se concentró. El residuo oleoso se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:2). Rendimiento: 30 mg de 8–metoxi–1–metoxicarboniloxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto del título P1.13) en forma de una goma incolora.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,06 (t, 3H), 2,16 (s, 6H), 2,20 (m, 4H), 2,25 (s, 3H), 2,75–3,16 (br m, total 2H), 3,34 (br m, 2H), 3,55 (s, 3H), 3,96 (s, 3H), 3,99 (q, 2H), 6,85 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 463 $(M+H)^+$

EJEMPLO 6: Preparación alternativa de éster metílico del ácido 4–{[2–(2,5–Dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.1)

Paso 1: Preparación de N–(4–ciano–1–metoxi–piperidin–4–il)–2–(2,5–dimetil–fenil)–N–hidroxi–acetamida (compuesto P3.2)



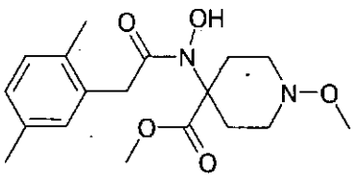
A una solución de 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo (ejemplo de preparación 1, paso 2) (4,0 g, 23,4 mmol) e hidrógeno carbonato sódico (3,0 g, 35,7 mmol) en acetato de etilo (35 ml) y agua (25 ml) a 0°C se agregó una solución de cloruro de (2,5–dimetil–fenil)–acetilo (4,2 g, 23,0 mmol) en acetato de etilo (35 ml) por goteo durante una hora. La mezcla de reacción se

agitó a 0°C durante una hora y a temperatura ambiente durante dos horas. Las capas del sistema bifásico se separaron, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (3x), las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo oleoso se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (gradiente acetato de etilo/hexano 1:2 → 1:1 → 2:1). Rendimiento: 1,55 g de N–(4–ciano–1–metoxi–piperidin–4–il)–2–(2,5–dimetil–fenil)–N–hidroxi–acetamida (compuesto P3.2) en forma de un sólido blanco, p.f. 153–156°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 2,11 (br m, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,56 (br m, 2H), 2,77 (br m, 1H), 3,10 (br m, 2H), 3,31 (br m, 1H), 3,50 (s, 3H), 3,77 (s, 2H), 6,83 (br s, 1H), 6,97 (s, 1H), 6,98 (d, 1H), 7,06 (d, 1H).

IR (CN): □ 2238,0 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 318 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de éster metílico del ácido 4–{[2–(2,5–dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto del título P3.1)



A una solución de N–(4–ciano–1–metoxi–piperidin–4–il)–2–(2,5–dimetil–fenil)–N–hidroxi–acetamida (1,5 g, 4,73 mmol) en metanol (15 ml) a 0°C se agregó ácido sulfúrico concentrado (1,26 ml, 2,3 g, 23,64 mmol) lentamente por goteo y la mezcla de reacción se agitó a reflujo durante 40 horas. La mezcla se vertió sobre hielo (50 g), se neutralizó cuidadosamente con una solución acuosa saturada de hidrógeno carbonato sódico y se extrajo con acetato de etilo (5x). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo oleoso se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 2:1) para proporcionar 136 mg de un sólido blancuzco. Este material se trituró con una solución de *terc*–butil metil éter/hexano 1:4 (2–3 ml), se filtró y se secó. Rendimiento: 82 mg de éster metílico del ácido 4–{[2–(2,5–

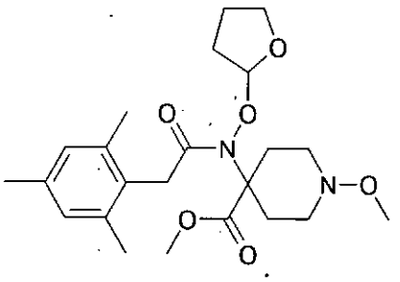
dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto del título P3.1) en forma de un sólido blanco, p.f. 140–142°C.

Los datos espectrales eran idénticos a aquellos descritos anteriormente bajo el ejemplo de preparación 1, paso 4.

EJEMPLO 7: Preparación de 4–Hidroxi–8–metoxi–1–(tetrahidro–furan–2–iloxi)–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.18)

(ciclación y O–tetrahidrofuranilación del ácido hidroxámico en etapas)

Paso 1: Preparación de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{(tetrahidro–furan–2–iloxi)–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.6)

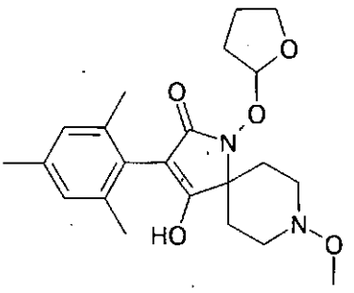


A una solución del éster metílico del ácido 4–{hidroxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.3 obtenido de manera análoga al ejemplo de preparación 1, paso 4) (70 g, 192,1 mmol) en diclorometano (1500 ml) bajo atmósfera de argón se agregó 2,3–dihidro–furano (29,1 ml, 26,9 g, 384,1 mmol) y una cantidad catalítica de monohidrato del ácido p–toluensulfónico (1,94 g, 19,2 mmol). La mezcla de reacción se agitó a reflujo durante 7 horas, se filtró y concentró. El residuo se trituró con hexano, se filtró y el sólido se secó *in vacuo*. Rendimiento: 70,0 g de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{(tetrahidro–furan–2–iloxi)–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.6) en forma de un sólido, p.f. 107–109°C. Este material se utilizó sin más purificación en el siguiente paso.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,79–2,36 (señales br, total 6H), 2,15 (br s, 6H), 2,21 (s, 3H), 2,42 (m, 1H), 2,65 (m, 1H), 2,80 (m, 1H), 3,10 (m, 1H), 3,26 (br m, 2H), 3,53 (s, 3H), 3,63 (s, 3H), 3,77 (m, 1H), 4,01 (m, 1H), 4,10 (m, 2H), 5,68 (br m, 1H), 6,80 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 435 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 4–hidroxi–8–metoxi–1–(tetrahidro–furan–2–iloxi)–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto del título P2.18)



A una solución de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{(tetrahidro–furan–2–iloxi)–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (70 g, 161,1 mmol) en dimetilformamida (350 ml) a 10°C se le agregó metóxido de sodio (26,9 g, 483,3 mmol) en cuatro porciones y la agitación continuó a 10°C durante 30 minutos, luego a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se vertió sobre cloruro de amonio acuoso saturado frío y se extrajo vigorosamente con acetato de etilo (6x 100 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico, se concentraron y se secaron *in vacuo*. El residuo se trituró con hexano, se filtró y el sólido se secó. Rendimiento: 51,0 g de 4–hidroxi–8–metoxi–1–(tetrahidro–furan–2–iloxi)–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto del título P2.18) en forma de un sólido tostado, p.f. 144–146°C.

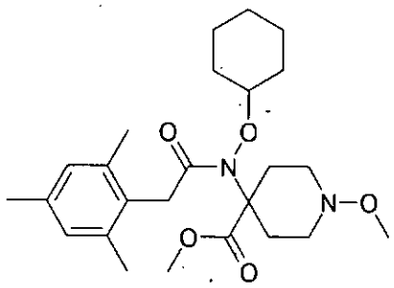
^{1}H RMN (CD_3OD): 1,75–2,19 (señales br, total 6H), 2,11 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,28–2,55 (m, 2H), 3,13–3,30 (m, 2H), 3,30–3,48 (m, 2H), 3,54 (s, 3H), 3,92 (m, 1H), 4,17 (m, 1H), 5,58 (m, 1H), 6,87 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 403 $(M+H)^+$

EJEMPLO 8: Preparación de 1–Ciclohexiloxi–4–hidroxi–8–metoxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.26)

(ciclación y O–alquilación por medio de Mitsunobu de ácido hidroxámico en etapas)

Paso 1: Preparación de éster metílico del ácido 4–{ciclohexiloxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.8)

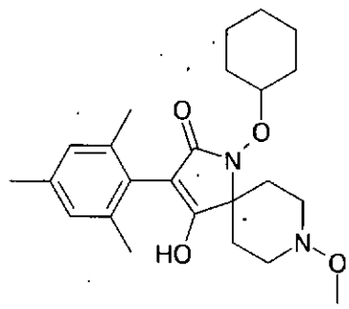


A una solución de trifenilfosfina (0,81 g, 3,09 mmol) en THF (20 ml) a 0°C se le agregó azodicarboxilato de diisopropilo (0,64 ml, 0,66 g, 3,10 mmol) por goteo y el precipitado resultante se agitó a 0°C durante 30 minutos. Se agregó adicionalmente en una porción el éster metílico del ácido 4–{Hidroxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.3 obtenido de manera análoga al ejemplo de preparación 1, paso 4) (1,0 g, 2,74 mmol), seguido por una solución de ciclohexanol (0,33 ml, 0,31 g, 3,10 mmol) en THF (2 ml) por goteo a 0°C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante dos horas y se concentró *in vacuo*. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 1:3). Rendimiento: 690 mg de éster metílico del ácido 4–{ciclohexiloxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.8) en forma de una goma incolora.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,17–1,59 (señales br, total 7H), 1,68 (m, 1H), 1,91 (m, 2H), 2,03 (m, 1H), 2,17 (br s, 6H), 2,21 (s, 3H), 2,32 (m, 2H), 2,44 (m, 1H), 2,69 (m, 1H), 3,09 (m, 1H), 3,25 (m, 2H), 3,51 (s, 3H), 3,61 (s, 3H), 3,69 (m, 1H), 3,92–4,12 (m, 2H), 6,80 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 447 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 1–ciclohexiloxi–4–hidroxi–8–metoxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto del título P2.26)



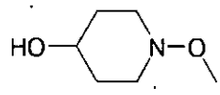
A una solución de éster metílico del ácido 4–{ciclohexiloxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (600 mg, 1,34 mmol) en dimetilformamida (10 ml) a 0°C se agregó metóxido de sodio (217 mg, 4,02 mmol) en una porción y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se vertió sobre cloruro de amonio acuoso saturado frío y se extrajo vigorosamente con acetato de etilo (4x 25 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 1:1). Rendimiento: 329 mg de 1–ciclohexiloxi–4–hidroxi–8–metoxi–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto del título P2.26) en forma de una espuma ligeramente tostada. La trituración con hexano proporcionó un sólido blanco, p.f. 115–118°C.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,20–1,38 (m, 3H), 1,47 (m, 2H), 1,58 (m, 1H), 1,85 (m, 4H), 2,06 (m, 2H), 2,11 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,39 (m, 2H), 3,12–3,29 (m, 2H), 3,30–3,48 (m, 2H), 3,55 (s, 3H), 3,98 (m, 1H), 6,90 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 415 $(M+H)^+$.

EJEMPLO 9: Preparación del éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{(1–metoxi–piperidin–4–iloxi)–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.26)

Paso 1: Preparación de 1–metoxi–piperidin–4–ol



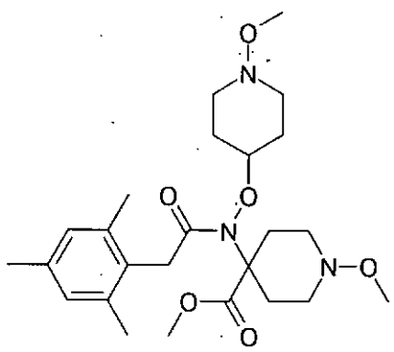
000377

A una solución de 1–metoxi–piperidin–4–ona [preparada de acuerdo con Journal of Organic Chemistry (1961), 26, 1867–74] (15,0 g, 116,1 mmol) en etanol (430 ml) se agregó borohidruro sódico 96% (2,29 g, 58,1 mmol) en porciones. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 5 horas, se evaporó hasta la mitad de su volumen, se vertió sobre cloruro de amonio acuoso saturado frío y se extrajo vigorosamente con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo). Rendimiento: 10,9 g de 1–metoxi–piperidin–4–ol como un líquido.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,46–2,06 (señales br, total 5H), 2,34–3,40 (señales br, 4H total), 3,53 (s, 3H), 3,59–3,96 (señales br, total 1H).

LC/MS (ES+): 132 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{(1–metoxi–piperidin–4–iloxi)–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico (compuesto del título P3.26)



A una solución de trifenilfosfina (1,11 g, 4,23 mmol) en THF (20 ml) a 0°C se agregó azodicarboxilato de diisopropilo (0,83 ml, 0,85 g, 4,24 mmol) por goteo y el precipitado resultante se agitó a 0°C durante 30 minutos. El éster metílico del ácido 4–{hidroxi–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.3 obtenido de manera análoga al ejemplo de preparación 1, paso 4) (1,3 g, 3,57 mmol) se agregó adicionalmente en una porción, seguido por una solución de 1–metoxi–piperidin–4–ol (0,53 g, 4,04 mmol) en THF (6 ml) por goteo a 0°C. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante dos horas y se concentró *in vacuo*. El residuo se trituró con hexano y se filtró para eliminar parte del óxido de trifenilfosfina insoluble. El líquido

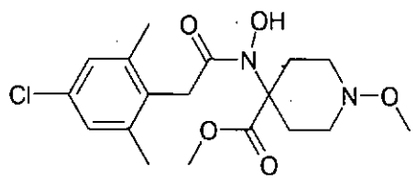
filtrado se evaporó y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (gradiente acetato de etilo/heptano 3:7 → acetato de etilo). Rendimiento: 861 mg de éster metílico del ácido 1–metoxi–4–{(1–metoxi–piperidin–4–iloxi)–[2–(2,4,6–trimetil–fenil)–acetil]–amino}–piperidin–4–carboxílico puro (compuesto del título P3.26) en forma de una goma incolora, seguido por una segunda fracción de compuesto P3.26 (701 mg) contaminada ligeramente con óxido de trifenilfosfina.

^{1}H RMN (CD_3OD, señales seleccionadas solamente): 2,19 (s, 6H, mesitilo CH_3), 2,23 (s, 3H, mesitilo CH_3), 3,52 (br s, 3H, $NOCH_3$), 3,54 (br s, 3H, $NOCH_3$), 3,65 (s, 3H, $COOCH_3$), 6,82 (s, 2H, mesitilo H_{arom}).

LC/MS (ES+): 478 $(M+H)^+$

EJEMPLO 10: Preparación de 3–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–1–etoxicarboniloxi–8–metoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster etil éster del ácido carbónico (compuesto P1.115)

Paso 1: Preparación de éster metílico del ácido 4–{[2–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P3.34)



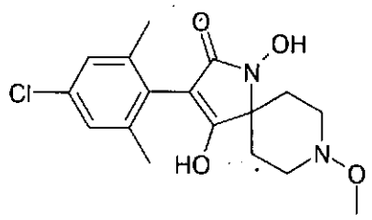
A una solución de cloruro de (4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–acetilo (2,90 g, 13,4 mmol) en THF (25 ml) se agregó hidrógeno carbonato sódico (1,90 g, 22,7 mmol) a 0°C, seguido por éster metílico del ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (ejemplo de preparación 1, paso 3; compuesto P4.2) (2,73 g, 13,4 mmol) disuelto en THF (25 ml) por goteo. La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante 30 minutos, luego 30 minutos adicionales a temperatura ambiente. Luego de completarse la reacción indicada por TLC y LC/MS, la mezcla de reacción se filtró y el residuo (NaCl) se lavó con THF. El líquido filtrado se concentró hasta sequedad y se agitó varias veces con pocas cantidades de una mezcla de éter/ hexano (1:1) para eliminar los productos secundarios. Finalmente, el compuesto se lavó con éter para proporcionar el éster metílico del ácido 4–{[2–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–

carboxílico puro (compuesto P3.34) en forma de un sólido blanco. Rendimiento: 3,7 g, p.f. 228–231°C.

^{1}H RMN (DMSO–d_6): 1,77–1,91 (br m, 1H), 1,91–2,05 (br m, 1H), 2,13 (s, 6H), 2,30–2,42 (br m, 1H), 2,45–2,55 (br m, 1H; cubierto por pico de solvente de DMSO), 2,62–2,80 (br m, 2H), 3,05–3,21 (br m, 2H), 3,40 (s, 3H), 3,55 (s, 3H), 3,70–3,85 (br m, 2H), 7,05 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 385/387 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 3–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–1,4–dihidroxi–8–metoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.103)

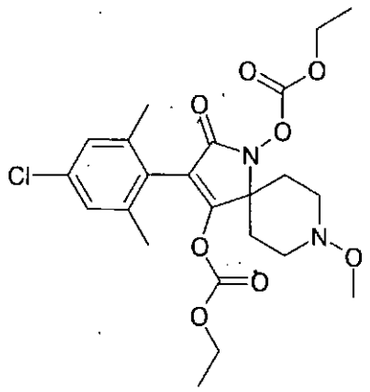


A una suspensión del éster metílico del ácido 4–{[2–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–acetil]–hidroxi–amino}–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (0,40 g, 1,04 mmol) en dimetilformamida (3 ml) a 0°C se le agregó terc–butóxido de potasio (0,35 g, 3,12 mmol) en porciones. Después de completarse la adición, se continuó la agitación a 0°C durante 30 minutos y a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se vertió en agua fría (0°C), el pH se reguló hasta cerca de 5,5 agregado HCl 1 N y luego se extrajo vigorosamente con acetato de etilo (tres veces). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El material en bruto resultante se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (gradiente acetato de etilo/ciclohexano 1:1 → acetato de etilo). Rendimiento: 0,14 g de 3–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–1,4–dihidroxi–8–metoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.103) en forma de un sólido blanco.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,95–2,10 (br m, 2H), 2,15–2,30 (br m, 2H), 2,18 (s, 6H), 3,20–3,50 (br m, 4H total), 3,55 (s, 3H), 7,14 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 353/355 $(M+H)^+$

Paso 3: Preparación de 3–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–1–etoxicarboniloxi–8–metoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster etil éster del ácido carbónico (compuesto del título P1.115)

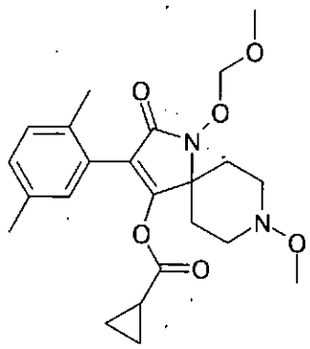


A una solución de 3–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–1,4–dihidroxi–8–metoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (140 mg, 0,40 mmol) y trietilamina (0,1 ml, 72 mg, 0,71 mmol) en THF (3 ml) a 0°C se le agregó una solución de cloroformiato de etilo (0,05 ml, 52 mg, 0,48 mmol) disuelto en THF (2 ml) por goteo. La suspensión se agitó a 0°C durante 30 minutos. Luego, la mezcla de reacción se vertió en agua fría (0°C) y se extrajo vigorosamente tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El material en bruto se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 1:4). Rendimiento: 70 mg de 3–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–1–etoxicarboniloxi–8–metoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster etil éster del ácido carbónico (compuesto del título P1.115) en forma de una goma incolora.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,09 (t, 3H), 1,39 (t, 3H), 2,08–2,30 (br m, 4H), 2,19 (s, 6H), 2,70–3,13 (br m, total 2H), 3,20–3,42 (br m, 2H), 3,55 (s, 3H), 4,03 (q, 2H), 4,38 (br q, 2H), 7,05 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 497/499 $(M+H)^+$

EJEMPLO 11: Preparación de 3–(2,5–dimetil–fenil)–8–metoxi–1–metoximetoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del ácido ciclopropancarboxílico (compuesto P1.4)

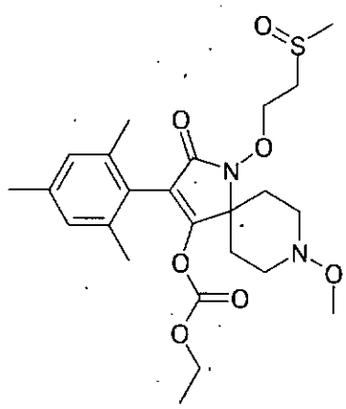


A una solución de 3–(2,5–dimetil–fenil)–4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.2) (200 mg, 0,55 mmol), trietilamina (0,153 ml, 111 mg, 1,10 mmol) y una cantidad catalítica de 4–dimetilaminopiridina en tetrahidrofurano (6 ml) a 0°C se le agregó cloruro de ácido ciclopropancarboxílico (0,066 ml, 75 mg, 0,72 mmol) por goteo. La suspensión se agitó a 0°C durante 10 minutes, y a temperatura ambiente durante una hora. La mezcla de reacción se evaporó, se diluyó con acetato de etilo y se filtró para eliminar las sales. El líquido filtrado se lavó con una solución acuosa saturada de hidrógeno carbonato sódico y salmuera, se secó sobre sulfato sódico y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:2) para proporcionar 200 mg de un producto oleoso. Este material se trituró con éter de dietilo, se filtró y se secó. Rendimiento: 190 mg de 3–(2,5–dimetil–fenil)–8–metoxi–1–metoximetoxi–2–oxo–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del ácido ciclopropancarboxílico (compuesto del título P1.4) en forma de un sólido blanco, p.f. 114–116°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 0,75–0,92 (br m, 4H), 1,63 (br m, 1H), 1,72–2,03 (br m, 2H), 2,19 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 2,47 (br m, 2H), 2,88 (br m, 1H), 3,16–3,45 (br m, 3H), 3,56 (s, 3H), 3,64 (s, 3H), 5,07 (br s, 2H), 6,91 (s, 1H), 7,02 (d, 1H), 7,08 (d, 1H).

LC/MS (ES+): 431 $(M+H)^+$

EJEMPLO 12: Preparación de 1–(2–methanesulfinil–etoxi)–8–metoxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster del éster etílico del ácido carbónico (compuesto P1.111)



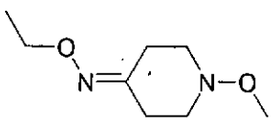
A una solución de 8–metoxi–1–(2–metilsulfanil–etoxi)–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto P1.110) (400 mg, 0,84 mmol) en diclorometano (10 ml) a 0°C se le agregó ácido 3–cloroperbenzoico (210 mg, MCPBA ~70%, 0,85 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche, luego se vertió sobre metabisulfito sódico acuoso saturado y las capas se separaron. La fase acuosa se extrajo con diclorometano (3x), las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua y salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/metanol 20:1). Rendimiento: 220 mg de 1–(2–methanesulfinil–etoxi)–8–metoxi–2–oxo–3–(2,4,6–trimetil–fenil)–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–4–iléster de éster etílico del ácido carbónico (compuesto del título P1.111) en forma de una goma incolora.

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,03 (t, 3H), 2,05 (br m, 2H), 2,13 (s, 3H), 2,14 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,33 (m, 2H), 2,75 (s, 3H), 2,96 (br m, 1H), 3,09–3,46 (br m, total 5H), 3,55 (s, 3H), 4,01 (q, 2H), 4,59 (m, 2H), 6,89 (s, 2H).

