



No. 11-149287- -00000-0000

Fecha: 2011-11-03 15:22:58 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYI Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 160



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA
República de Colombia
Ministerio de Comercio, Industria y Turismo

PROPIEDAD INDUSTRIAL

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD DE

PATENTE DE INVENCION
PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TITULO: **COMPUESTOS INSECTICIDAS**

52. CLASIFICACION INTERNACIONAL: C07C 237/44, C07C 255/52, A01N
31/00, A01N 37/18, C07D
207/34, C07D 213/60, C07D
213/89, C07D 231/14, C07D
239/28, C07D 261/10, C07D
285/06, C07D 307/36

71. SOLICITANTE: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

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

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

22. BOGOTA, D.C., _____

000001



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-149287 - 00000-0000

Fecha: 2011-11-03 15:22:58 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 160

Resivo de radicación

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTES
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

①

☒ Patente de Invención.☐ Patente de Modelo de Utilidad.☒ 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. ☒ 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/EP2010/054864

Fecha 14/04/2010

Publicación Internacional No. WO 2010/127928 A1

Fecha 11/11/2010

⑥

Título (54)

COMPUESTOS INSECTICIDAS

⑦

Clasificación Internacional (51)

C07C 237/44, C07C 255/57, A01N 31/00, A01N 37/18, C07D 207/34, C07D 213/60,
C07D 213/89, C07D 231/14, C07D 239/28, C07D 261/10, C07D 285/06, C07D 307/36, ...

⑧

Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

GB

06/05/2009

0907824,7

EP

15/01/2010

10150814,1

⑨

Comprobante de pago No. 11-106477 y 11-0081779

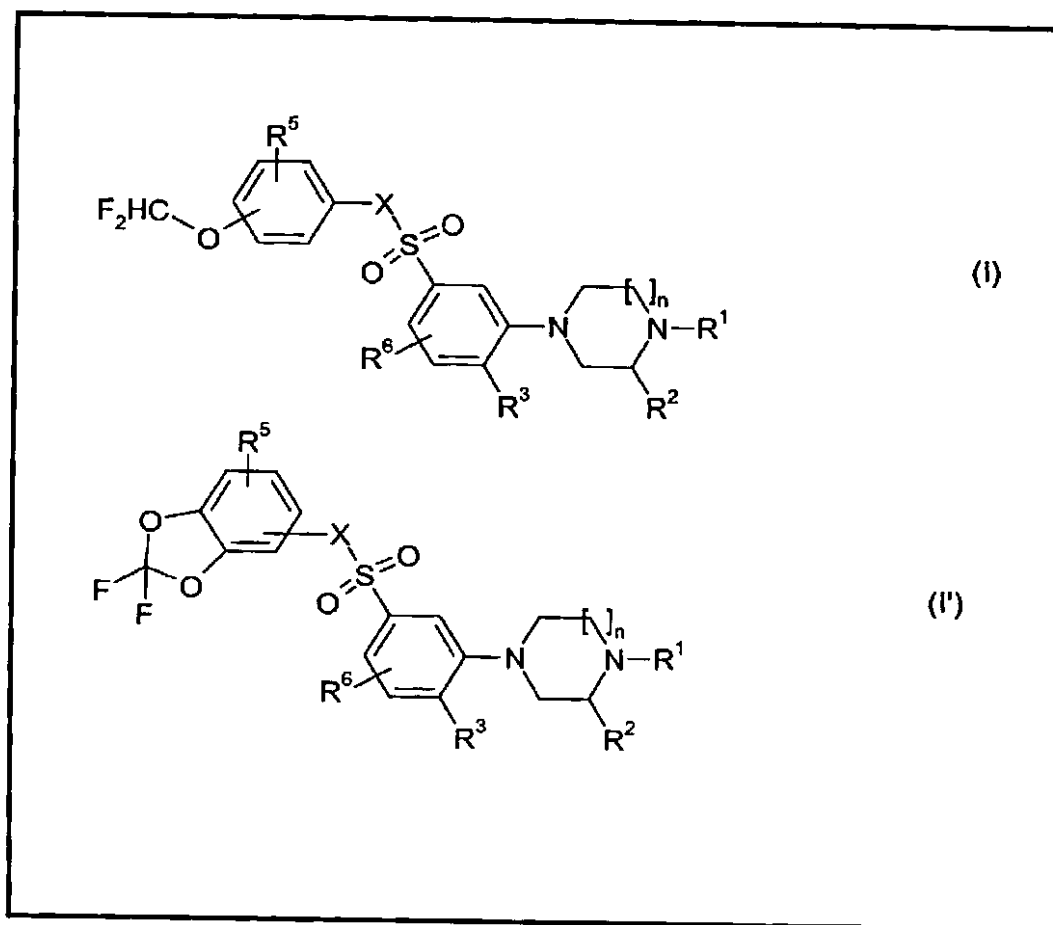
Fecha Octubre 31 y Agosto 23 de 2011

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

10 Anexos

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

11 FIGURA CARACTERISTICA:



12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

FIRMA:

Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 C.S.B.

03 NOV. 2011

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página. - MCA/gcb - P2341

CASTELLANOS & CO LTDA
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. – COLOMBIA

ANEXO # 1
INVENTORES

1. **PETER MAIENFISCH**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 Stein
SUIZA
2. **CHRISTOPHER RICHARD AYLES GODFREY**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 Stein
SUIZA
3. **PIERRE JOSEPH MARCEL JUNG**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 Stein
SUIZA
4. **OTTMAR FRANZ HUETER**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 Stein
SUIZA
5. **PETER RENOLD**
Syngenta Crop Protection Münchwilen AG
Schaffhauserstrasse
CH-4332 Stein
SUIZA



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 106477

Bogotá D.C., Octubre 31 de 2011 - 14:57:06

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	383921075	31/10/2011	13.726.900.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	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. 11-149287 - 00000-0000
Fecha: 2011-11-03 15:22:58 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 160



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0081779

Bogotá D.C., Agosto 23 de 2011 - 14:24:30

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	105802244	22/08/2011	405.000.00

*** 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. 11-149287-00000-0000

Fecha: 2011-11-03 15:22:58
Tra. 11 PATENTE IYII
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 160

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)
 (19) World Intellectual Property Organization
 International Bureau

(43) International Publication Date
 11 November 2010 (11.11.2010)



(10) International Publication Number
WO 2010/127928 A1

(51) International Patent Classification:

C07C 237/44 (2006.01) C07D 239/28 (2006.01)
 C07C 255/57 (2006.01) C07D 261/10 (2006.01)
 A01N 31/00 (2006.01) C07D 285/06 (2006.01)
 A01N 37/18 (2006.01) C07D 307/36 (2006.01)
 C07D 207/34 (2006.01) C07D 307/56 (2006.01)
 C07D 213/60 (2006.01) C07