LC/MS (ES+): 495 $(M+H)^+$

EJEMPLO 13: Preparación de 2–(4–Cloro–2,6–dimetil–fenil)–N–(4–ciano–1–metoxi–piperidin–4–il)–N–etoxi–acetamida (compuesto P3.49)

Paso 1: Preparación de O–etil–oxima de 1–metoxi–piperidin–4–ona

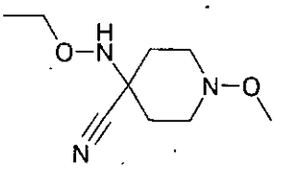


Obtenida a partir de 1–metoxi–piperidin–4–ona (20 g, 154,85 mmol), trietilamina (47,4 ml, 34,5 g, 340,66 mmol) y clorhidrato de O–etil–hidroxilamina (30,2 g, 309,69 mmol) en metanol (300 ml) de acuerdo con el procedimiento 'EJEMPLO 1, Paso 1'. Rendimiento: 22,02 g de O–etil–oxima de 1–metoxi–piperidin–4–ona en forma de un líquido viscoso, incoloro. Este material se utilizó sin más purificación en el siguiente paso.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,25 (t, 3H), 2,20–3,40 (señales br, total 8H), 3,55 (s, 3H), 4,07 (q, 2H).

LC/MS (ES+): 173 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 4–etoxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo

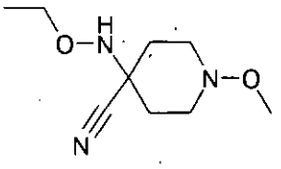


Obtenido a partir de O–etil–oxima de 1–metoxi–piperidin–4–ona (10 g, 58,06 mmol), dihidrógeno fosfato de potasio (31,6 g, 232,20 mmol) en agua (50 ml) a 0–5°C donde se agregó una solución de cianuro potásico (6,81 g, 104,58 mmol) en agua (50 ml) de acuerdo con el procedimiento 'EJEMPLO 1, Paso 2'. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 días [se trató entre medio con otra porción de dihidrógeno fosfato de potasio (7,9 g) y cianuro de potasio (1,9 g)] y a 40°C durante 4 días [nuevamente se trató entre medio con otra porción de dihidrógeno fosfato de potasio (7,9 g) y cianuro potásico (1,9 g)]. La mezcla se lavó con nitrógeno, la capa acuosa se saturó con cloruro sódico y e extrajo con éter dietílico (4x 150 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 1:2). Rendimiento: 5,1 g de 4–etoxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo en forma de un aceite de color amarillo claro.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,19 (t, 3H), 1,59–2,29 (señales br, 4H total), 2,64–3,43 (señales br, 4H total), 3,52 (s, 3H), 3,80 (q, 2H), 5,37 (br s, 1H).

IR (CN): □ 2235,3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 200 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de 4–etoxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo (compuesto P4.3)

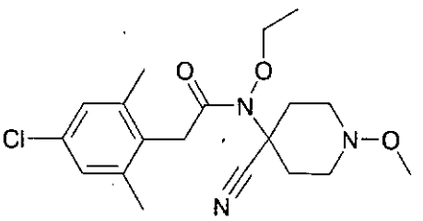


Obtenido a partir de O–etil–oxima de 1–metoxi–piperidin–4–ona (10 g, 58,06 mmol), dihidrógeno fosfato de potasio (31,6 g, 232,20 mmol) en agua (50 ml) a 0–5°C donde se agregó una solución de cianuro potásico (6,81 g, 104,58 mmol) en agua (50 ml) de acuerdo con el procedimiento 'EJEMPLO 1, Paso 2'. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 días [se trató entre medio con otra porción de dihidrógeno fosfato de potasio (7,9 g) y cianuro potásico (1,9 g)] y a 40°C durante 4 días [nuevamente se trató entre medio con otra porción de dihidrógeno fosfato de potasio (7,9 g) y cianuro potásico (1,9 g)]. La mezcla se lavó con nitrógeno, la capa acuosa se saturó con cloruro sódico y se extrajo con éter dietílico (4x 150 ml). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 1:2). Rendimiento: 5,1 g de 4–etoxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo (compuesto P4.3) en forma de un aceite de color amarillo claro.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,19 (t, 3H), 1,59–2,29 (señales br, 4H total), 2,64–3,43 (señales br, 4H total), 3,52 (s, 3H), 3,80 (q, 2H), 5,37 (br s, 1H).

IR (CN): □ 2235,3 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 200 $(M+H)^+$

Paso 3: Preparación de 2–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–N–(4–ciano–1–metoxi–piperidin–4–il)–N–etoxi–acetamida (compuesto del título P3.49)



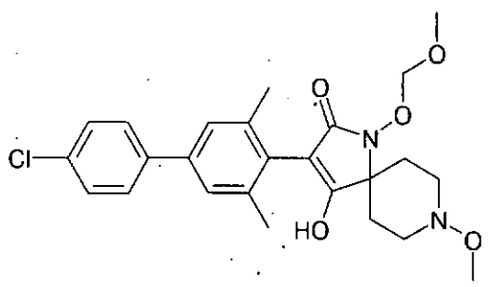
A una solución de 4–etoxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo (2,0 g, 10,04 mmol), trietilamina (3,49 ml, 2,54 g, 25,09 mmol) y una cantidad catalítica de 4–dimetilamino–piridina en tetrahidrofurano (10 ml) a 0°C se agregó una solución de cloruro de (4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–acetilo (2,18 g, 10,04 mmol) en

tetrahidrofurano (1 ml) por goteo. La suspensión se agitó a 0°C durante 15 minutos, y a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se evaporó, se diluyó con acetato de etilo y agua, y las capas se separaron. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo, las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El material en bruto se trituró con éter de diisopropilo, se filtró y el líquido filtrado se concentró. El residuo oleoso se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:1). Rendimiento: 1,53 g de 2–(4–cloro–2,6–dimetil–fenil)–N–(4–ciano–1–metoxi–piperidin–4–il)–N–etoxi–acetamida (compuesto del título P3.49) en forma de un aceite incoloro, el cual solidificó luego de reposo, p.f. 100–103°C.

^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,36 (t, 3H), 2,00–3,44 (señales br, total 8H), 2,24 (s, 6H), 3,51 (br s, 3H), 3,63 (br d, 1H), 4,04 (br d, 1H), 4,13 (br q, 2H), 7,04 (s, 2H).

IR (CN): □ 2243.4 cm^{-1}. LC/MS (ES+): 380/382 $(M+H)^+$

EJEMPLO 14: Preparación de 3–(4'–Cloro–3,5–dimetil–bifenil–4–il)–4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.15)



A una suspensión de 3–(4–bromo–2,6–dimetil–fenil)–4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.14) (500 mg, 1,13 mmol) en dimetoxietano (22 ml) bajo atmósfera de nitrógeno se agregó tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) (65 mg, 0,056 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. Después de la adición de agua (4,3 ml), ácido 4–clorofenilborónico (213 mg, 1,36 mmol) y carbonato de sodio (410 mg, 3,87 mmol), la mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas. La mezcla de reacción se acidificó a temperatura ambiente con ácido clorhídrico 1N y se extrajo con acetato de etilo (3x). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. El residuo se purificó

por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/heptano 5:3) para proporcionar 150 mg de un producto gomoso. Este material se trituró con metanol, se filtró y secó.

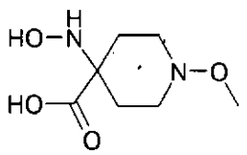
Rendimiento: 90 mg de 3–(4'–cloro–3,5–dimetil–bifenil–4–il)–4–hidroxi–8–metoxi–1–metoximetoxi–1,8–diaza–espiro[4.5]dec–3–en–2–ona (compuesto P2.15) en forma de un sólido blanco, p.f. 128°C (desc).

^{1}H RMN ($CDCl_3$, señales seleccionadas solamente): 2,27 (br s, 6H, mesitilo CH_3), 3,60 (br s, 3H, OCH_3), 3,62 (br s, 3H, OCH_3), 5,05 (s, 2H, $O\boldsymbol{CH_2}OCH_3$), 7,26 (s, 2H, H_{arom}), 7,39 (d, 2H, H_{arom}), 7,49 (d, 2H, H_{arom}).

LC/MS (ES+): 473/475 $(M+H)^+$

EJEMPLO 15: Preparación alternativa de éster metílico del ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P4.2)

Paso 1: Preparación de ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P4.4)

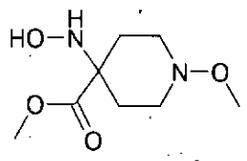


Se agregó 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carbonitrilo (compuesto P4.1) (1,5 g, 8,76 mmol) en dos porciones a ácido sulfúrico concentrado (15 ml) a 0°C. Después de agitar durante 20 minutos, se obtuvo una solución amarilla la cual se mantuvo a temperatura ambiente durante dos días. La mezcla de reacción se diluyó con agua helada (30 ml), se calentó a reflujo durante 4 horas, luego se vertió en hielo (25 g) y se neutralizó con amoníaco acuoso al 25% bajo enfriamiento hasta pH 7–8. La mezcla de reacción se evaporó y el residuo sólido blanco se trituró con metanol caliente (40°C) (3x 50 ml), se filtró y las fases de metanol combinadas se concentraron. El residuo se trató con tolueno (3x 50 ml) para eliminar el agua azeotrópicamente hasta un peso constante, luego se trituró con tetrahidrofurano, se filtró y secó. Rendimiento: 1,58 g de ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto P4.4) en forma de un sólido blanco, p.f. 180°C (desc).

^{1}H RMN (CD_3OD): 1,54–2,29 (señales br, 4H total), 2,82 (br m, 2H), 3,07–3,26 (señales br, total 2H), 3,49 (s, 3H).

LC/MS (ES+): 191 $(M+H)^+$

Paso 2: Preparación de éster metílico del ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto del título P4.2)



A una suspensión de ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (1,0 g, 5,26 mmol) en metanol (25 ml) a 0–10°C se agregó cloruro de tionilo (1,14 ml, 1,88 g, 15,77 mmol) y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 48 horas. Luego de enfriamiento, la mezcla se concentró, el residuo se diluyó con agua helada (20 ml) y se neutralizó con bicarbonato sódico acuoso. La fase acuosa se extrajo con éter dietílico (3x 25 ml), las capas orgánicas combinadas se lavaron con bicarbonato sódico acuoso y salmuera, se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron. Rendimiento: 0,53 g de éster metílico del ácido 4–hidroxiamino–1–metoxi–piperidin–4–carboxílico (compuesto del título P4.2) como un aceite viscoso amarillento. Este material era idéntico al compuesto descrito anteriormente bajo la preparación 'EJEMPLO 1, Paso 3'.

LC/MS (ES+): 205 $(M+H)^+$

Los compuestos de la fórmula I de la Tabla P1, los compuestos de la fórmula II de la Tabla P2 y los compuestos intermedios enlistados en las Tablas P3 y P4 pueden prepararse por procedimientos análogos. Se utilizó cualquiera de los siguientes métodos de LC–MS para caracterizar los compuestos:

Método A

EM: Espectrómetro de Masas ZQ de Waters (espectrómetro de masas de cuadrúpolo único); Método de ionización: Electrospray; Polaridad: iones positivos/negativos; Capilar (kV) 3,00, Cono (V) 30.00, Extractor (V) 2.00, Temperatura Fuente (°C) 100, Temperatura de Desolvatación (°C) 250, Flujo de Gas del Cono (L/Hr) 50, Flujo de Gas de Desolvatación (L/Hr) 400; Rango masal: 150 a 1000 o 100 a 900 Da.

LC: HP 1100 HPLC de Agilent: desgasificador de solvente, bomba cuaternaria (ZCQ) / bomba binaria (ZDQ), compartimiento de columna calentado y detector de arreglo de diodos. Columna: Phenomenex Gemini C18, tamaño de partícula 3 □m, 110 Angström, 30 x 3 mm, Temp: 60°C; Rango de longitud de onda DAD (nm): 200 a 500; Gradiente de solvente: A = agua + 0,05% v/v HCOOH, B= Acetonitrilo/Metanol (4:1, v/v) + 0,04% v/v HCOOH.

Tiempo (min)	A%	B%	Flujo (ml/min)
0,00	95,0	5,0	1,700
2,00	0,0	100,0	1,700
2,80	0,0	100,0	1,700
2,90	95,0	5,0	1,700
3,00	95,0	5,0	1,700

Método B

EM: Espectrómetro de Masas ZMD de Waters (espectrómetro de masas de cuadrúpolo único); Método de ionización: Electrospray; Polaridad: iones positivos/negativos; Capilar (kV) 3.80, Cono (V) 30.00, Extractor (V) 3.00, Temperatura de Fuente (°C) 150, Temperatura de Desolvatación (°C) 350, Flujo de Gas del Cono (L/Hr) APAGADO, Flujo de Gas de Desolvatación (L/Hr) 600; Rango masal: 150 a 1000 (100 a 1500 para LowMass) o 100 a 900 Da.

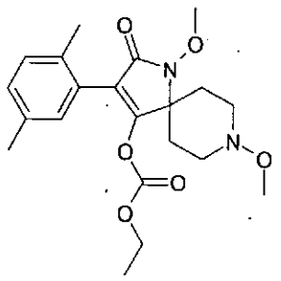
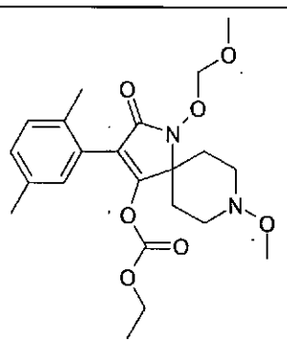
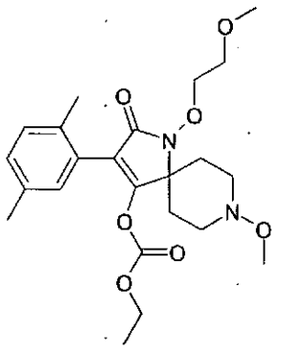
LC: HP 1100 HPLC de Agilent: ++ desgasificador de solvente, bomba binaria, compartimiento de columna calentado y detector de arreglo de diodos. Columna: Phenomenex Gemini C18, tamaño de partículas 3 □m, 110 Angström, 30 x 3 mm, Temp: 60 °C; Rango de longitud de ondas DAD (nm): 200 a 500; Gradiente de solvente: A = agua + 0,05% v/v HCOOH, B= Acetonitrilo/Metanol (4:1, v:v) + 0,04% v/v HCOOH.

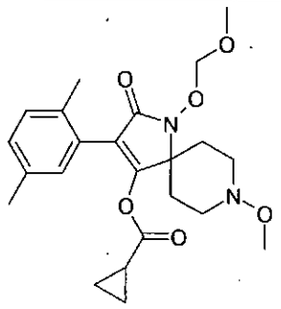
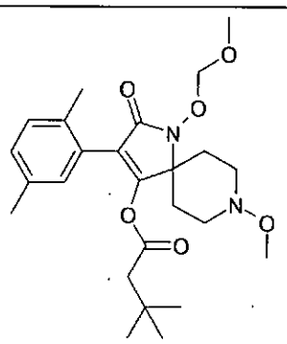
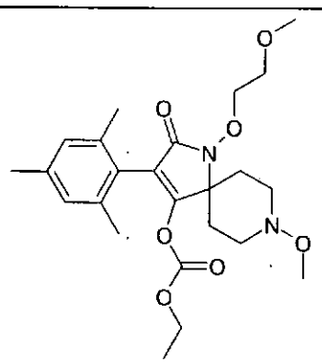
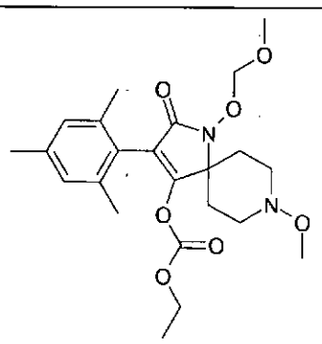
Tiempo (min)	A%	B%	Flujo (ml/min)
0,00	95,0	5,0	1,700
2,00	0,0	100,0	1,700
2,80	0,0	100,0	1,700
2,90	95,0	5,0	1,700

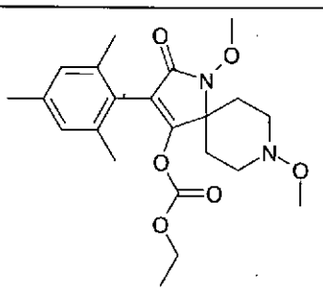
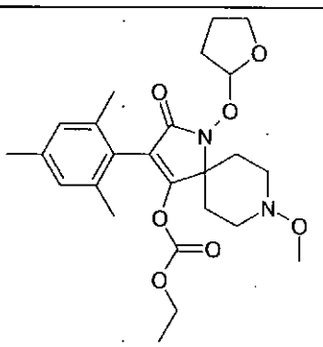
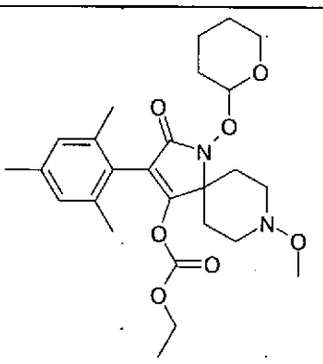
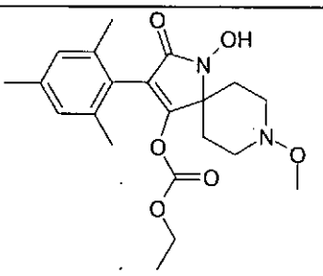
3,00 95,0 5,0 1,700

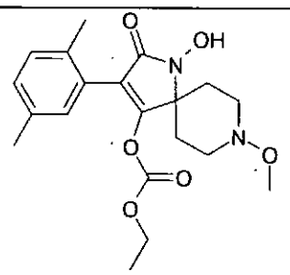
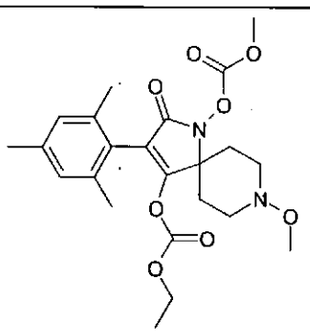
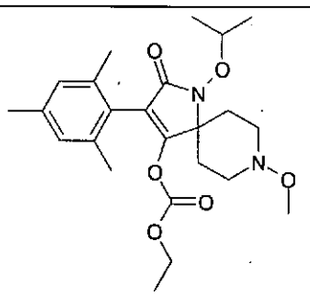
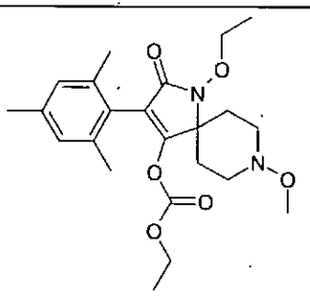
Los valores característicos obtenidos para cada compuesto eran el tiempo de retención ("R_t", registrado en minutos) y el ión molecular según figura en la Tabla P1, Tabla P2, Tabla P3 y en la Tabla P4.

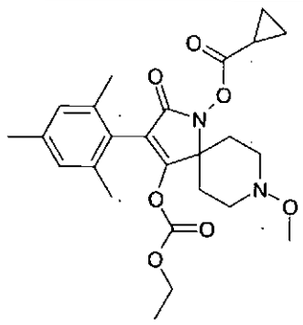
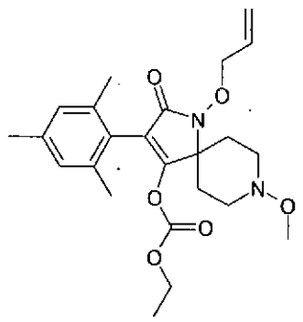
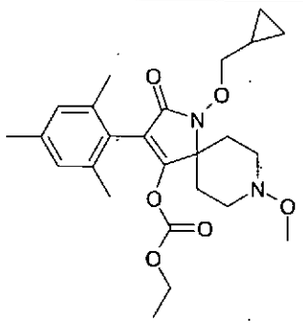
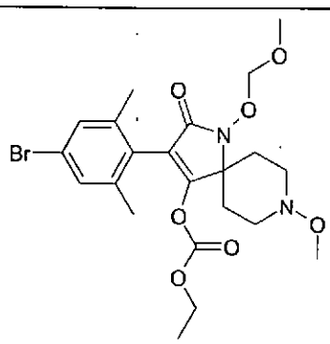
Tabla P1: Datos físicos de los compuestos de fórmula I:

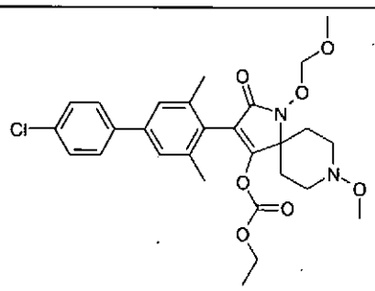
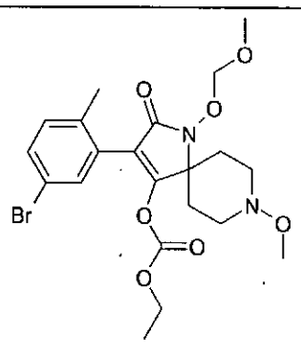
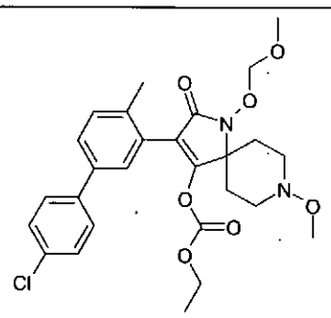
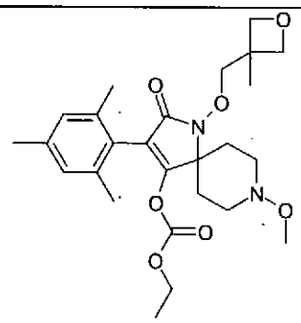
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.1		goma	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1,88 min
P1.2	 EJEMPLO 1, paso 6	109–111°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 1,90 min
P1.3		goma	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min

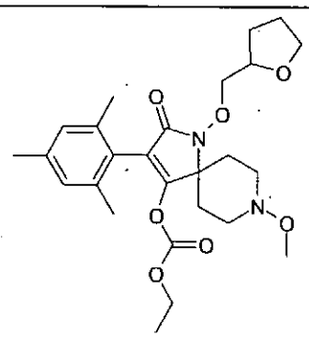
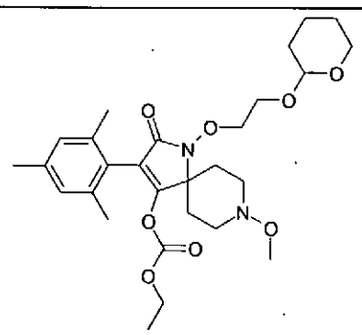
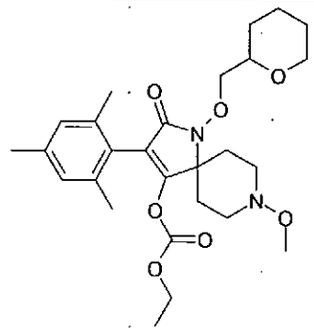
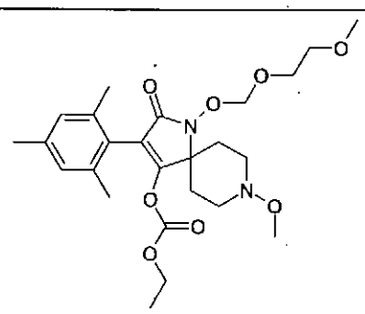
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.4	 EJEMPLO 11	114–116°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1,87 min
P1.5		93–95°C	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 2,12 min
P1.6		goma	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min
P1.7		109–111°C	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min

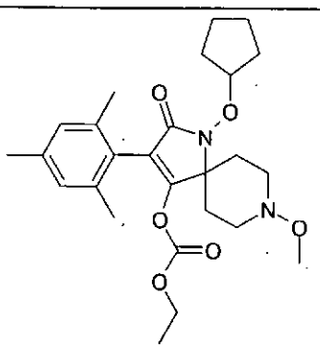
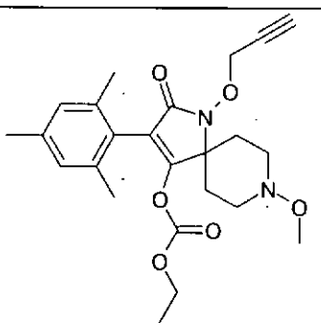
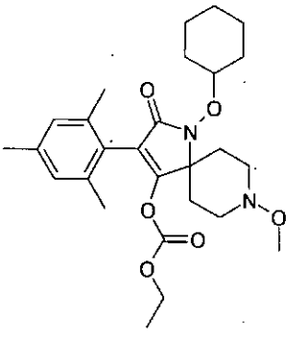
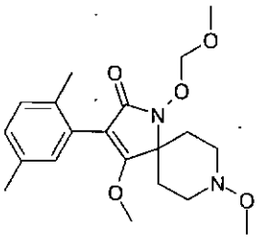
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.8		96–97°C	LC/MS: 419 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min
P1.9	 EJEMPLO 3, paso 2	100–102°C	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.10		130–132°C	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 2,05 min
P1.11	 EJEMPLO 3, paso 1	154–155°C	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1,79 min

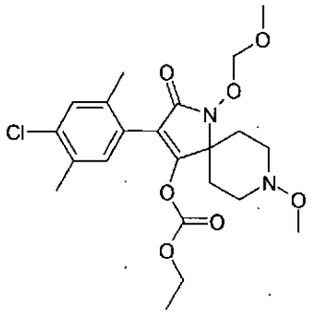
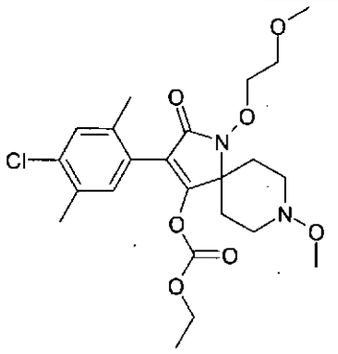
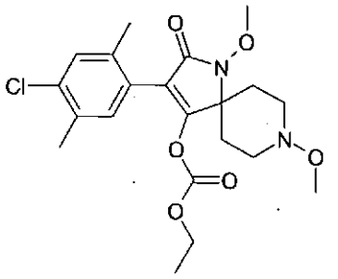
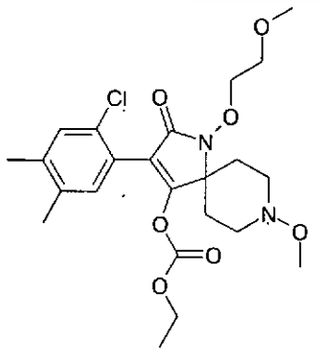
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.12		78–81°C	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P1.13	 EJEMPLO 5	goma	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min
P1.14		goma	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2,07 min
P1.15		84–86°C	LC/MS: 433 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min

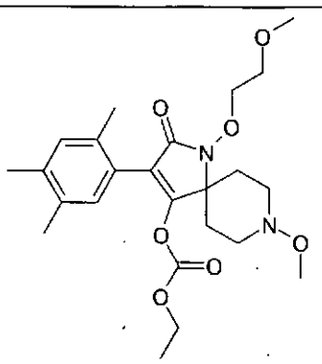
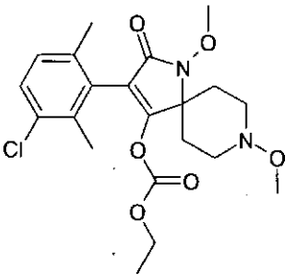
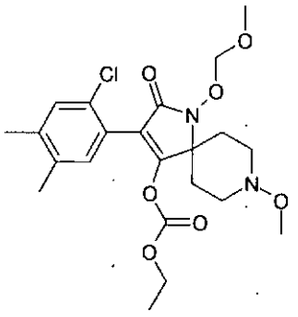
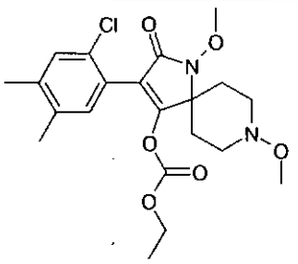
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.16		goma	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P1.17		goma	LC/MS: 445 $(M+H)^+$ R_t = 2,04 min
P1.18		goma	LC/MS: 459 $(M+H)^+$ R_t = 2,09 min
P1.19		83–85°C	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min

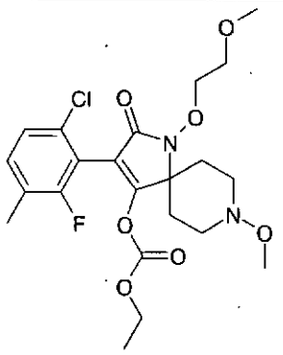
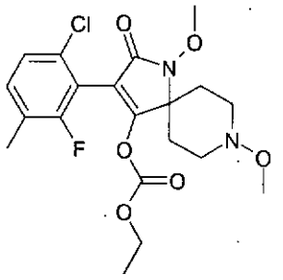
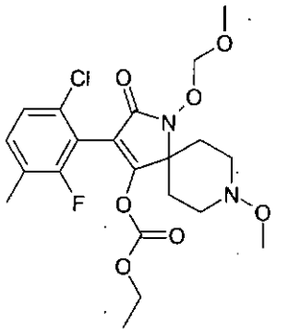
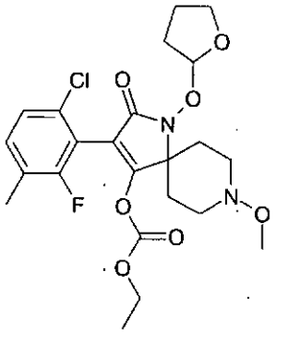
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.20		110–113°C	LC/MS: 545/547 $(M+H)^+$ R_t = 2,20 min
P1.21		118–121°C	LC/MS: 499/501 $(M+H)^+$ R_t = 1,96 min
P1.22		goma	LC/MS: 531/533 $(M+H)^+$ R_t = 2,15 min
P1.23		132–134°C	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 1,99 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.24		53–55°C	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 2,04 min
P1.25		goma	LC/MS: 533 $(M+H)^+$ R_t = 2,12 min
P1.26		74–76°C	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 2,10 min
P1.27		57–59°C	LC/MS: 493 $(M+H)^+$ R_t = 1,96 min

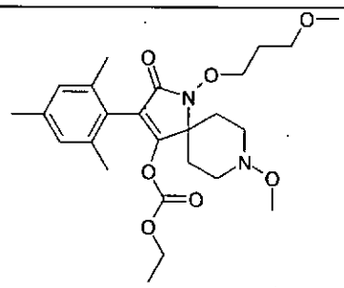
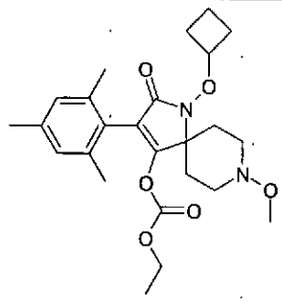
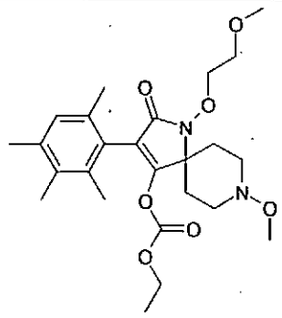
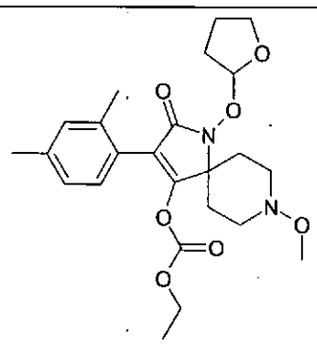
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.28		goma	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2,17 min
P1.29		goma	LC/MS: 443 $(M+H)^+$ R_t = 1,99 min
P1.30		goma	LC/MS: 487 $(M+H)^+$ R_t = 2,19 min
P1.31		91–93°C	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1,79 min

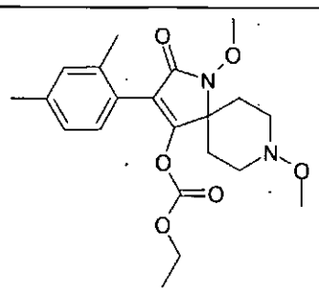
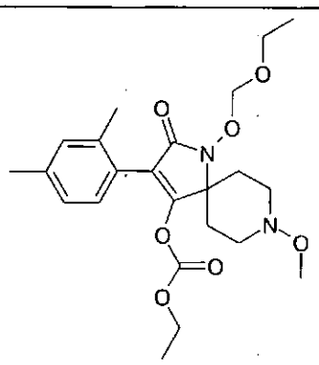
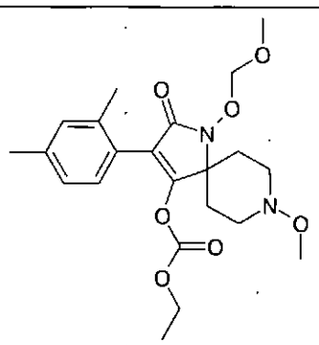
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.32		goma	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1,94 min
P1.33		goma	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,93 min
P1.34		goma	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min
P1.35		sólido	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,87 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.36		goma	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min
P1.37		goma	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min
P1.38		sólido	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1,90 min
P1.39		goma	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1,84 min

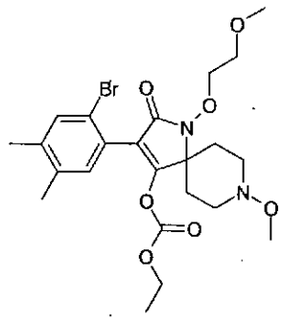
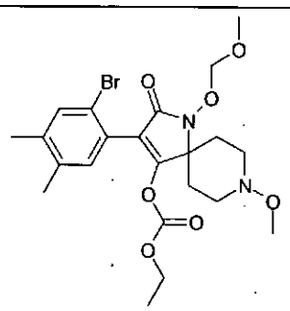
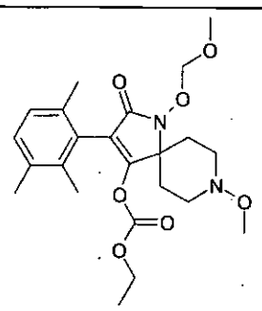
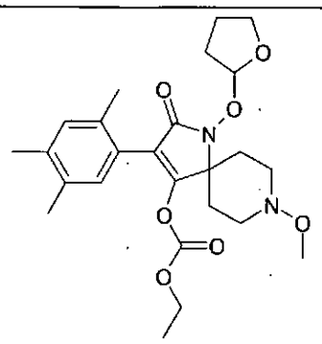
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.40		goma	LC/MS: 487/489 $(M+H)^+$ R_t = 1,84 min
P1.41		sólido	LC/MS: 443/445 $(M+H)^+$ R_t = 1,82 min
P1.42		119–123°C	LC/MS: 473/475 $(M+H)^+$ R_t = 1,85 min
P1.43		135–137°C	LC/MS: 499/501 $(M+H)^+$ R_t = 1,89 min

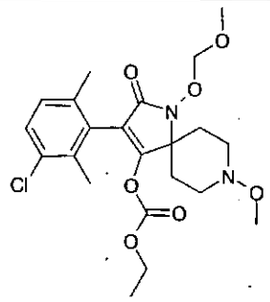
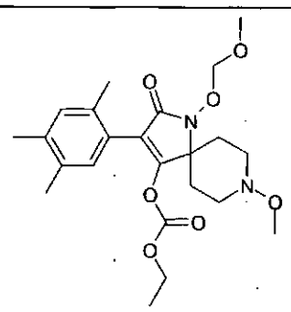
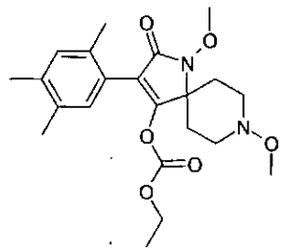
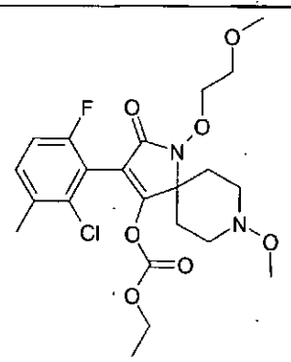
000400

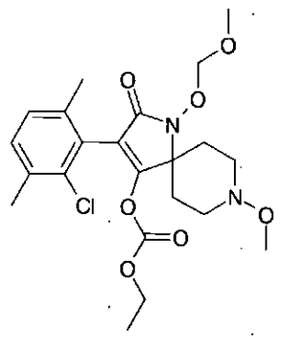
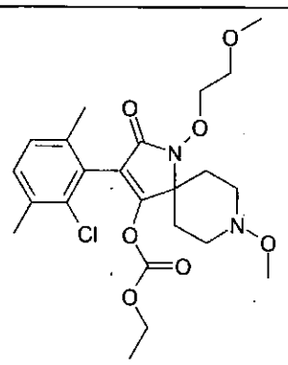
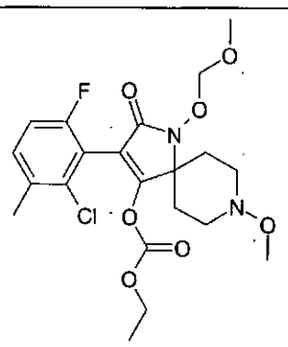
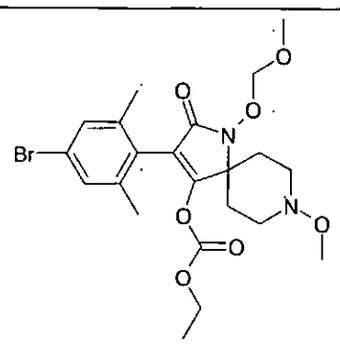
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.44		122–125°C	LC/MS: 477 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.45		goma	LC/MS: 459 $(M+H)^+$ R_t = 2,07 min
P1.46		goma	LC/MS: 477 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min
P1.47		goma	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1,92 min

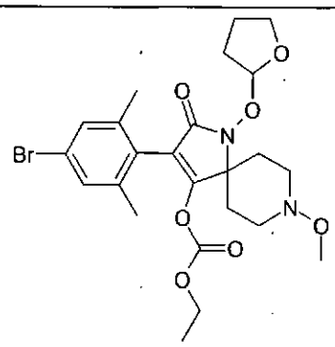
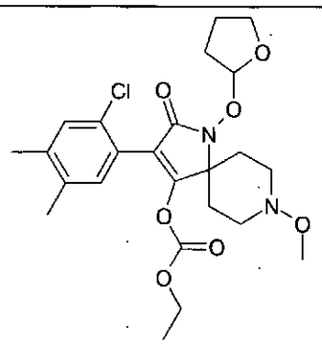
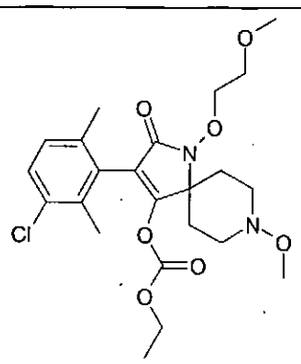
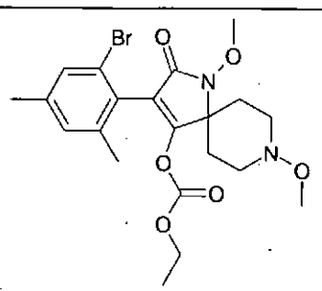
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.48		goma	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1,83 min
P1.49		polvo	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min
P1.50		128–130°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 1,87 min

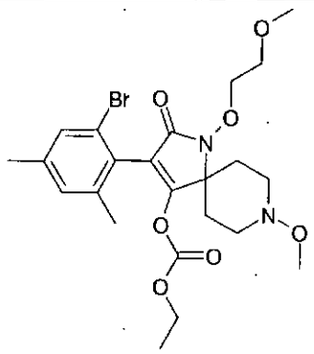
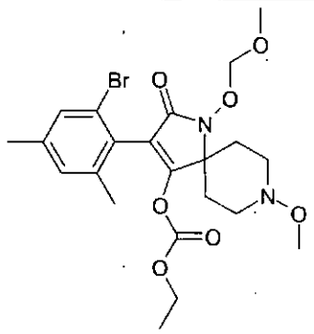
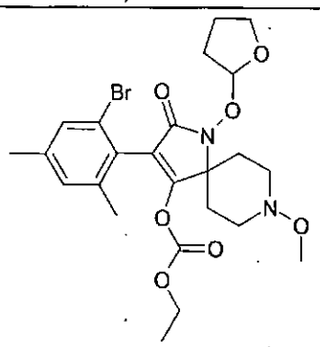
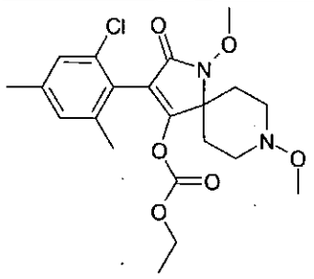
000402

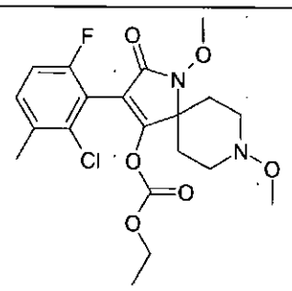
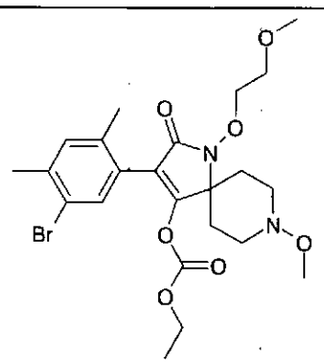
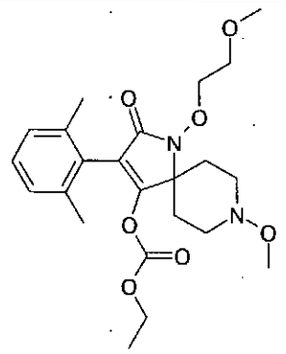
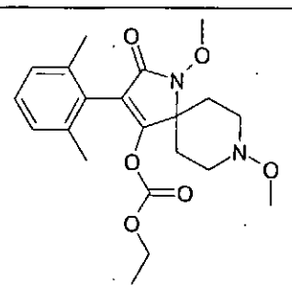
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.51		goma	^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,17 (t, 3H), 2,02–2,31 (br m, 4H total), 2,20 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,91–3,47 (br m, 4H total), 3,43 (s, 3H), 3,56 (s, 3H), 3,72 (br m, 2H), 4,08 (q, 2H), 4,35 (br m, 2H), 7,06 (s, 1H), 7,35 (s, 1H).
P1.52		goma	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 1,92 min
P1.53		goma	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,90 min
P1.54		goma	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1,96 min

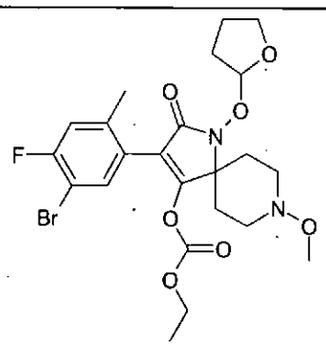
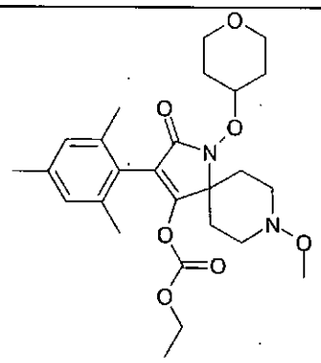
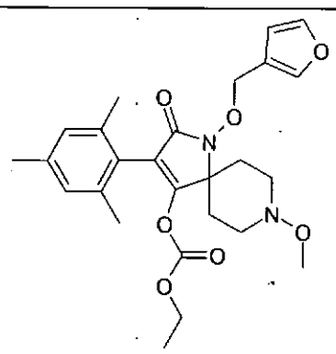
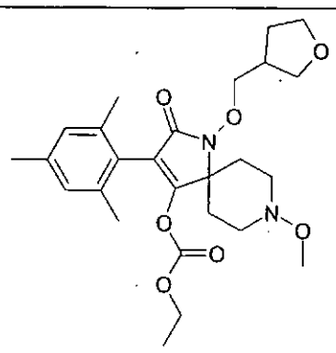
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.55		goma	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1,96 min
P1.56		goma	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,88 min
P1.57		goma	LC/MS: 419 $(M+H)^+$ R_t = 1,90 min
P1.58		goma	LC/MS: 487/489 $(M+H)^+$ R_t = 1,84 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.59		goma	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1,87 min
P1.60		goma	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,86 min
P1.61		116–119°C	LC/MS: 473/475 $(M+H)^+$ R_t = 1,80 min
P1.62		goma	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 2,01 min

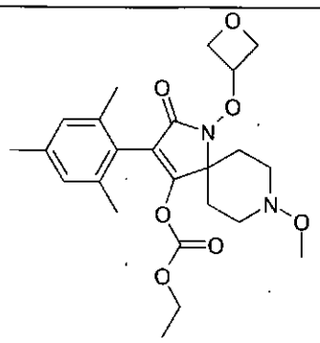
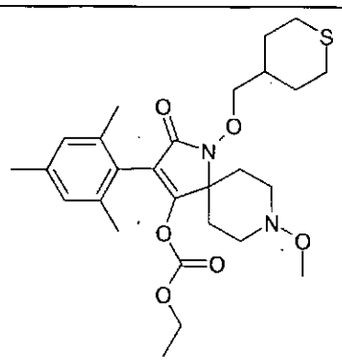
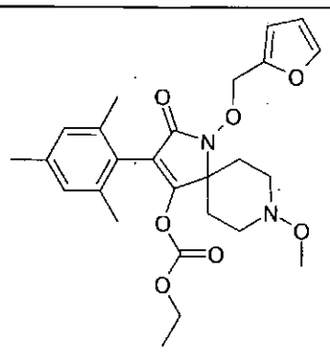
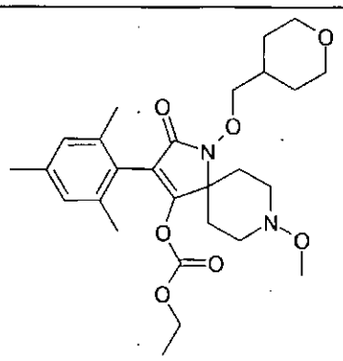
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.63		goma	LC/MS: 539/541 $(M+H)^+$ R_t = 2,01 min
P1.64		goma	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min
P1.65		goma	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,94 min
P1.66		90–94°C	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,89 min

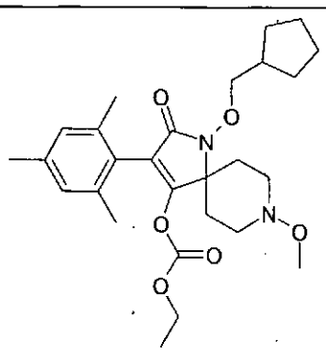
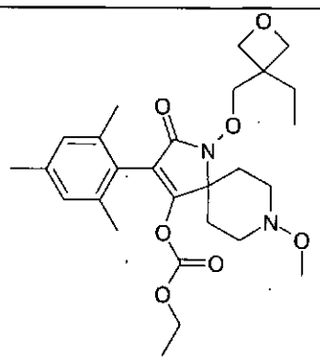
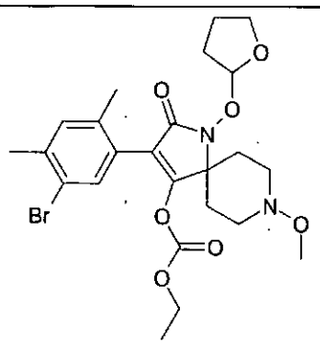
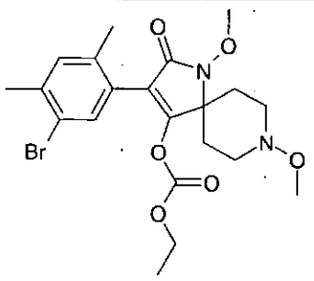
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.67		goma	LC/MS: 527/529 $(M+H)^+$ R_t = 1,92 min
P1.68		goma	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min
P1.69		goma	LC/MS: 539/541 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.70		goma	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1,88 min

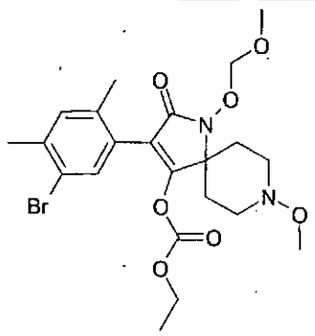
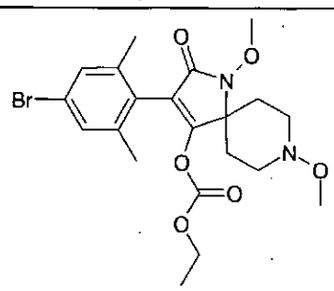
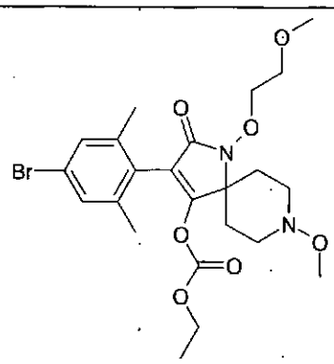
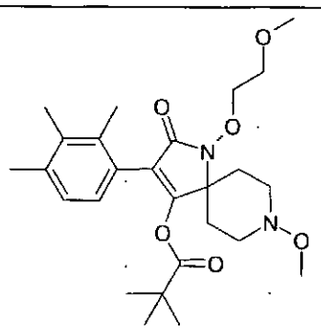
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.71		goma	LC/MS: 443/445 $(M+H)^+$ R_t = 1,79 min
P1.72		goma	LC/MS: 527/529 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.73		goma	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,84 min
P1.74		goma	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1,81 min

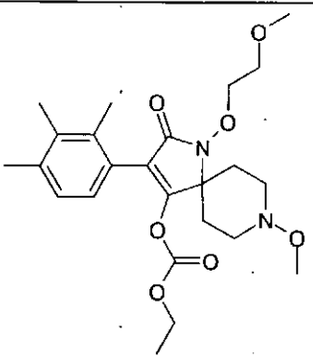
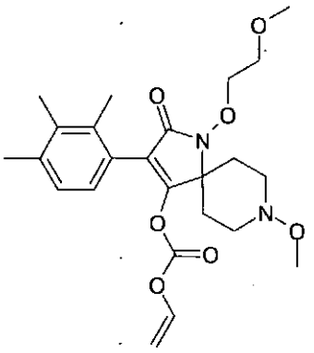
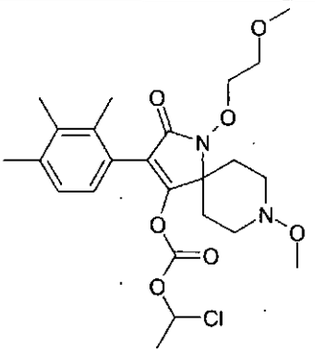
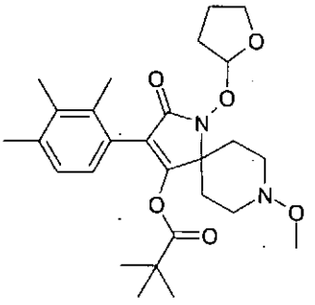
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.75		goma	LC/MS: 543/545 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.76		goma	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 1,93 min
P1.77		goma	LC/MS: 485 $(M+H)^+$ R_t = 2,02 min
P1.78		goma	LC/MS: 489 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min

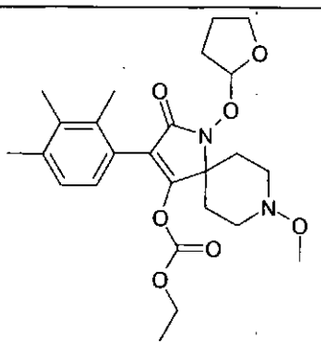
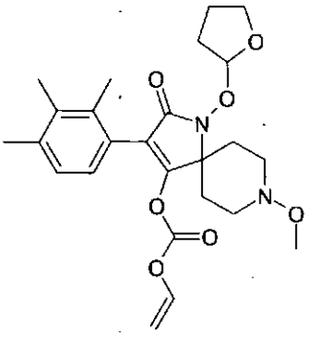
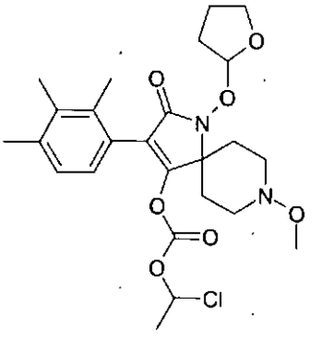
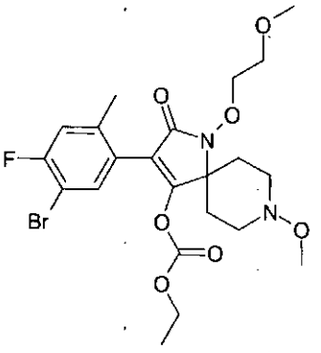
000409

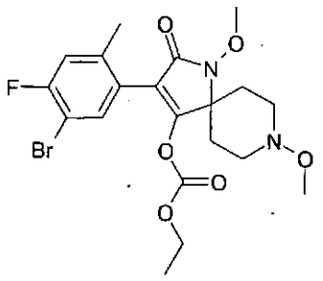
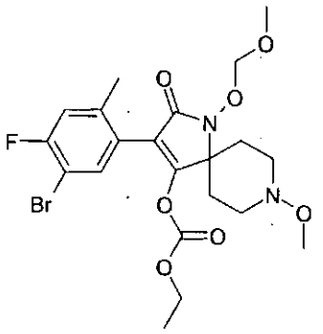
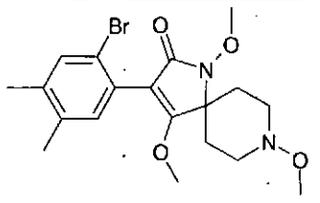
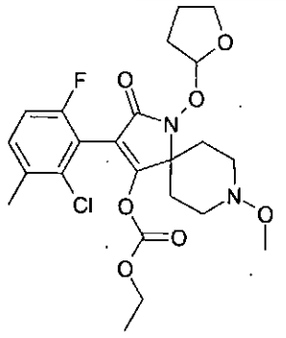
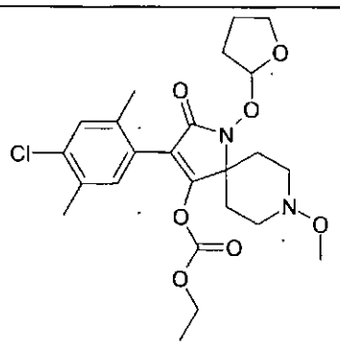
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.79		goma	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1,87 min
P1.80		goma	LC/MS: 519 $(M+H)^+$ R_t = 2,14 min
P1.81		goma	LC/MS: 485 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P1.82		goma	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min

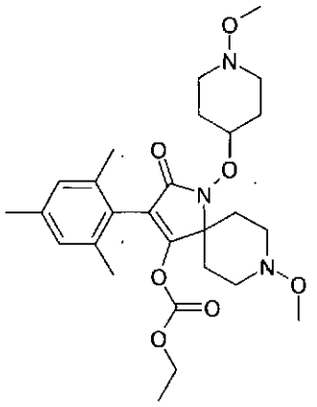
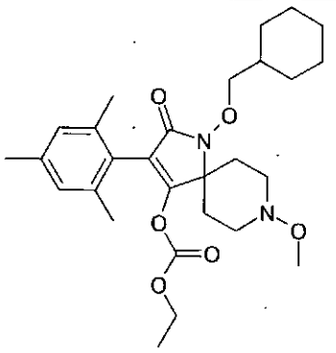
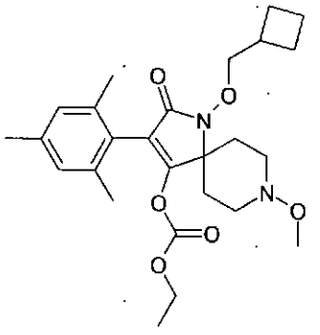
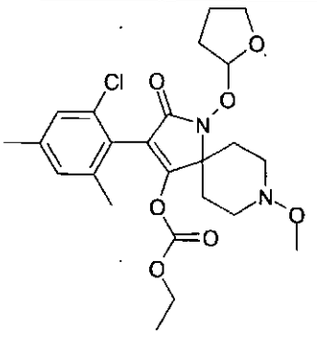
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.83		goma	LC/MS: 487 $(M+H)^+$ R_t = 2,23 min
P1.84		105–107°C	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P1.85		goma	LC/MS: 539/541 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P1.86		goma	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,94 min

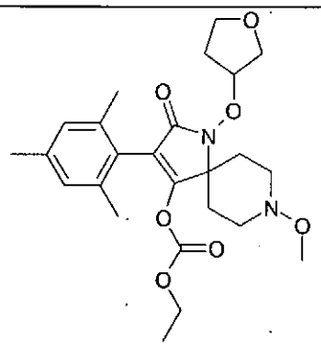
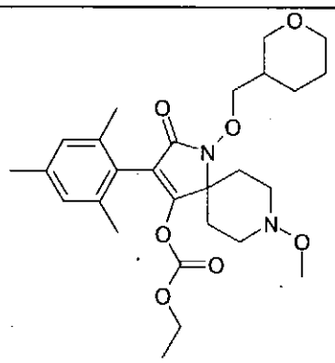
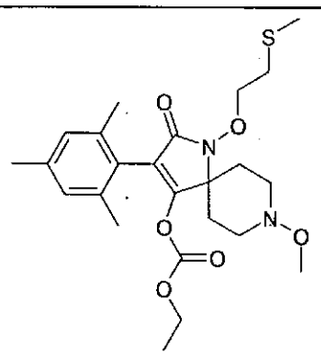
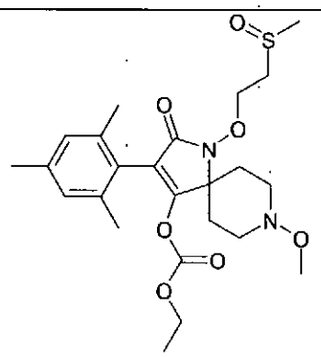
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.87		goma	LC/MS: 513/515 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min
P1.88		113–116°C	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,96 min
P1.89		goma	LC/MS: 527/529 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min
P1.90		goma	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 2,05 min

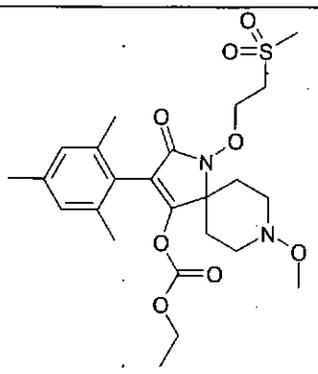
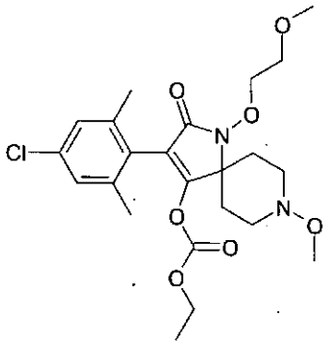
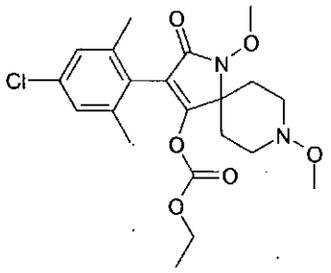
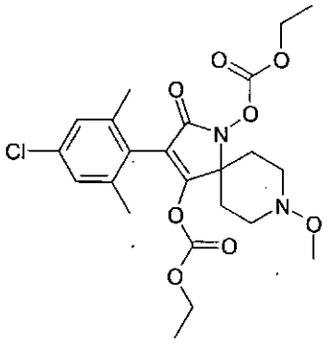
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.91		goma	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1,89 min
P1.92		sólido	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min
P1.93		goma	LC/MS: 497/499 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.94		goma	LC/MS: 487 $(M+H)^+$ R_t = 2,12 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.95		goma	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min
P1.96		goma	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2,00 min
P1.97		goma	LC/MS: 509/511 $(M+H)^+$ R_t = 2,02 min
P1.98		goma	LC/MS: 531/533 $(M+H)^+$ R_t = 1,92 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.99		goma	LC/MS: 487/489 $(M+H)^+$ R_t = 1,93 min
P1.100		goma	LC/MS: 517/519 $(M+H)^+$ R_t = 1,94 min
P1.101		goma	LC/MS: 425/427 $(M+H)^+$ R_t = 1,83 min
P1.102		134–138°C	LC/MS: 499/501 $(M+H)^+$ R_t = 1,90 min
P1.103		goma	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.104		goma	LC/MS: 518 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.105		goma	LC/MS: 501 $(M+H)^+$ R_t = 2,26 min
P1.106		goma	LC/MS: 473 $(M+H)^+$ R_t = 2,15 min
P1.107		goma	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.108		goma	LC/MS: 475 $(M+H)^+$ R_t = 1,94 min
P1.109		goma	LC/MS: 503 $(M+H)^+$ R_t = 2,04 min
P1.110		goma	LC/MS: 479 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P1.111	 EJEMPLO 12	goma	LC/MS: 495 $(M+H)^+$ R_t = 1,74 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.112			
P1.113		goma	LC/MS: 483/485 $(M+H)^+$ R_t = 1,94 min
P1.114		122–125°C	LC/MS: 439/441 $(M+H)^+$ R_t = 1,92 min
P1.115	 EJEMPLO 10, paso 3	goma	LC/MS: 497/499 $(M+H)^+$ R_t = 2,02 min

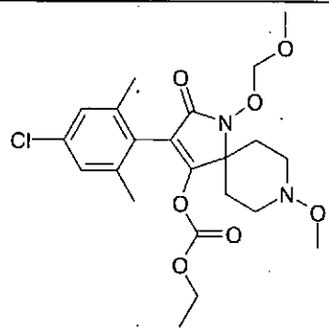
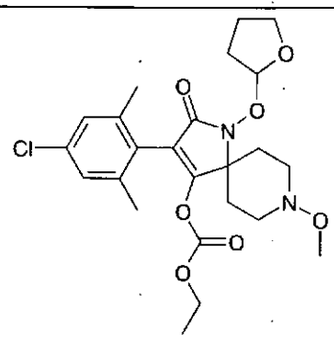
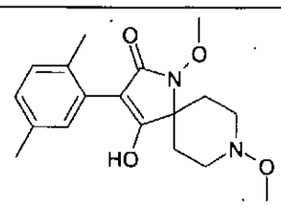
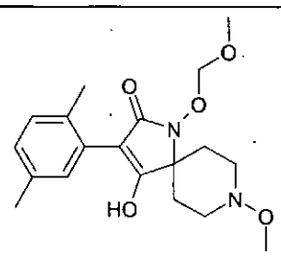
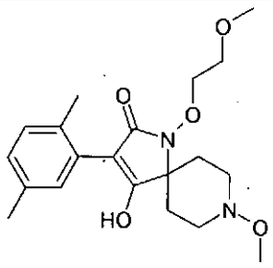
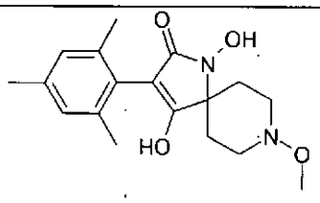
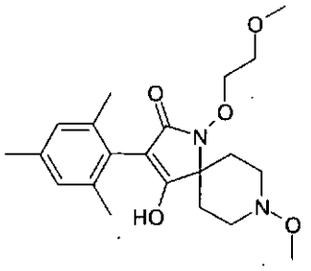
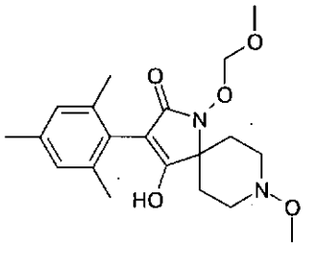
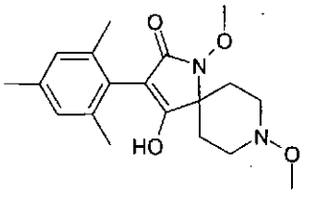
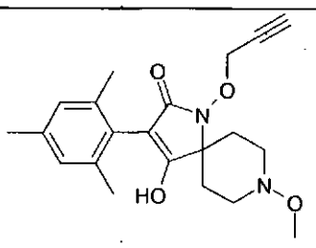
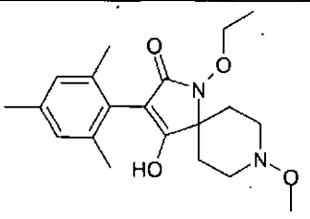
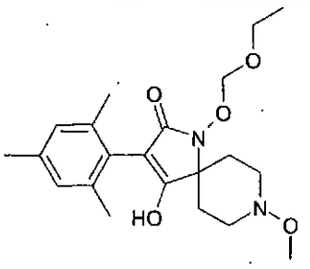
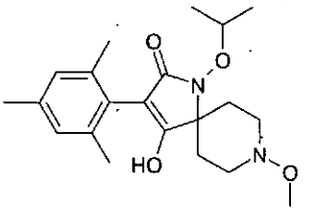
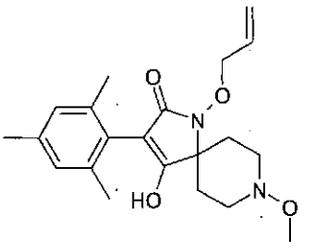
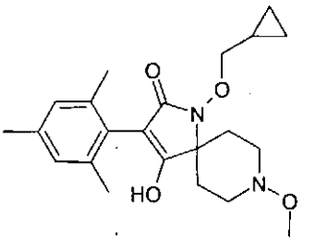
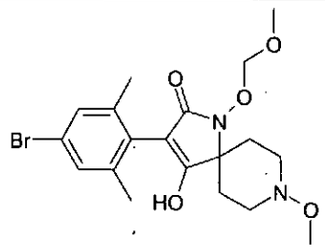
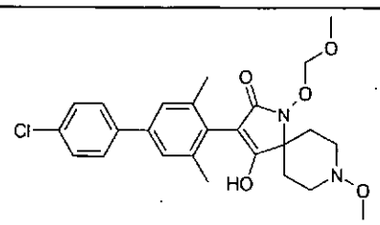
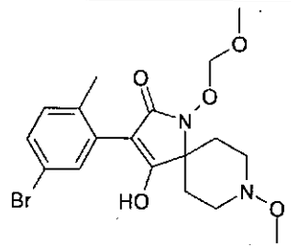
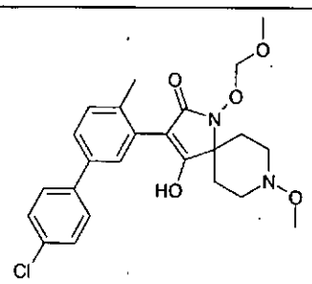
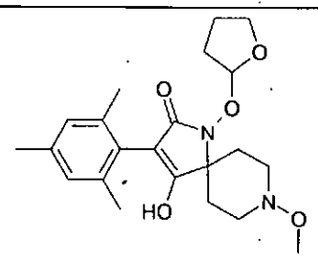
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P1.116		goma	LC/MS: 469/471 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P1.117		goma	LC/MS: 495/497 $(M+H)^+$ R_t = 2,02 min

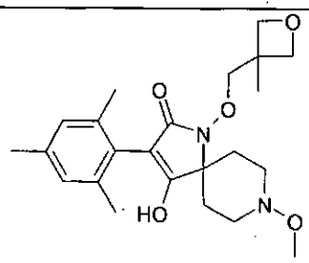
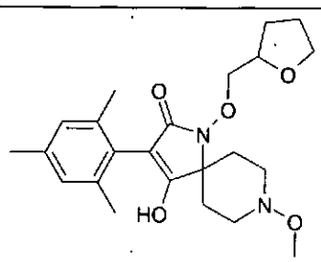
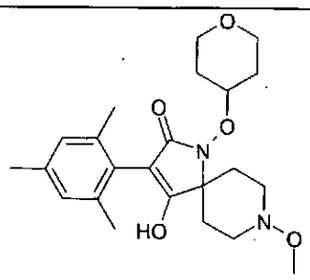
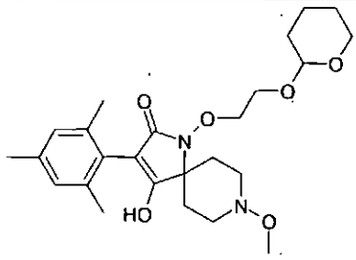
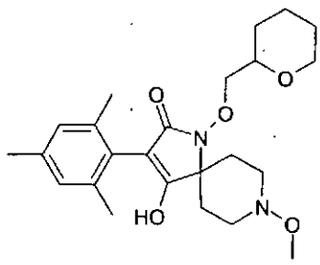
Tabla P2: Datos físicos de los compuestos de fórmula II:

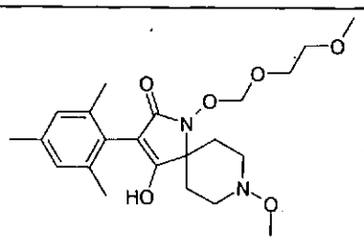
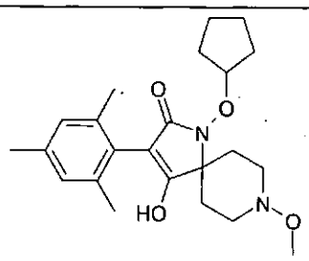
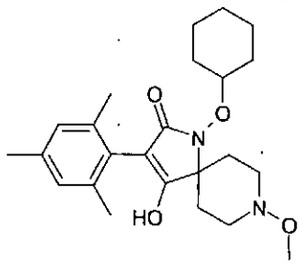
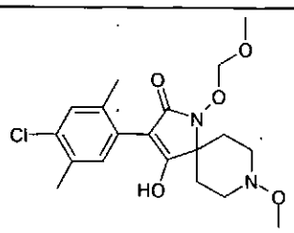
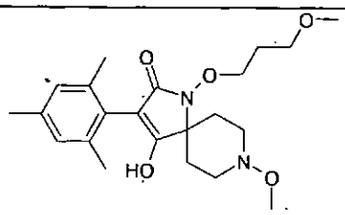
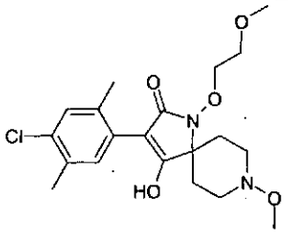
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.1		goma	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1,54 min
P2.2	 EJEMPLO 1, paso 5	136–138°C	LC/MS: 363 $(M+H)^+$ R_t = 1,55 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.3		goma	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1,58 min
P2.4	 EJEMPLO 4	152–154°C	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1,40 min
P2.5		139–142°C	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1,61 min
P2.6		163–165°C	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1,64 min
P2.7		70°C (desc)	LC/MS: 347 $(M+H)^+$ R_t = 1,60 min

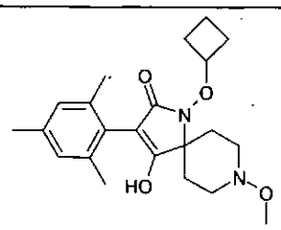
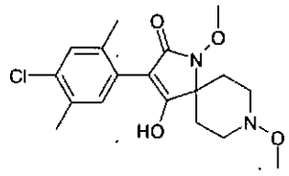
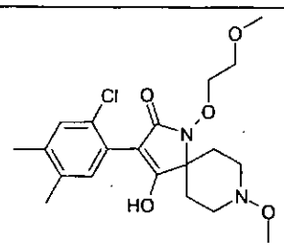
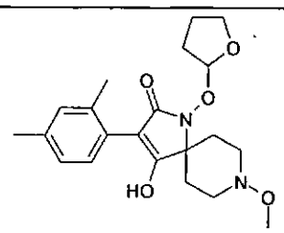
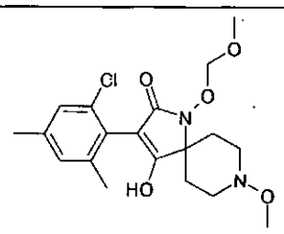
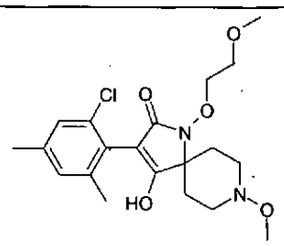
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.8	 EJEMPLO 2, paso 2	167–169°C	LC/MS: 371 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min
P2.9		168–170°C	LC/MS: 361 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P2.10		goma	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1,71 min
P2.11		153–156°C	LC/MS: 375 $(M+H)^+$ R_t = 1,78 min
P2.12		162–164°C	LC/MS: 373 $(M+H)^+$ R_t = 1,73 min
P2.13		150–153°C	LC/MS: 387 $(M+H)^+$ R_t = 1,81 min

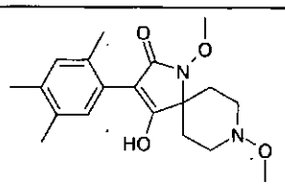
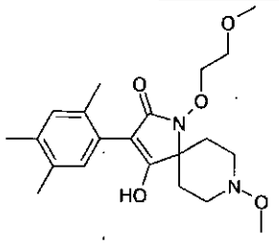
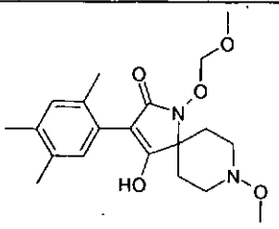
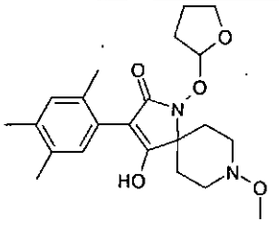
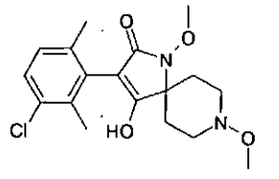
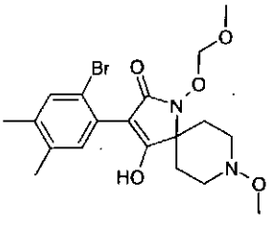
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.14		190–191°C	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P2.15	 EJEMPLO 14	128°C (desc)	LC/MS: 473/475 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P2.16		goma	LC/MS: 427/429 $(M+H)^+$ R_t = 1,63 min
P2.17		68–71°C	LC/MS: 459/461 $(M+H)^+$ R_t = 1,93 min
P2.18	 EJEMPLO 7, paso 2	144–146°C	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min

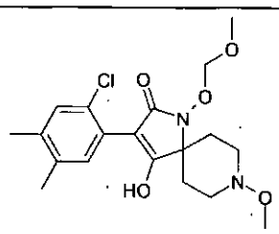
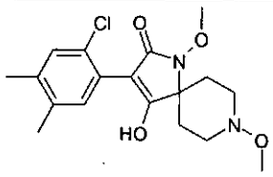
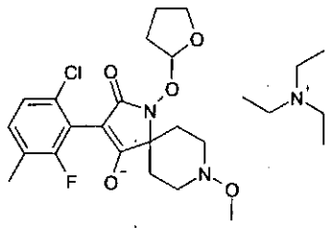
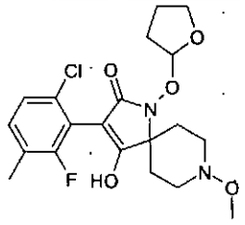
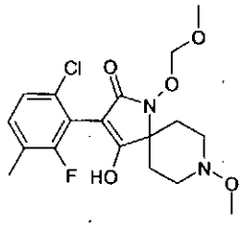
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.19		108–111°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1,68 min
P2.20		goma	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1,72 min
P2.21		124–126°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P2.22		135–137°C	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 1,87 min
P2.23		90–93°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1,81 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.24		98–100°C	LC/MS: 421 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P2.25		144–147°C	LC/MS: 401 $(M+H)^+$ R_t = 1,92 min
P2.26	 EJEMPLO 8, paso 2	115–118°C	LC/MS: 415 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min
P2.27		139–143°C	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P2.28		128–130°C	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1,69 min
P2.29		49–54°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,68 min

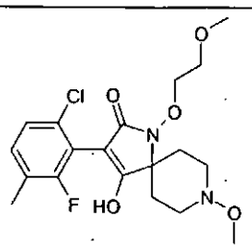
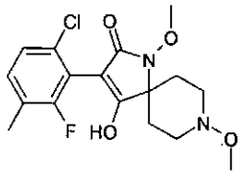
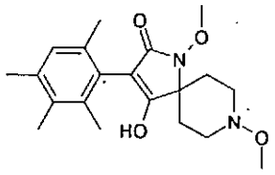
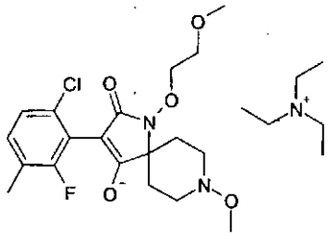
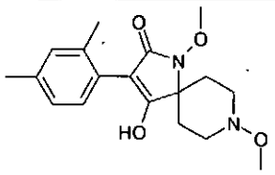
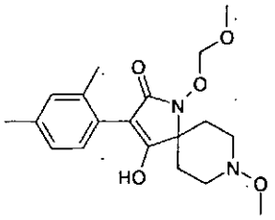
000424

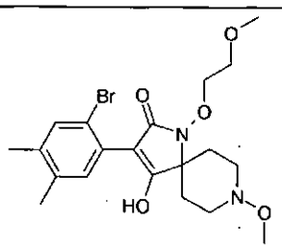
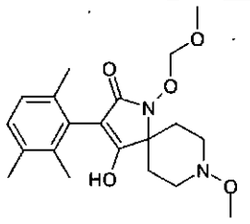
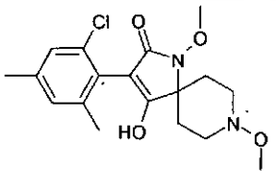
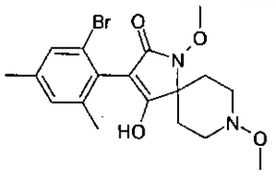
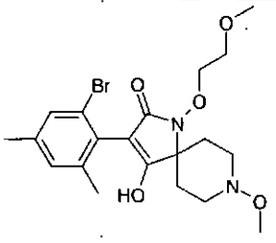
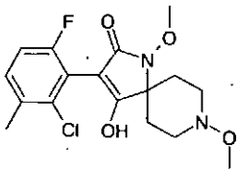
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.30		goma	LC/MS: 387 $(M+H)^+$ R_t = 1,82 min
P2.31		92–95°C	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1,64 min
P2.32		sólido	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min
P2.33		sólido	LC/MS: 389 $(M+H)^+$ R_t = 1,63 min
P2.34		79–82°C	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1,55 min
P2.35		161–163°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,55 min

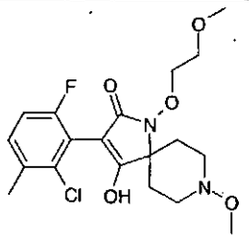
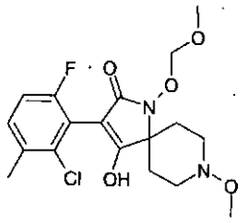
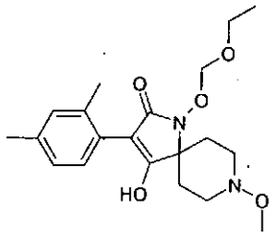
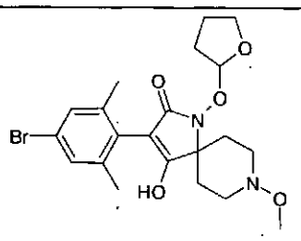
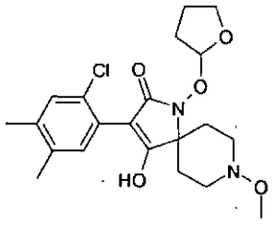
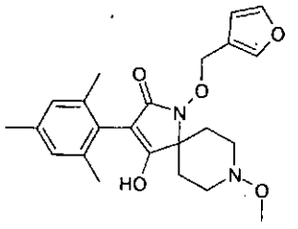
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.36		goma	LC/MS: 347 $(M+H)^+$ R_t = 1,59 min
P2.37		goma	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1,65 min
P2.38		goma	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1,60 min
P2.39		goma	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1,72 min
P2.40		goma	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1,58 min
P2.41		sólido	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1,64 min

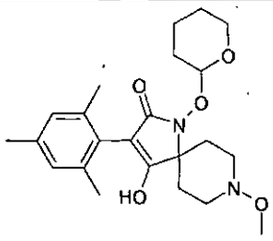
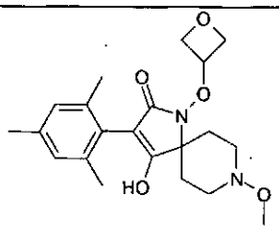
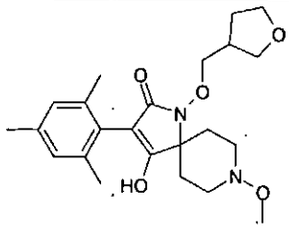
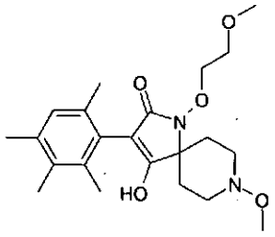
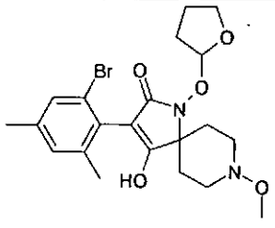
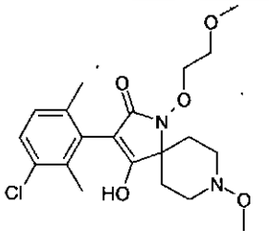
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.42		sólido	LC/MS: 395/397 $(M-H)^-$ R_t = 1,64 min
P2.43		sólido	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1,64 min
P2.44		goma	^{1}H RMN (CD_3OD, señales seleccionadas solamente): 1,29 (t, 9H, $N(CH_2\boldsymbol{CH_3})_3$), 2,23 (d, ^4J(H,F) = 1,9Hz, 3H, mesitilo CH_3), 3,17 (q, 6H, $N(\boldsymbol{CH_2}CH_3)_3$), 3,54 (s, 3H, $NOCH_3$), 5,62 (br m, 1H, tetrahidrofuranilo CH),
P2.45		sólido	LC/MS: 427/429 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P2.46		sólido	LC/MS: 401/403 $(M+H)^+$ R_t = 1,54 min

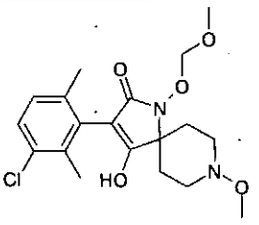
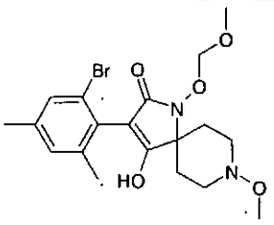
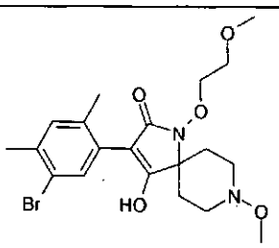
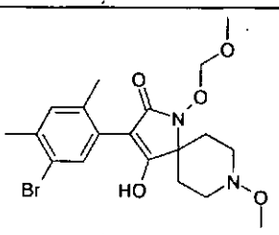
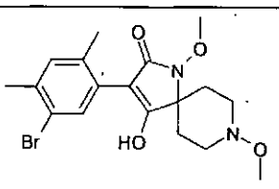
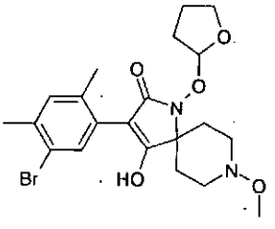
000427

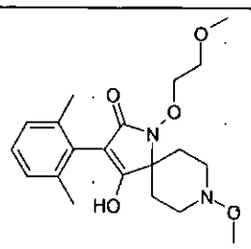
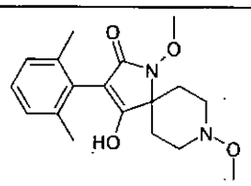
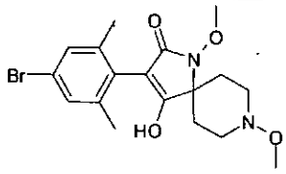
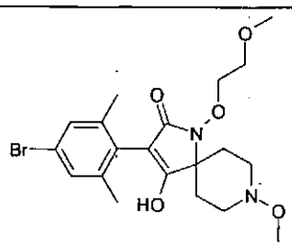
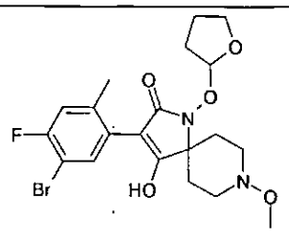
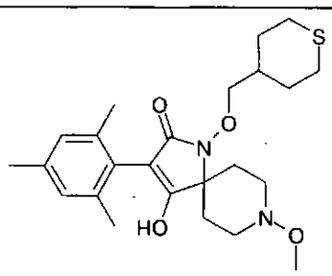
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.47		goma	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1,57 min
P2.48		sólido	LC/MS: 371/373 $(M+H)^+$ R_t = 1,55 min
P2.49		goma	LC/MS: 361 $(M+H)^+$ R_t = 1,63 min
P2.50		goma	^{1}H RMN (CD_3OD, señales seleccionadas solamente): 1,29 (t, 9H, $N(CH_2\boldsymbol{CH_3})_3$), 2,22 (d, $^4J(H,F)$ = 2,2Hz, 3H, mesitilo CH_3), 3,17 (q, 6H, $N(\boldsymbol{CH_2}CH_3)_3$), 3,39 (s, 3H, $CH_2CH_2O\boldsymbol{CH_3}$), 3,54 (s, 3H, $NOCH_3$),
P2.51		polvo	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1,53 min
P2.52		133–136°C	

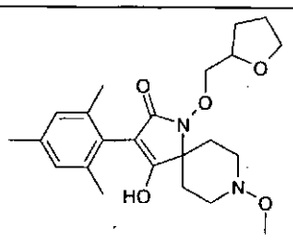
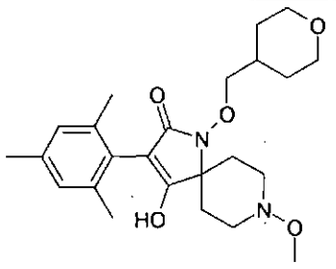
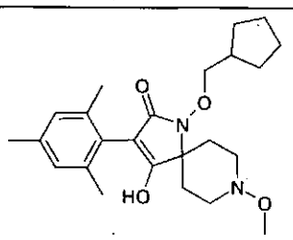
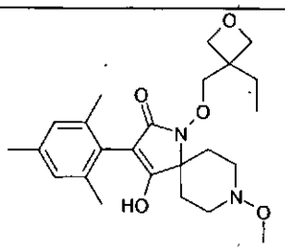
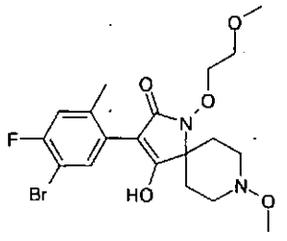
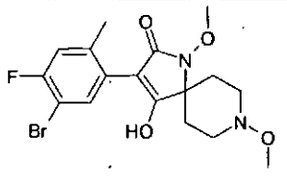
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.53		sólido	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P2.54		goma	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1,57 min
P2.55		176–180°C	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1,55 min
P2.56		185–190°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,56 min
P2.57		148–153°C	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1,60 min
P2.58		83–86°C	LC/MS: 371/373 $(M+H)^+$ R_t = 1,52 min

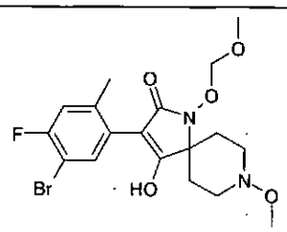
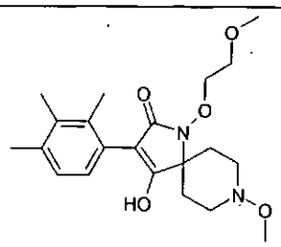
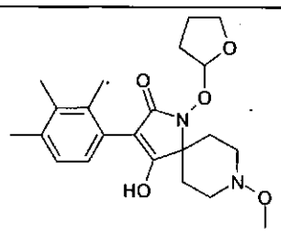
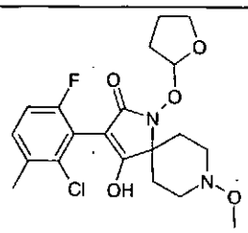
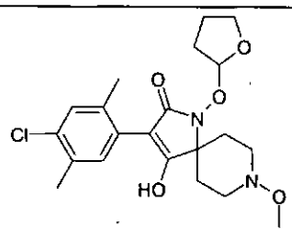
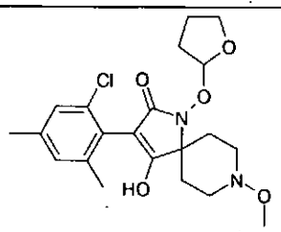
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.59		55–57°C	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1,53 min
P2.60		155–158°C	LC/MS: 401/403 $(M+H)^+$ R_t = 1,51 min
P2.61		polvo	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min
P2.62		91–92°C	LC/MS: 467/469 $(M+H)^+$ R_t = 1,71 min
P2.63		84–85°C	LC/MS: 423/425 $(M+H)^+$ R_t = 1,71 min
P2.64		154–157°C	LC/MS: 413 $(M+H)^+$ R_t = 1,77 min

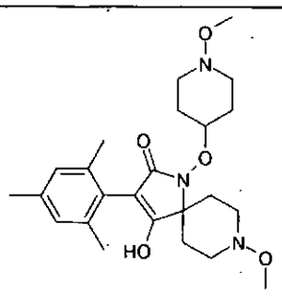
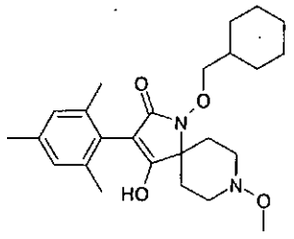
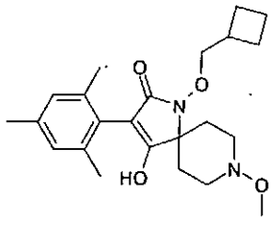
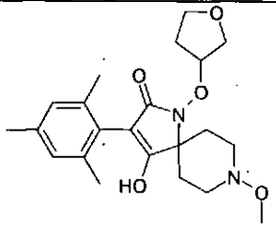
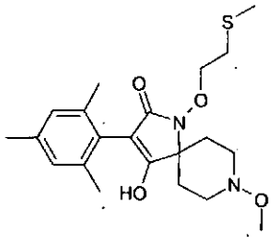
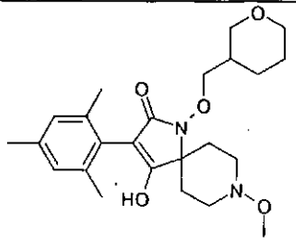
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.65		103–106°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1,77 min
P2.66		88–91°C	LC/MS: 389 $(M+H)^+$ R_t = 1,54 min
P2.67		69–72°C	LC/MS: 417 $(M+H)^+$ R_t = 1,64 min
P2.68		goma	LC/MS: 405 $(M+H)^+$ R_t = 1,65 min
P2.69		goma	LC/MS: 467/469 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min
P2.70		goma	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,61 min

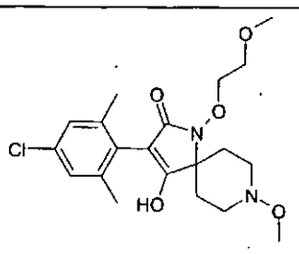
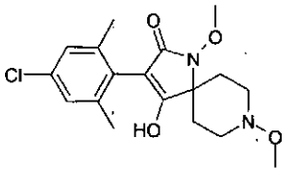
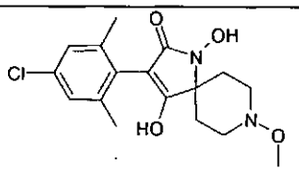
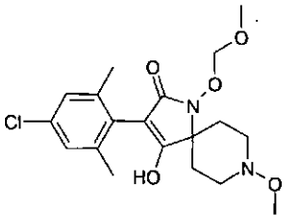
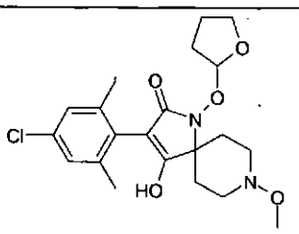
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.71		goma	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1,60 min
P2.72		167–171°C	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1,58 min
P2.73		63–64°C	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1,72 min
P2.74		79–80°C	LC/MS: 441/443 $(M+H)^+$ R_t = 1,70 min
P2.75		86–87°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,69 min
P2.76		96–97°C	LC/MS: 467/469 $(M+H)^+$ R_t = 1,78 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.77		141–144°C	LC/MS: 377 $(M+H)^+$ R_t = 1,49 min
P2.78		153–155°C	LC/MS: 333 $(M+H)^+$ R_t = 1,44 min
P2.79		188–191°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,63 min
P2.80		163–167°C	LC/MS: 455/457 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P2.81		goma	LC/MS: 471/473 $(M+H)^+$ R_t = 1,70 min
P2.82		95–98°C	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 1,89 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.83		155–157°C	LC/MS: 413 $(M+H)^+$ R_t = 1,75 min
P2.84		100–103°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1,70 min
P2.85		74–77°C	LC/MS: 415 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min
P2.86		88–91°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P2.87		71–74°C	LC/MS: 459/461 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min
P2.88		sólido	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1,63 min

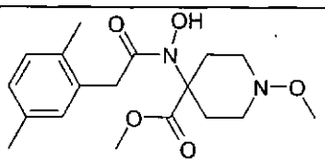
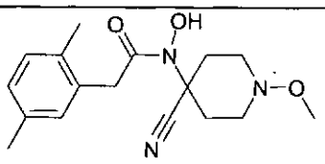
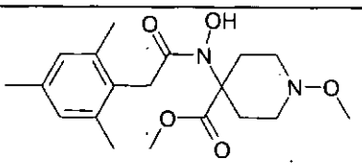
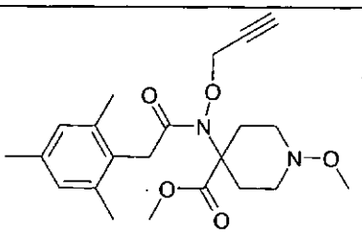
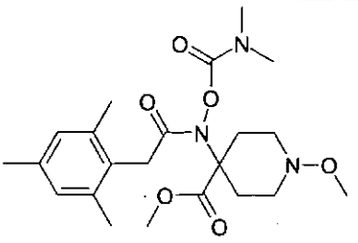
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.89		64–67°C	LC/MS: 445/447 $(M+H)^+$ R_t = 1,65 min
P2.90		sólido	LC/MS: 391 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P2.91		espuma	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1,68 min
P2.92		86–89°C	LC/MS: 427/429 $(M+H)^+$ R_t = 1,61 min
P2.93		88–91°C	LC/MS: 423/425 $(M+H)^+$ R_t = 1,74 min
P2.94		84–88°C	LC/MS: 423/425 $(M+H)^+$ R_t = 1,63 min

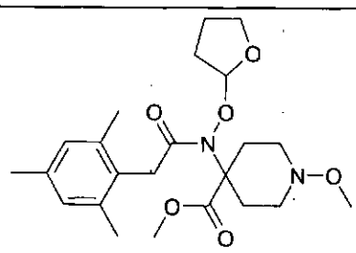
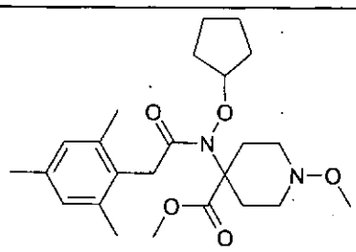
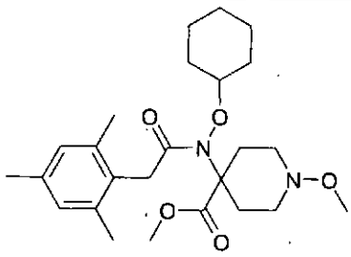
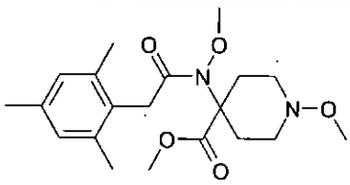
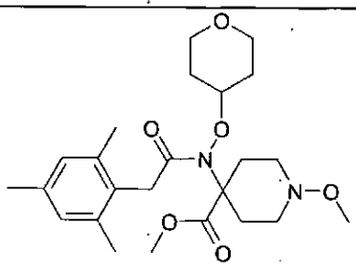
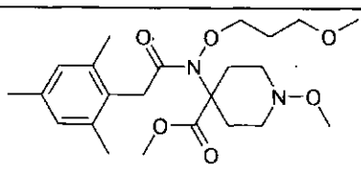
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.95		sólido	LC/MS: 446 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P2.96		169–172°C	LC/MS: 429 $(M+H)^+$ R_t = 2,05 min
P2.97		113–115°C	LC/MS: 401 $(M+H)^+$ R_t = 1,89 min
P2.98		135–138°C	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1,57 min
P2.99		113–115°C	LC/MS: 407 $(M+H)^+$ R_t = 1,72 min
P2.100		98–101°C	LC/MS: 431 $(M+H)^+$ R_t = 1,72 min

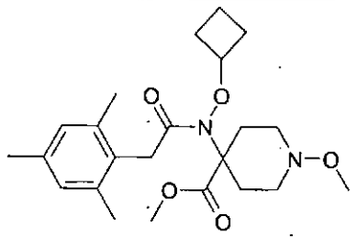
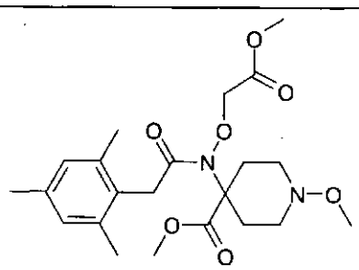
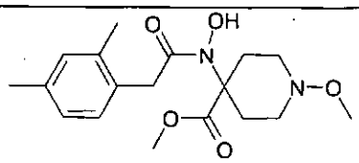
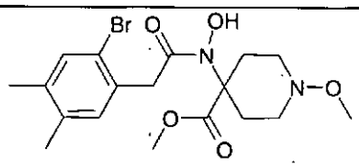
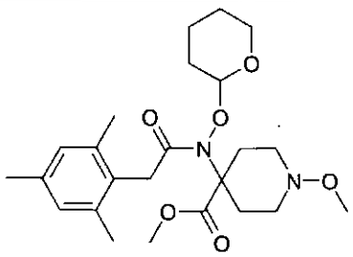
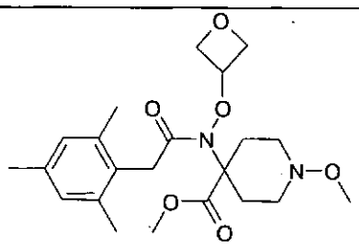
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P2.101		161–164°C	LC/MS: 411/413 $(M+H)^+$ R_t = 1,63 min
P2.102		88–92°C	LC/MS: 367/369 $(M+H)^+$ R_t = 1,58 min
P2.103	 EJEMPLO 10, paso 2	sólido	LC/MS: 353/355 $(M+H)^+$ R_t = 1,37 min
P2.104		176–178°C	LC/MS: 397/399 $(M+H)^+$ R_t = 1,64 min
P2.105		137–139°C	LC/MS: 421/423 $(M-H)^-$ R_t = 1,69 min

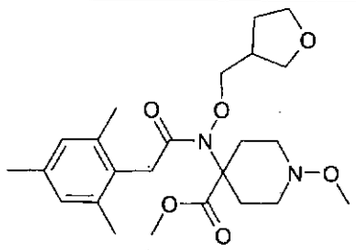
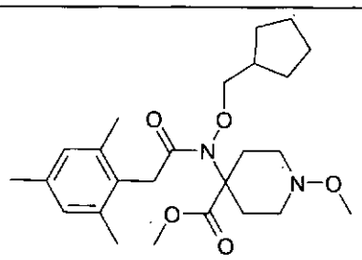
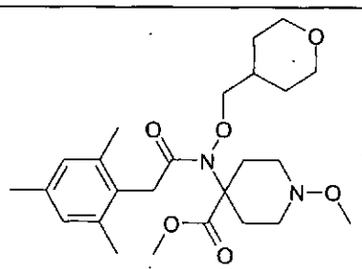
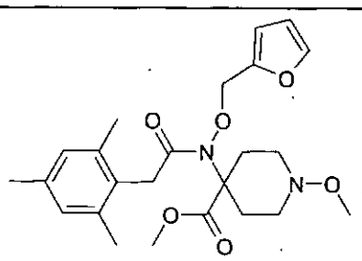
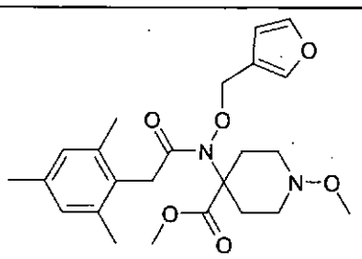
Los compuestos intermedios de la fórmula IV o X de la Tabla P3 pueden prepararse por procedimientos análogos.

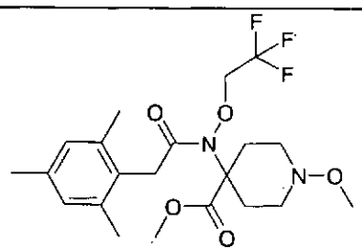
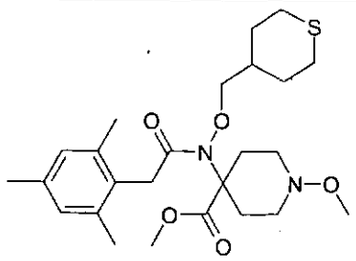
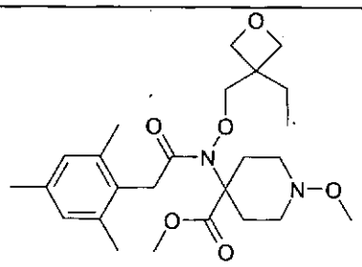
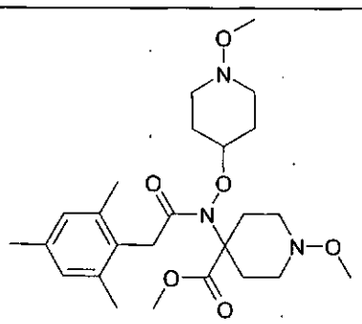
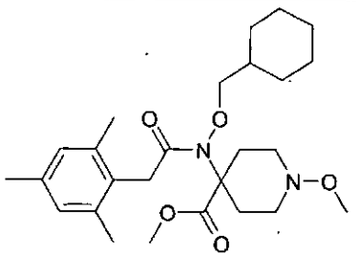
Tabla P3: Datos físicos de los compuestos intermedios de fórmula IV o X:

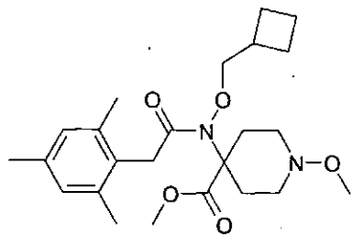
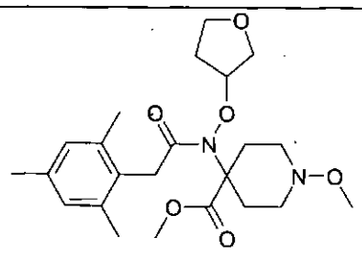
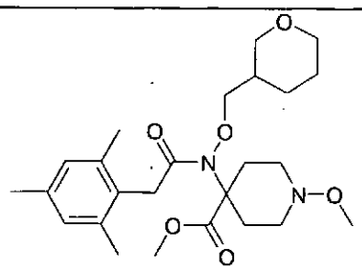
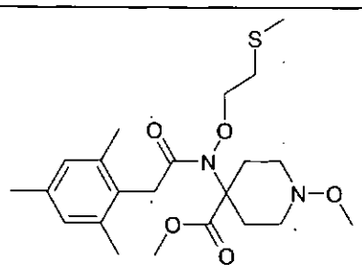
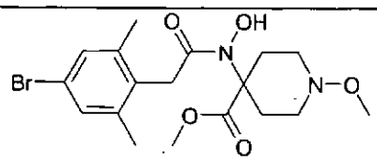
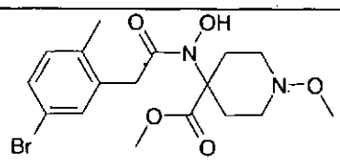
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.1	 EJEMPLO 1, paso 4 EJEMPLO 6, paso 2	140–142°C	LC/MS: 351 $(M+H)^+$ R_t = 1,59 min
P3.2	 EJEMPLO 6, paso 1	153–156°C	LC/MS: 318 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min
P3.3		199–200°C	LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1,68 min
P3.4	 EJEMPLO 2, paso 1	108–110°C	LC/MS: 403 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min
P3.5		goma	LC/MS: 436 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.6	 EJEMPLO 7, paso 1	107–109°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P3.7		goma	LC/MS: 433 $(M+H)^+$ R_t = 2,19 min
P3.8	 EJEMPLO 8, paso 1	goma	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2,23 min
P3.9		goma	LC/MS: 379 $(M+H)^+$ R_t = 1,89 min
P3.10		goma	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,89 min
P3.11		55–57°C	LC/MS: 437 $(M+H)^+$ R_t = 1,95 min

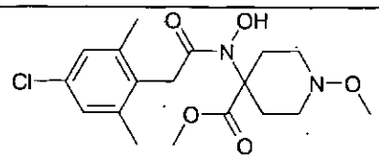
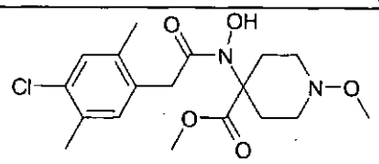
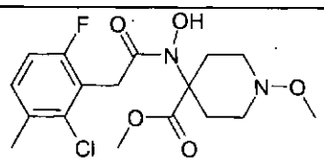
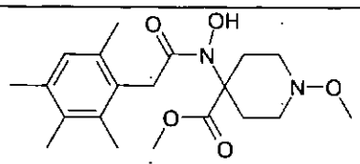
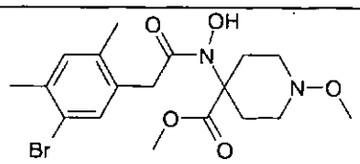
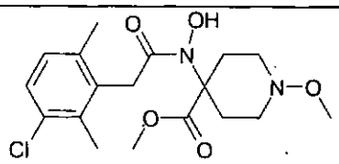
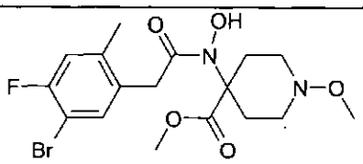
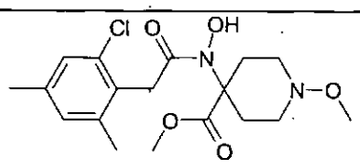
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.12		goma	LC/MS: 419 $(M+H)^+$ R_t = 2,09 min
P3.13		goma	LC/MS: 437 $(M+H)^+$ R_t = 1,86 min
P3.14		sólido	LC/MS: 351 $(M+H)^+$ R_t = 1,59 min
P3.15		166–167°C	LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1,71 min
P3.16		goma	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 2,08 min
P3.17		goma	LC/MS: 421 $(M+H)^+$ R_t = 1,80 min

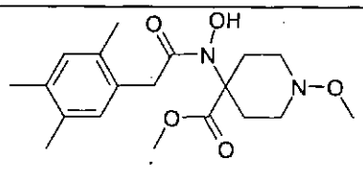
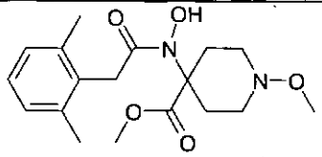
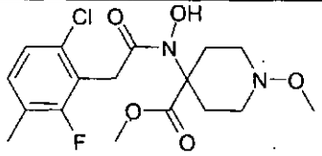
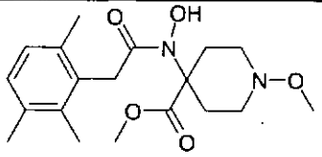
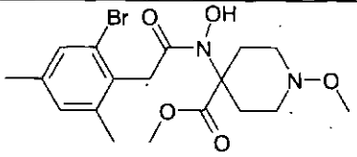
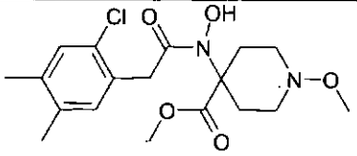
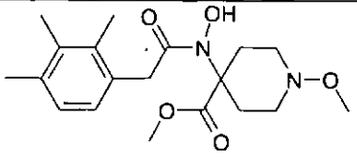
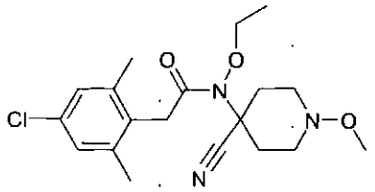
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.18		goma	LC/MS: 449 $(M+H)^+$ R_t = 1,88 min
P3.19		goma	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2,25 min
P3.20		goma	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1,93 min
P3.21		goma	LC/MS: 445 $(M+H)^+$ R_t = 2,05 min
P3.22		goma	LC/MS: 445 $(M+H)^+$ R_t = 1,98 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.23		goma	LC/MS: 447 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P3.24		goma	LC/MS: 479 $(M+H)^+$ R_t = 2,10 min
P3.25		goma	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 1,94 min
P3.26	 EJEMPLO 9, paso 2	goma	LC/MS: 478 $(M+H)^+$ R_t = 1,97 min
P3.27		goma	LC/MS: 461 $(M+H)^+$ R_t = 2,31 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.28		goma	LC/MS: 433 $(M+H)^+$ R_t = 2,17 min
P3.29		115–117°C	LC/MS: 435 $(M+H)^+$ R_t = 1,85 min
P3.30		goma	LC/MS: 463 $(M+H)^+$ R_t = 2,01 min
P3.31		goma	LC/MS: 439 $(M+H)^+$ R_t = 2,03 min
P3.32		sólido	LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1,73 min
P3.33		sólido	LC/MS: 415/417 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min

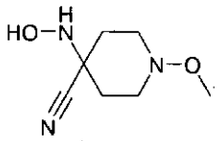
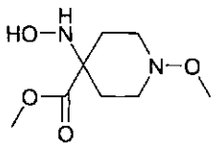
000443

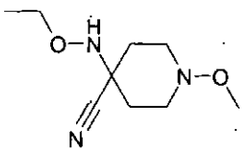
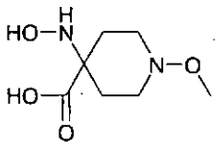
Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.34	 EJEMPLO 10, paso 1	228–231°C	LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1,71 min
P3.35			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1,86 min
P3.36			LC/MS: 389/391 $(M+H)^+$ R_t = 1,59 min
P3.37			LC/MS: 379 $(M+H)^+$ R_t = 1,91 min
P3.38		162–163°C	LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1,76 min
P3.39			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P3.40			LC/MS: 433/435 $(M+H)^+$ R_t = 1,69 min
P3.41			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1,69 min

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P3.42			LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P3.43			LC/MS: 351 $(M+H)^+$ R_t = 1,55 min
P3.44			LC/MS: 389/391 $(M+H)^+$ R_t = 1,62 min
P3.45			LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1,66 min
P3.46			LC/MS: 429/431 $(M+H)^+$ R_t = 1,67 min
P3.47			LC/MS: 385/387 $(M+H)^+$ R_t = 1,71 min
P3.48			LC/MS: 365 $(M+H)^+$ R_t = 1,65 min
P3.49 EJEMPLO 13, paso 3		100–103°C	LC/MS: 380/382 $(M+H)^+$ R_t = 1,99 min

Los compuestos intermedios de la fórmula V o VII de la Tabla P4 pueden prepararse por procedimientos análogos.

Tabla P4: Datos físicos de compuestos intermedios de fórmula V o VII o XI:

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P4.1	 EJEMPLO 1, paso 2	130–131°C	^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,55–2,35 (señales br, 4H total), 2,60–3,45 (señales br, 4H total), 3,52 (s, 3H), 5,19 (br s, 1H) , 5,42 (br s, 1H), IR (CN): □ 2227,8 cm^{-1}, LC/MS (ES+): 172 $(M+H)^+$; R_t = 0,31 min.
P4.2	 EJEMPLO 1, paso 3	Aceite	^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,50–2,40 (señales br, 4H total), 2,76 (br m, 2H), 3,01–3,32 (br m, 2H), 3,52 (s, 3H), 3,76 (s, 3H), 5,58 (br s, 2H), IR (COOMe): □ 1731,3 cm^{-1}, LC/MS (ES+): 205 $(M+H)^+$; R_t = 0,31 min.

Compuesto No.	Estructuras	Punto de Fusión	EM/RMN
P4.3	 EJEMPLO 13, paso 2	Aceite	^{1}H RMN ($CDCl_3$): 1,19 (t, 3H), 1,59–2,29 (señales br, 4H total), 2,64–3,43 (señales br, 4H total), 3,52 (s, 3H), 3,80 (q, 2H), 5,37 (br s, 1H), IR (CN): □ 2235,3 cm^{-1}, LC/MS (ES+): 200 $(M+H)^+$; R_t = 1,21 min.
P4.4	 ejemplo 15, paso 1	180°C	1H RMN (CD_3OD): 1,54–2,29 (señales br, 4H total), 2,82 (br m, 2H), 3,07–3,26 (señales br, total 2H), 3,49 (s, 3H), LC/MS (ES+): 191 $(M+H)^+$; Rt = 0,22 min.

EJEMPLOS DE FORMULACIÓN (% = por ciento en peso)

Ejemplo F1: Concentrados en emulsión	a)	b)	c)
Ingrediente activo	25 %	40 %	50 %
Dodecilbencensulfonato cálcico	5 %	8 %	6 %
Polietilenglicol éter de aceite de ricino (36 mol de EO)	5 %	–	–
Tributilfenoxipolietilenglicol éter (30 mol de EO)	–	12 %	4 %
Ciclohexanona	–	15 %	20 %

000148

Mezcla de xileno	65 %	25 %	20 %

Pueden prepararse emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de dichos concentrados mediante dilución con agua.

Ejemplo F2: Soluciones	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	80 %	10 %	5 %	95 %
Etilenglicol monometiléter	20 %	–	–	–
Polietilenglicol PM 400	–	70 %	–	–
N–Metilpirrolid–2–ona	–	20 %	–	–
Aceite de coco epoxidado	–	–	1 %	5 %
Éter de petróleo (rango de ebullición: 160–190°)	–	–		94 %

Las soluciones son adecuadas para utilizar en la forma de microgotas.

Ejemplo F3: Gránulos	a)	b)	c)	d)
Ingrediente activo	5 %	10 %	8 %	21 %
Caolín	94 %	–	79 %	54 %
Sílice altamente disperso	1 %	–	13 %	7 %
Atapulgita	–	90 %	–	18 %

El ingrediente activo es disuelto en diclorometano, la solución se pulveriza sobre el o los portadores, y el solvente es posteriormente evaporado in vacuo.

Ejemplo F4: Polvillos	a)	b)
Ingrediente activo	2 %	5 %
Sílice altamente dispersado	1 %	5 %
Talco	97 %	–
Caolín	–	90 %

Se obtienen polvillos listos para utilizar mezclando íntimamente los portadores y el ingrediente activo.

030149

Ejemplo F5: Polvos humectables	a)	b)	c)
Ingrediente activo	25 %	50 %	75 %
Lignosulfonato sódico	5 %	5 %	–
Laurilsulfato sódico	3 %	–	5 %
Diisobutilnaftalensulfonato sódico	–	6 %	10 %
Octilfenoxipolietilenglicol éter (7–8 mol de EO)	–	2 %	–
Sílice altamente dispersado	5 %	10 %	10 %
Caolín	62 %	27 %	–

El ingrediente activo se mezcla con los aditivos y la mezcla se tritura vigorosamente en un molino adecuado. Esto proporciona polvos humectables, los cuales pueden diluirse con agua para proporcionar suspensiones de cualquier concentración deseada.

Ejemplo F6: Gránulos de extrusora	
Ingrediente activo	10 %
Lignosulfonato sódico	2 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Caolín	87 %

El ingrediente activo se mezcla con los aditivos, y la mezcla se muele, se humedece con agua, se extruye, se granula y se seca en una corriente de aire.

Ejemplo F7: Gránulos recubiertos	
Ingrediente activo	3 %
Polietilenglicol (PM 200)	3 %
Caolín	94 %

En una mezcladora, el ingrediente activo finamente molido se aplica uniformemente al caolín, el cual ha sido humedecido con el polietilenglicol. Esto proporciona gránulos recubiertos libres de polvo.

Ejemplo F8a: Concentrado en suspensión	
Ingrediente activo	40 %
Etilenglicol	10 %
Nonilfenoxipolietilenglicol éter (15 mol de EO)	6 %
Lignosulfonato sódico	10 %
Carboximetilcelulosa	1 %
37 % solución acuosa de formaldehído	0,2 %
Aceite de silicona (75% emulsión acuosa)	0,8 %
Agua	32 %

Ejemplo F8b: Concentrado en suspensión	
Ingrediente activo	10%
Ácido naftalensulfónico, sal sódica condensada con formaldehído	2%
Solución de un copolímero de injerto acrílico en agua y propilenglicol	8%
Emulsión antiespuma de silicona	0,5%
DL–propanodiol–(1,2)	3%
Heteropolisacárido	0,5%
1,2–Benzisotiazol–3–ona	0,2%
Agua	75,8%

El ingrediente activo finamente molido se mezcla íntimamente con los aditivos. Pueden prepararse suspensiones de cualquier concentración deseada a partir del concentrado en suspensión así resultante mediante dilución con agua.

Ejemplo F9: Polvos para tratamiento de semilla en seco	a)	b)	c)
ingrediente activo	25 %	50 %	75 %
aceite mineral liviano	5 %	5 %	5 %
ácido silícico altamente dispersado	5 %	5 %	–

000451

Caolín	65 %	40 %	–
Talco	–		20 %

El ingrediente activo se mezcla vigorosamente con los adyuvantes y la mezcla se muele vigorosamente en un molino adecuado, proporcionando polvos que pueden utilizarse directamente para el tratamiento de la semilla.

Ejemplo F10: Concentrado fluible para tratamiento de semilla

ingrediente activo	40 %
propilenglicol	5 %
copolímero butanol PO/EO	2 %
triestirenfenol con 10–20 moles EO	2 %
1,2–benzisotiazolin–3–ona (en la forma de una solución al 20% en agua)	0,5 %
sal de calcio de pigmento monoazoico	5 %
Aceite de silicona (en la forma de una emulsión al 75% en agua)	0,2 %
Agua	45,3 %

El ingrediente activo finalmente molido se mezcla íntimamente con los adyuvantes, proporcionando un concentrado en suspensión del cual pueden obtenerse suspensiones de cualquier dilución deseada por dilución con agua. Utilizando ese tipo de diluciones, pueden tratarse y protegerse plantas vivientes así como también material vegetal de propagación contra infestación por microorganismos, por fumigación, vertido o inmersión.

Ejemplo F11a: Concentrado en suspensión con base oleosa (en base a aceite vegetal)

Ingrediente activo	10%
Triestirilfenol con 16 moles EO	10%
Copolímero de bloques de ácido polihidroxisteárico y polialquilenglicoles	2%
AEROSIL 200	1%

Éster metílico de aceite de semilla de colza	12%
Ácido oleico	65%

Ejemplo F11b: Concentrado en suspensión con base oleosa (a base de aceite mineral)

Ingrediente activo	10%
Alcoholes etoxilados, C16–18 y C18–insat.	5%
Sal de Ca de ácido dodecil–bencensulfónico lineal	2,5%
2–Pirrolidinona, 1–etenilhexadecil–, homopolímero	1%
Arcilla organofílica	1%
Mezcla de petróleo	80,5%

El ingrediente activo finamente molido se mezcla íntimamente con los aditivos. Pueden prepararse suspensiones de cualquier concentración deseada a partir del concentrado en suspensión así obtenido mediante dilución con agua.

Preferentemente, el término "ingrediente activo" empleado anteriormente se refiere a uno de los compuestos seleccionados de las Tablas 1 a 102 mostrados anteriormente. También se refiere a mezclas del compuesto de fórmula I, en particular a un compuesto seleccionado de dichas Tablas 1 a 102, con otros insecticidas, fungicidas, herbicidas, antídotos, adyuvantes y similares, mezclas que son específicamente descritas en lo que antecede.

EJEMPLOS BIOLÓGICOS

Estos ejemplos ilustran las propiedades pesticidas/ insecticidas de los compuestos de fórmula I.

Ejemplo B1: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del duraznero) (población mixta, actividad alimenticia/de contacto residual, preventiva)

Se colocan discos de hojas de girasol sobre agar en una placa de microtítulo de 24 pocillos y se pulveriza con soluciones de ensayo. Después del secado, los discos de hojas son infestados con una población de áfidos de edades mixtas. Luego de un período de incubación de 6 días, se controlan las muestras para determinar la mortalidad y los efectos especiales (por ej., fitotoxicidad).

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas P1 y P2 que aparecen con anterioridad muestran buena actividad. En particular los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.12, P1.15, P1.18, P1.19, P1.20, P1.22, P1.24, P1.26, P1.27, P1.29, P1.30, P1.33, P1.34, P1.35, P1.36, P1.37, P1.38, P1.39, P1.44, P1.45, P1.47, P1.48, P1.49, P1.50, P1.54, P1.55, P1.56, P1.57, P1.59, P1.60, P1.62, P1.63, P1.66, P1.67, P1.68, P1.69, P1.70, P1.73, P1.74, P1.81, P1.82, P1.88, P1.89, P1.103, P1.106, P1.107, P1.108, P1.109, P2.1, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.12, P2.13, P2.14, P2.17, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.25, P2.28, P2.30, P2.31, P2.33, P2.34, P2.35, P2.36, P2.37, P2.38, P2.40, P2.41, P2.51, P2.52, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57, P2.61, P2.64, P2.65, P2.66, P2.67, P2.69, P2.70, P2.72, P2.74, P2.77, P2.78, P2.80, P2.83, P2.84, P2.85, P2.86, P2.92, P2.93, P2.94, P2.97, P2.98 y P2.100 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B2: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del duraznero) (población mixta, actividad sistémica/alimenticia, curativa)

Raíces de plántulas de alverja, infestadas con una población de áfidos de edades mixtas, se colocan directamente en las soluciones de ensayo. 6 días posteriores a la introducción, se controlan las muestras para determinar la mortalidad y los efectos especiales sobre la planta.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas P1 y P2 que aparecen en lo que antecede muestran buena actividad. En particular los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.12, P1.14, P1.15, P1.16, P1.17, P1.18, P1.19, P1.23, P1.24, P1.26, P1.27, P1.29, P1.35, P1.41, P1.42, P1.43, P1.44, P1.45, P1.46, P1.47, P1.48, P1.49, P1.50, P1.52, P1.53, P1.55, P1.56, P1.57, P1.59, P1.60, P1.62, P1.63, P1.64, P1.65, P1.66, P1.67, P1.68, P1.69, P1.70, P1.73, P1.74, P1.76, P1.77, P1.78, P1.79, P1.81, P1.82, P1.83, P1.84, P1.88, P1.89, P1.102, P1.104, P1.106, P1.107, P1.108, P1.109, P2.1, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.11, P2.12, P2.13, P2.14, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.25, P2.27, P2.28, P2.30, P2.32, P2.33, P2.34, P2.35, P2.40, P2.41, P2.44, P2.45, P2.46, P2.48, P2.49, P2.51, P2.52, P2.53, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57, P2.58,

000454

P2.59, P2.61, P2.62, P2.64, P2.65, P2.66, P2.67, P2.69, P2.70, P2.71, P2.72, P2.77, P2.78, P2.79, P2.80, P2.83, P2.84, P2.85, P2.92, P2.94, P2.95, P2.97, P2.98, P2.99 y P2.100 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B3: Actividad contra *Thrips tabaci* (Trips de la cebolla)
(población mixta, actividad alimenticia/de contacto residual, preventiva)

Se colocan discos de hojas de girasol sobre agar en una placa de microtítulo de 24 pocillos y se pulveriza con soluciones de ensayo. Después del secado, los discos de hojas son infestados con una población de trips de edades mixtas. Luego de un período de incubación de 6 días, se controlan las muestras para determinar la mortalidad y los efectos especiales (por ej., fitotoxicidad).

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas P1 y P2 que aparecen en lo que antecede muestran buena actividad. En particular los compuestos P1.8, P1.9, P1.11, P1.12, P1.47, P1.49, P1.62, P1.74, P1.81, P2.6, P2.7, P2.10, P2.13, P2.14, P2.18, P2.34, P2.51, P2.62, P2.67, P2.77 y P2.84 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B4: Actividad contra *Tetranychus urticae* (araña de dos manchas)
(población mixta, actividad alimenticia/de contacto residual, preventiva)

Discos de hojas de haba en placas de microtítulo de 24 pocillos se pulverizan con soluciones del ensayo. Después del secado, los discos de hojas son infestados con poblaciones de arañas de edades mixtas. 8 Días más tarde, los discos son controlados para determinar la mortalidad de los huevos, la mortalidad larvaria y la mortalidad en adultos.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas P1 y P2 que aparecen en lo que antecede muestran buena actividad. En particular los compuestos P1.4, P1.6, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.16, P1.17, P1.18, P1.21, P1.22, P1.24, P1.25, P1.26, P1.27, P1.28, P1.29, P1.43, P1.44, P1.45, P1.47, P1.48, P1.49, P1.54, P1.56, P1.59, P1.60, P1.69, P1.74, P1.76, P1.77, P1.78, P1.80, P1.81, P1.82, P1.83, P1.84, P1.87, P1.88, P1.104, P1.105, P1.106, P1.109, P2.4, P2.5, P2.8, P2.11, P2.12, P2.13, P2.14, P2.17, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.24, P2.25, P2.26, P2.30, P2.31, P2.34, P2.35, P2.45, P2.48, P2.55,

000455

P2.56, P2.57, P2.58, P2.64, P2.65, P2.67, P2.69, P2.76, P2.79, P2.83, P2.85, P2.86, P2.94, P2.97 y P2.100 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B5: Actividad contra *Plutella xylostella* (polilla "diamond back") (larvicida, actividad de contacto residual/ por alimentación, preventiva)

Se trata una placa de microtítulo de 24 pocillos (MTP, siglas correspondientes a "24–well microtiter plate") con dieta artificial con soluciones del ensayo por pipeteo. Después del secado, Las placas MTP son infestadas con larvas (L2)(10–15 por pocillo). Luego de un período de incubación de 5 días, las muestras son controladas para determinar la mortalidad larvaria, antialimentario y regulación del crecimiento.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas P1 y P2 que aparecen en lo que antecede muestran buena actividad. En particular los compuestos P1.2, P1.7, P1.8, P1.9, P1.11, P1.19, P1.74, P2.2, P2.4, P2.6 y P2.63 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B6: Actividad contra *Frankliniella occidentalis* (trips de las flores)

Discos de hojas de haba sobre agar en platos petri o plantas de habas en una cámara de pulverización se tratan con soluciones diluidas del ensayo. Después del secado, los discos de hojas se cortan y se colocan en tazas de plástico sobre la superficie de una capa de agar y se infestan con población mixta. 6 Días (discos de hojas) o 14 días (plantas) después de la infestación, se controlan las muestras para determinar la reducción de la población tratada y comparado con la población no tratada.

En este ensayo, los compuestos P1.9, P1.10, P1.14, P1.15, P1.18, P1.27, P1.45, P1.60, P2.6, P2.9, P2.10, P2.11, P2.12, P2.13, P2.30, P2.54, P2.55 y P2.56 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B7: Actividad contra *Bemisia tabaci* (mosca blanca del tabaco) (larvicida, contacto/alimentación)

Plantas de habas son infestadas con 20–30 adultos que fueron retirados después de un período de oviposición de 4 días. Después de otros 7 días, las

plantas de habas con ninfas incubadas (N–2) se tratan (2 réplicas) con las soluciones del ensayo en una cámara de pulverización. Tres semanas más tarde, se controlan las muestras para determinar la cantidad de adultos emergentes. Se calculó la eficacia comparando la cantidad de adultos emergentes en las muestras tratadas y las no tratadas.

En este ensayo, los compuestos P1.2, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.17, P1.18, P1.48, P1.78, P1.82, P2.2, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.12, P2.14, P2.18 y P2.64 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 200ppm.

Ejemplo B8: Actividad contra *Nilaparvata lugens* (saltamontes marrón del arroz) (larvicida, alimentación/contacto)

Se tratan plántulas de arroz con las soluciones diluidas del ensayo en una cámara de pulverización. Después del secado, son infestadas con 20 ninfas N_3 (2 réplicas). 6–12 Días después del tratamiento, se controlan las muestras para determinar la mortalidad, regulación del crecimiento y los efectos sobre la generación F_1.

En este ensayo, los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.12, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.24, P1.25, P1.26, P1.27, P1.28, P1.45, P1.48, P1.49, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.88, P1.107, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.13, P2.14, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.25, P2.34, P2.55, P2.57 y P2.64 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B9: Actividad contra *Aphis craccivora* (áfido del caupi)
(población mixta, contacto/alimentación)

Plántulas de alverja, infestadas con una población de áfidos de edades mixtas, se tratan (2 réplicas) con soluciones diluidas del ensayo en una cámara de pulverización. 6 Días después del tratamiento, se controlan las muestras para determinar la mortalidad.

En este ensayo, los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.8, P1.15, P1.17, P1.26, P1.27, P1.48, P1.60, P1.82, P2.6, P2.7, P2.9, P2.13, P2.24 y P2.34 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400ppm.

Ejemplo B10: Actividad contra *Aphis craccivora* (áfido del caupi) (población mixta, sistémica/alimentación)

Raíces de plántulas de alverja, infestadas con una población de áfidos de edades mixtas, se colocan (2 réplicas) directamente en la solución de ensayo. 6 Días más tarde, se controlan las muestras para determinar la mortalidad.

En este ensayo, los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.17, P1.23, P1.24, P1.25, P1.26, P1.27, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.107, P2.5, P2.6, P2.8, P2.9, P2.10, P2.13, P2.14, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.34, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57 y P2.64 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400 ppm.

Ejemplo B11: Actividad translaminal contra *Aphis craccivora* (áfido del caupi)

Hojas de porotos (Phaseolus vulgaris) son infestadas con aproximadamente 20 individuos de edades mixtas sobre el lado inferior de la hoja utilizando jaulas de clips. 1 Día después de la infestación, el lado superior de las hojas se trata con la solución de ensayo por pintado. 5 Días más tarde, se controlan las muestras para determinar la mortalidad.

En este ensayo, los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.14, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.23, P1.24, P1.26, P1.27, P1.45, P1.48, P1.49, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.107, P2.2, P2.3, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.12, P2.13, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.23, P2.24, P2.30, P2.34, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57 y P2.64 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 400 ppm.

Ejemplo B12: Actividad contra *Aonidiella aurantii* (cochinilla roja)

000458

Tratamiento de tubérculos de papa sumergiendo en la solución de ensayo. Un día más tarde, los tubérculos son infestados con aproximadamente 50 orugas. 6–8 Semanas después de la aplicación, se controlan las muestras para determinar la cantidad de orugas de la siguiente generación (en comparación con las muestras no tratadas).

En este ensayo, los compuestos P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.11, P1.15, P1.17, P1.19, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.14 y P2.18 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 200ppm.

Ejemplo B13: actividad de remojo contra *Myzus persicae* (áfido verde del duraznero)

Se tratan plántulas de alverja cultivadas en tierra de campo como aplicación por remojo y se infestan con una población mixta de *M. persicae*. 7 Días después de la infestación, se controlan las muestras para determinar la mortalidad.

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas P1 y P2 que aparecen en lo que antecede muestran buena actividad. Por ejemplo los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.23, P1.24, P1.26, P1.27, P1.48, P1.49, P1.53, P1.55, P1.59, P1.60, P1.70, P1.78, P1.82, P1.88, P1.107, P2.1, P2.2, P2.3, P2.4, P2.5, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.11, P2.12, P2.13, P2.14, P2.18, P2.20, P2.21, P2.24, P2.30, P2.34, P2.54, P2.55, P2.56, P2.57 y P2.64 muestran una actividad de más de 80% en una concentración de 25ppm.

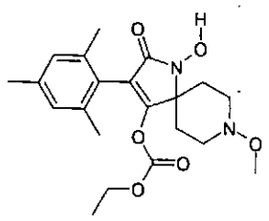
Ejemplo B14: Tratamiento insecticida de la semilla

Se tratan semillas de remolacha con los compuestos de ensayo en diversas proporciones (mg de i.a./semilla). Las semillas se siembran en macetas rellenadas con tierra. Después de colocar las semillas sobre la superficie de tierra, se cubren con tierra. Antes y durante los bioensayos, las plantas son cultivadas bajo condiciones de invernadero óptimas. Luego de 14 días, las plantas son infestadas con el áfido del caupi (*Aphis craccivora*) colocando una plántula de alverja infestada que contienen aproximadamente 150 áfidos de una población de estadíos de desarrollo mixtos sobre cada planta. Siete días después de la

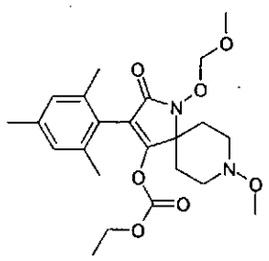
infestación, se cuenta la cantidad de áfidos por planta. Cada grupo de tratamiento se replica 10 veces. Cada réplica contiene 1 planta.

En este ensayo, los compuestos P1.2, P1.7, P2.2 y P2.6 muestran una eficacia de más del 80% (60% de eficacia para el compuesto P2.2) en la reducción de áfidos comparado con las plantas control no tratadas en una proporción de 0.3 mg de i.a./semilla.

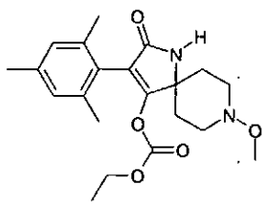
Ejemplo B15: Comparación de la actividad insecticida y compatibilidad de los cultivos de compuestos de acuerdo con la invención con un compuesto del estado de la técnica (compuesto No. A18 descrito en la página 97 de WO09/049851):



(Compuesto No. P1.11 de acuerdo con la invención)



(Compuesto No. P1.7 de acuerdo con la invención)



(Compuesto No. A18 de acuerdo con WO09/049851)

Actividad de remojo contra *Myzus persicae* (áfido verde del duraznero)

(población mixta, aplicación por remojo en tierra de campo, persistencia, evaluación del daño a las plantas)

Se tratan plantas de pimiento de seis semanas de edad cultivadas en tierra de campo como aplicación por remojo en diversas proporciones (mg de i.a. / litro de tierra). El mismo día, las plantas son infestadas con una población mixta de *M.persicae* y se incuban en el invernadero bajo condiciones óptimas de invernadero. Las muestras son evaluadas 7 días después de la infestación para determinar la mortalidad. Las plantas tratadas son infestadas nuevamente 7, 14, 21 y 28 días después de la aplicación. La evaluación se realiza siempre 7 días después de la infestación. Las plantas también son controladas para determinar el daño (fitotoxicidad), realizándose una evaluación visual utilizando una escala de puntuación del 0–100% (100% = daño total a la planta; 0% = sin daño a la planta).

Los resultados son mostrados en la Tabla B15:

Tabla B15: Actividad (índice de muerte) contra Myzus persicae (áfido verde del duraznero) y daño sobre plantas de pimiento

Compuesto:	Concentración (ppm)	Mortalidad (%) *xx* días después de aplicación (remojo, acción sistémica, persistencia)					Daño (%) sobre planta de pimiento *xx* días después de aplicación				
		0	7	14	21	28	0	7	14	21	28
A18 (WO09/049851)	12,5	100	100	98	95	95	40	70	85	85	85
P1.11 (invención)	12,5	97	95	95	100	100	0	0	0	0	0
P1.7 (invención)	12,5	99	100	98	98	97	0	0	0	0	0

La Tabla B15 muestra que los compuestos No. P1.11 y P1.07 de acuerdo con la invención ejercen una acción insecticida sobre *Myzus persicae* la cual es muy similar a la acción del compuesto del estado de la técnica. Sin embargo, los compuestos P1.11 y P1.07 exhiben una compatibilidad con las plantas

significativamente mejor mostrando ningún tipo de daño a las plantas en las plantas de pimientos, mientras que el compuesto A18 daña las mismas en un grado elevado intolerable.

Ejemplo B16: Actividad contra *Aphis craccivora* (áfido del caupi)

(población mixta, efecto adyuvante, curativo)

Plantas anchas de habas son infestadas severamente con una población de áfidos de edades mixtas. Un día después de la infestación, las plantas son tratadas con soluciones diluidas del ensayo del compuesto formulado como EC050 en una cámara de pulverización (4 réplicas). Opcionalmente, se agrega un adyuvante con 0,1 % (v/v) a la solución de pulverización. 7 Días después del tratamiento, se controlan las muestras para determinar la mortalidad. La eficacia se calcula con la ayuda de la fórmula de Abbott.

Los resultados son mostrados en las Tablas B16a y B16b:

Tabla B16a: Actividad contra *Aphis craccivora* (áfido del caupi)

Compuesto:	Concentración (ppm)	Eficacia de Abbott (%) contra *Aphis craccivora*
P1.15, sin adyuvante	3	3
P1.15 + Merge	3	10
P1.15 + Nitrato de amonio	3	63
P1.15 + Mero	3	69
P1.15 + Adigor	3	94

Merge (Número de registro de CAS 147230–14–6) es una mezcla de surfactantes y solvente (hidrocarburos de petróleo).

Nitrato de amonio: Se empleó "Ammonsalpeter", un fertilizante de nitrógeno, con una composición de nitrógeno (N) del 27% (50% de N de amonio y 50% de nitrato N).

Mero (Número de registro del CAS 85586–25–0) es un producto a base de éster metílico de aceite de semilla de colza.

GC0462

Adigor (Número de registro del CAS.1103981–66–3) s un producto a base de éster metílico de aceite de semilla de colza.

Tabla B16b: Actividad contra *Aphis craccivora* (áfido del caupi)

Compuesto:	Concentración (ppm)	Eficacia de Abbott (%) contra *Aphis craccivora*
P1.15, sin adyuvante	3	11
P1.15 + Agnique ME CSO 10	3	81
P1.15 + Break Thru S 233	3	80
P1.15 + RME	3	93

Agnique ME CSO 10 es a base de etoxilado de aceite de ricino metilado.
Break Thru S 233 es a base de polisiloxano modificado con poliéter.
RME es un éster metílico de aceite de semilla de colza.

Las Tablas B16a y B16b revelan que los adyuvantes de diferentes clases químicas, tales como por ejemplo, aunque sin limitarse a, surfactantes con o sin solventes, aceites vegetales, fertilizantes, sales de amonio o polisiloxanos modificados con óxido de polialquilo son capaces de aumentar la actividad insecticida del compuesto P1.1.5 significativamente.

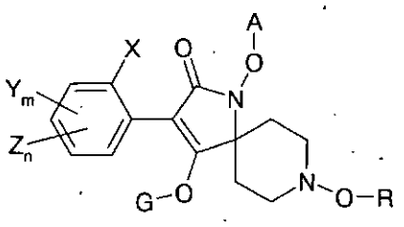
Ejemplo B17: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido verde del duraznero)
(población mixta, actividad alimenticia/de contacto residual, evaluación del daño a las plantas)

Plantas de pimiento infestadas con una población mixta de *Myzus persicae* son tratadas con soluciones diluidas del ensayo de los compuestos en una cámara de pulverización. 6 Días después del tratamiento, se controlan las muestras para determinar la mortalidad y para determinar el daño a las plantas (fitotoxicidad), realizándose la evaluación visual utilizando una escala de puntuación del 0–100% (100% = daño total a la planta; 0% = sin daño a la planta).

En este ensayo, los compuestos enlistados en las Tablas P1 y P2 que aparecen en lo que antecede muestran buena actividad contra *Myzus persicae* y compatibilidad con la planta aceptable. Por ejemplo los compuestos P1.1, P1.2, P1.3, P1.7, P1.8, P1.9, P1.10, P1.11, P1.14, P1.15, P1.17, P1.18, P1.19, P1.24, P1.26, P1.27, P1.32, P1.37, P1.38, P1.44, P1.45, P1.48, P1.53, P1.55, P1.56, P1.57, P1.63, P1.65, P1.69, P1.73, P1.76, P1.77, P1.78, P1.79, P1.81, P1.82, P1.83, P1.88, P1.89, P1.106, P1.107, P2.2, P2.3, P2.6, P2.7, P2.8, P2.9, P2.10, P2.11, P2.12, P2.13, P2.18, P2.19, P2.20, P2.21, P2.24, P2.29, P2.30, P2,31, P2.33, P2.36, P2.38, P2.40, P2.43, P2.54, P2.62, P2.63, P2.64, P2.65, P2.66, P2.67, P2.69, P2.70, P2.71, P2.77, P2.78, P2.79, P2.82, P2.83, P2.85, P2.86, P2.94, P2.95, P2.97 y P2.99 muestran una actividad superior o igual a 80% contra *Myzus persicae* y daño a las plantas de pimiento inferior o igual a 10% en una concentración de 200ppm.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I



(I),

donde

X, Y y Z independientemente entre sí son alquilo C_{1-4}, cicloalquilo C_{3-6}, haloalquilo C_{1-4}, alcoxi C_{1-4}, halógeno, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_{1-4}, haloalquilo C_{1-4}, halógeno o ciano;

m y n, independientemente entre sí, son 0, 1, 2 o 3 y m+n es 0, 1, 2 o 3;

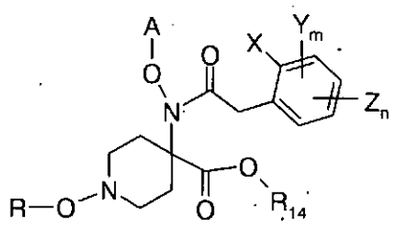
G es hidrógeno, un metal alcalino, metal alcalinotérreo, amonio, sulfonio o un grupo de latenciación;

R es hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cianoalquilo C_{1-6}, bencilo, alcoxi C_{1-4} alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4}alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}) o es un grupo G; y

A es hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}), o cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}) donde en la porción cicloalquilo un grupo metileno es reemplazado con O, S o NR_0, donde R_0 es alquilo C_{1-6} o alcoxi C_{1-6}, o A es alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{3-6}, cianoalquilo C_{1-6}, bencilo, alcoxiC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alcoxiC_{1-4}alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), oxetanilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, alquilcarbonilo C_{1-6}, alcoxicarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, N–di(alquil C_{1-6})carbamoílo, benzoílo, alquilsulfonilo C_{1-6} o fenilsulfonilo, alquiltio C_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alquilsulfinilC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alquilsulfonil C_{1-4}alquilo(C_{1-4}), furanilalquilo(C_{1-4}), tetrahidro–tiofuranilo, tetrahidro–tiopiranilo, 1–alcoxi(C_{1-4})–piperidin–4–ilo,

o su sal aceptable para uso agroquímico o su N–óxido.

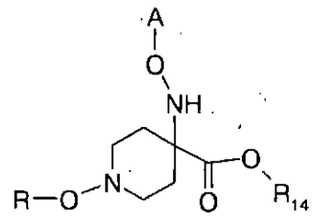
2. Un compuesto de fórmula IV



(IV),

o las sales del mismo, donde X, Y, Z, m, n, R y A son según lo definido en la reivindicación 1 y R_{14} es alquilo C_{1-6}.

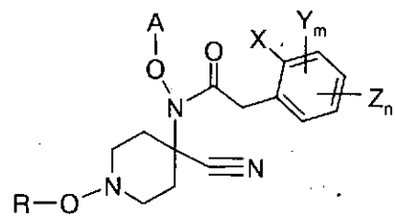
3. Un compuesto de la fórmula V



(V),

o las sales del mismo, donde R y A son según lo definido en la reivindicación 1 y donde R_{14} es alquilo C_1–C_6.

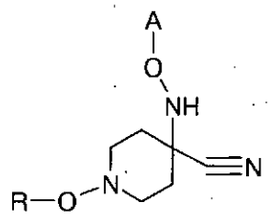
4. Un compuesto de la fórmula X



(X),

o las sales del mismo, donde X, Y, Z, m, n, R y A son según lo definido en la reivindicación 1.

5. Un compuesto de la fórmula VII



(VII),

o las sales del mismo, donde R y A son según lo definido en la reivindicación 1.

6. Una composición insecticida, acaricida, nemacitida o molusquicida que comprende una cantidad eficaz de por lo menos un compuesto de fórmula I según lo definido en la reivindicación 1.

7. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende adyuvantes de formulación.

8. Una composición de acuerdo con la reivindicación 7, donde el adyuvante de formulación es un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres de alquilo de dichos aceites o mezclas de dichos aceites y derivados de aceites, o es un fertilizante o una sal de amonio o de fosfonio, opcionalmente en mezcla con los aceites y derivados de aceite antes mencionados.

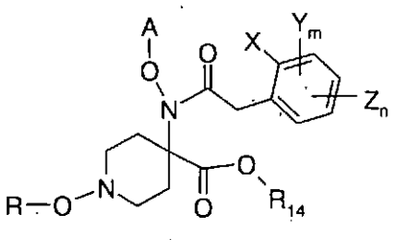
9. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende por lo menos un insecticida, acaricida, nemacitida o molusquicida adicional.

10. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende por lo menos un fungicida, herbicida, antídoto o regulador del crecimiento vegetal adicional.

11. Un método para combatir y controlar pestes de insectos, ácaros, nematodos o moluscos el cual comprende aplicar a la peste, a un locus de la peste, o a una planta susceptible al ataque por la peste una cantidad eficaz insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de fórmula I, o de una composición que comprende ese tipo de compuesto.

12. Un método de acuerdo con la reivindicación 11, el cual comprende aplicar a la peste, a un locus de la peste, o a una planta susceptible al ataque por la peste, una cantidad eficaz insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de fórmula I y por lo menos un insecticida, acaricida, nematicida, molusquicida, fungicida, herbicida, antídoto o regulador del crecimiento vegetal adicional.

13. Un proceso para la preparación de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, donde G es hidrógeno, el cual comprende la ciclación del compuesto de fórmula IV



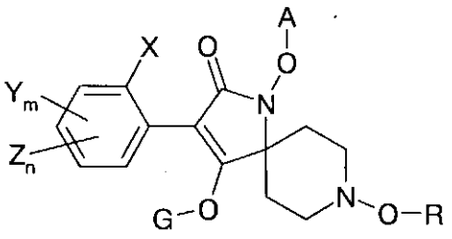
(IV),

donde X, Y, Z, m, n, R y A tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1, y R_{14} es alquilo C_{1-6}, bajo condiciones básicas.

000468

RESUMEN

Compuestos novedosos de la fórmula I



(I) ,

donde los sustituyentes son según lo definido en la reivindicación 1; composiciones que los contienen y su utilización como insecticidas, acaricidas, nematicidas o molusquicidas.

000469

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

PATENTE DE INVENCION ___ PCT __X__ MODELO DE UTILIDAD ___ DISEÑO INDUSTRIAL ___

(21) Nº de solicitud: (22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional :

(71)Solicitante(s) **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

(72) Inventor(es) **VER ANEXO # 1**

(74) Apoderado: **DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**

(30) Prioridad	31)	**No. Prioridad**	32)	**Fecha**	(33)	**País**
		0822005.5		02/12/2008		**GB**
		0905340.6		27/03/2009		**GB**

(85) Fecha inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT
Fecha de presentación de la solicitud: **30/11/2009**
No. de solicitud **PCT/EP2009/066039**

(87) Publicación internacional
Fecha: **10/06/2010**
Nº publicación: **WO 2010/063670 A1**

(54) Titulo: **N-OXIAMIDAS ESPIROHERETOCÍCLICAS COMO PESTICIDAS**

ANEXO # 1 – INVENTOR(ES)

MICHEL MUEHLEBACH, THOMAS PITTERNA, ANDRE JEANGUENAT, MYRIEM EL QACEMI, ROGER GRAHAM HALL, ANDREW EDMUNDS, CAMILLA CORSI, ANDRÉ DENIS STOLLER, CHRISTOPHER RICHARD GODFREY, JÜRGEN HARRY SCHAETZER, OLIVIER LOISELEUR, PETER MAIENFISCH, JÉRÔME YVES CASSAYRE

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

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

(21) N° de solicitud:

22) Fecha de solicitud:

(30) Prioridad 31) N° Prioridad 32) Fecha 33) País
0822005.5 02/12/2008 GB
0905340.6 27/03/2009 GB

(51) Int. Cl.:

(71)Solicitante(s) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

(72) Inventor(es) MICHEL MUEHLEBACH
THOMAS PITTERNA
ANDRE JEANGUENAT
Y OTROS

(74) Apoderado: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

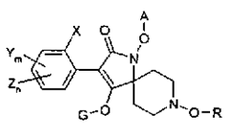
(85) Fecha limite inicio fase nacional:
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT
Fecha de presentación de la solicitud: 30/11/2009
N° de solicitud PCT/EP2009/066039

(87) Publicación internacional
Fecha: 10/06/2010
N° publicación: WO 2010/063670 A1

(54) Titulo: **N-OXIAMIDAS ESPIROHERETOCÍCLICAS COMO PESTICIDAS**

Reivindicación(es):

1. Un compuesto de la fórmula I



(I).

donde

X, Y y Z independientemente entre sí son alquilo C_{1-4}, cicloalquilo C_{3-6}, haloalquilo C_{1-4}, alcoxi C_{1-4}, halógeno, fenilo o fenilo sustituido con alquilo C_{1-4}, haloalquilo C_{1-4}, halógeno o ciano;

m y n, independientemente entre sí, son 0, 1, 2 o 3 y m+n es 0, 1, 2 o 3;

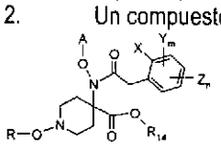
G es hidrógeno, un metal alcalino, metal alcalinotérreo, amonio, sulfonio o un grupo de latenciación;

R es hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cianoalquilo C_{1-6}, bencilo, alcoxi C_{1-4} alquilo(C_{1-4}), alcoxi C_{1-4}alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}) o es un grupo G; y

A es hidrógeno, alquilo C_{1-6}, haloalquilo C_{1-6}, cicloalquilo C_{3-6}, cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}), o cicloalquil C_{3-6}alquilo(C_{1-4}) donde en la porción cicloalquilo un grupo metileno es reemplazado con O, S o NR_0, donde R_0 es alquilo C_{1-6} o alcoxi C_{1-6}, o A es alquenilo C_{2-6}, haloalquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{3-6}, cianoalquilo C_{1-6}, bencilo, alcoxiC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alcoxiC_{1-4}alcoxi(C_{1-4})alquilo(C_{1-4}), oxetanilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, alquilcarbonilo C_{1-6}, alcoxicarbonilo C_{1-6}, cicloalquilcarbonilo C_{3-6}, N–di(alquil C_{1-6})carbamoilo, benzoilo, alquilsulfonilo C_{1-6} o fenilsulfonilo, alquiltio C_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alquilsulfinilC_{1-4}alquilo(C_{1-4}), alquilsulfonil C_{1-4}alquilo(C_{1-4}), furanilalquilo(C_{1-4}), tetrahidro–tiofuranilo, tetrahidro–tiopiranilo, 1–alcoxi(C_{1-4})–piperidin–4–ilo,

o su sal aceptable para uso agroquímico o su N–óxido.

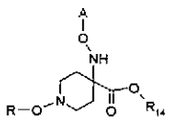
2. Un compuesto de fórmula IV



(IV),

o las sales del mismo, donde X, Y, Z, m, n, R y A son según lo definido en la reivindicación 1 y R_{14} es alquilo C_{1-6}.

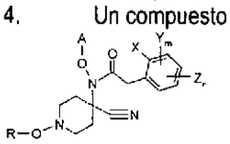
3. Un compuesto de la fórmula V



(V),

o las sales del mismo, donde R y A son según lo definido en la reivindicación 1 y donde R_{14} es alquilo C_1–C_6.

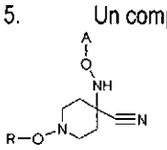
4. Un compuesto de la fórmula X



(X),

o las sales del mismo, donde X, Y, Z, m, n, R y A son según lo definido en la reivindicación 1.

5. Un compuesto de la fórmula VII



(VII),

o las sales del mismo, donde R y A son según lo definido en la reivindicación 1.

6. Una composición insecticida, acaricida, nemacitida o molusquicida que comprende una cantidad eficaz de por lo menos un compuesto de fórmula I según lo definido en la reivindicación 1.

7. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende adyuvantes de formulación.

8. Una composición de acuerdo con la reivindicación 7, donde el adyuvante de formulación es un aceite de origen vegetal o animal, un aceite mineral, ésteres de alquilo de dichos aceites o mezclas de dichos aceites y derivados de aceites, o es un fertilizante o una sal de amonio o de fosfonio, opcionalmente en mezcla con los aceites y derivados de aceite antes mencionados.

9. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende por lo menos un insecticida, acaricida, nemacitida o molusquicida adicional.

10. Una composición de acuerdo con la reivindicación 6, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende por lo menos un fungicida, herbicida, antídoto o regulador del crecimiento vegetal adicional.

...

000472

4915

COLOMBIA

PODER

El (los) Gregory W. Warren
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Nombran por el presente a **XIMENA CASTELLANOS A. y/o MARGARITA CASTELLANOS A.** abogadas con oficinas en la Carrera 9 No. 93-09, Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso –administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones:
a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; registro de marcas de fabrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen, depósito de nombres y enseñas comerciales; su renovación, prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Para la obtención de registros sanitarios; c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso - administrativos que promovamos o se nos promuevan, pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 24 de Marzo de 2004

en Research Triangle Park, Carolina del Norte 27709
por Gregory W. Warren

(El notario debe suscribir el documento en la pagina siguiente)

(Se requiere legalización consular)

POWER OF ATTORNEY

I (we) the undersigned Gregory W. Warren
. Syngenta Participations AG

hereby grant(s) Power of Attorney to **XIMENA CASTELLANOS A. and /or MARGARITA CASTELLANOS** a. attorneys residing at Carrera 9 No. 93-09, Bogota- Colombia, to prosecute
and to obtain the protection of my (our Industrial Property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities, or persons, specially those, administrative, contentious and judicial, in all matters concerning the following:

a) Obtention of patents, models and designs, registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin; the deposit of trade names and ensigns; its renewal, extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation, and the registration of licenses of use of the above rights; b) For the obtention of Sanitary registrations; c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rights; actions and suits instituted by us or against us; and that in all the above matters they may substitute this power of attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of court.

Given and signed this 24th March 2004

in Research Triangle Park, North Carolina 27709

by Gregory W. Warren Gregory W. Warren

(Notary shall execute on the other side)

(Consular legalization required)

Como Notario Veintidós del Circuito de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se ha presentado para su autenticación
Bogotá, D.C. Colombia
- 1 JUN. 2011

WILLIAM E. JIMÉNEZ LEAÑO
NOTARIO 26 ENCARGADO

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
ABOGADOS COLOMBIA
Carrera 9 No. 93-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastell@impsat.net.co

XC/cm

000473

COLOMBIA

CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)

Hoy 24 de Marzo del año 2004
compareció (eron) personalmente Gregory W. Warren
a quienes conozco como la(s) personas que firma(n) en representación de la Sociedad (Compañía denominada
Certifico : Syngenta Participations AG

a) Que es una sociedad/Compañía legalmente constituida y existente de acuerdo con las leyes de
b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es Basel, Suiza
c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el presente poder están comprendidos dentro del objeto social de la mencionada Sociedad /Compañía.
d) Que el Sr. Gregory W. Warren

esta autorizado para otorgar el presente poder. Lo anterior esta probado por medio de los siguientes documentos, que certifico he visto*

(Ciudad) REsearch Triangle Park

(Estado) Carolina del Norte 27709

Hoy del 24 de Marzo de 2004

(Notario Público) LANEISHA C. HAYES

*Los documentos debe identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL (Corporation)

On this 24th day of March of 2004 personally appeared Gregory W. Warren whom I know to be the person(s) who signed this document as representative(s) of the Corporation /Company named Syngenta Participations AG
I certify:

a) That Syngenta Participations AG is a corporation (Company legally constituted and in existence in accordance with the laws of Basel, Switzerland
b) That the domicile of said Corporation/Company is Basel, Switzerland
c) That the purpose or purposes for which the present Power of Attorney is granted are comprised within the object set forth in the charter of the mentioned Corporation/Company.
d) That Mr. Gregory W. Warren

is (are) authorized to grant the present Power of Attorney. The aforementioned was duly proven through the following documents and I duly certify having seen them*: on the 24th day of March, 2004 in Research Triangle Park, North Carolina 27709.

(City) Research Triangle Park

(State) North Carolina, 27709

this 24th day of March of the year 2004

(Notary Public) Laneisha C. Hayes

*Documents must be identified with date and origin
3/24/04 - Research Triangle Park, North Carolina 27709 - Syngenta Biotech, Inc

LANEISHA C. HAYES NOTARY PUBLIC WAKE COUNTY, N.C.

Como Notario Veintidós del Circuito de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se me presentado para su autenticación
Bogotá, D.C. Colombia
- 1 JUN. 2011
WILLIAM E. JIMÉNEZ LEAÑO
NOTARIO 26 ENCARGADO

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
ABOGADOS COLOMBIA
Carrera 9 No. 93-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastell@impsat.net.co

WAKE COUNTY
NORTH CAROLINA

Wake County Register of Deeds
Post Office Box 1897
Raleigh, North Carolina 27602-1897

Laura M. Riddick
Register Of Deeds

STATE OF NORTH CAROLINA

WAKE COUNTY

CERTIFICATE OF REGISTER OF DEEDS THAT NOTARY PUBLIC WAS ACTING NOTARY AT TIME OF SIGNATURE

I, LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS OF THE AFORESAID COUNTY AND STATE, DO HEREBY CERTIFY THAT Laneisha C. Haycs WAS, AT THE TIME OF SIGNING THE FOREGOING (OR ANNEXED) CERTIFICATE, A DULY COMMISSIONED AND QUALIFIED NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE COUNTY OF WAKE, STATE OF NORTH CAROLINA, AND AS SUCH FULL FAITH AND CREDIT IS DUE TO HIS OFFICIAL ACTS; AND, FURTHER, THAT HIS SIGNATURE THERETO IS IN HIS OWN PROPER HANDWRITING.

IN TESTIMONY WHEREOF, I HAVE HEREUNTO SET MY HAND AND SEAL OF OFFICE THIS, THE 30TH DAY OF MARCH, 2004.

Laura M Riddick
REGISTER OF DEEDS

DEPUTY / ~~ASSISTANT~~

(SEAL) LAURA M. RIDDICK REGISTER OF DEEDS SEAL WAKE COUNTY, N.C.

Como Notario Veintiocho del Circuito de Bogotá, hago constar que este copia coincide con original que se ha presentado para su autenticación
Bogotá, D.C. Colombia
- 1 JUN. 2011

WILLIAM E. JIMÉNEZ LEAÑO
NOTARIO 28 ENCARGADO

APOSTILLE
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document has been signed by CARLA N. BROWN
3. acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS
   ~~LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS~~
4. bears the seal/stamp of COUNTY OF WAKE, NORTH CAROLINA

CERTIFIED

5. at Raleigh, North Carolina
6. the 1ST DAY OF APRIL, 2004
7. by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 8117
9. Seal/Stamp:



10. Signature

Rodney S. Maddox

Como Notario Veintidós del Circuito de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se me presentado para su autenticación
Bogotá, D.C. Colombia
1 JUN. 2011

WILLIAM E. JIMÉNEZ LEAÑO
NOTARIO 26 ENCARGADO

----------TRADUCCION OFICIAL No. -040417----------

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete oficial, Res. 2755/68 y 01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.----------

----------(Anexos a un poder otorgado por Syngenta Participations AG)

(fdo) illegible

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

CONDADO DE WAKE

Yo, Laura M.Riddick, Registrador de Escrituras del condado y estado antes mencionados, certifico por medio del presente que Laneisha C. Hayes, al momento de firmar este documento era un Notario Público debidamente comisionado y habilitado en y para el Condado de Wake, Estado de Carolina del Norte, y como tal debe dares plena fe y crédito a sus actos oficiales, y además, que su firma en el mismo es de su propia letra.

En testimonio de lo cual, he impuesto aquí mi firma y sello de oficio, hoy día 30 de Marzo de 2004.

Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Por (fdo) ilegible

Como Notario Veintidós del Circulo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se he presentado para su autenticación
Bogotá, D.C. Colombia
- 1 JUN. 2011
WILLIAM E. JIMÉNEZ LEAÑO
NOTARIO 26 ENCARGADO

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTÉRPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

Delegado

APOSTILLA

(Convención de La Haya de octubre 5, 1961)

1. País: Estados Unidos de América

2. Este documento público ha sido firmado por CARLA N. BROWN

3. actuando en su carácter de Delegado del Registrador de Escrituras

4. lleva el sello de Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Condado de Wake, Carolina del Norte

CERTIFICADO

5. En Raleigh.Carolina del Norte

6. el día 1 de Abril de 2004

7. por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte

8. No. 8117

9. Sello: (sello en oblea ocre)

10. Firma

(fdo) Rodney S. Maddox

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, Abril 15, 2004

DORA. DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

Como Notario Veintiséis del Circulo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se ha presentado para su autenticación
Bogotá, D.C. Colombia
- 1 JUN. 2011

WILLIAM E. JIMÉNEZ LEAÑO
NOTARIO 26 ENCARGADO

MINISTERIO DE
RELACIONES

Dora Duque

DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

TEXTO

2:42

Como Notario Veintiséis del Círculo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con original que se me presentado para su autenticación
Bogotá, D.C. Colombia
- 1 JUN. 2011
WILLIAM E. JIMÉNEZ LEAÑO
NOTARIO 26 ENCARGADO

NOTARÍA VEINTISÉIS

EN BLANCO

NOTARÍA VEINTISÉIS

EN BLANCO

NOTARÍA VEINTISÉIS

EN BLANCO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Prosperidad para todos

Bogotá D.C.,
2020

Doctor(a)
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO
Apoderado(a) y/o Representante de
SYNGENTA LIMITED

REFERENCIA		
	Radicación No.	11 067935
	Solicitud internacional	PCT/EP2009/066039
	Fecha inicio fase nacional	02/07/2011
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430.
	Oficio No.	13631

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

1. Con respecto al resumen y de conformidad con lo dispuesto en el artículo 31 D. 486 en el cual se establece que el resumen consiste en una síntesis de la divulgación técnica contenida en la solicitud de patente, debe adecuar el resumen a los dispuesto en dicha norma, teniendo en cuenta que el extracto permitirá precisar el objeto de la invención, sus elementos característicos y el campo de aplicación.

2. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

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

Continua en la página siguiente...

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

JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 02 SET. 2011.
adpa11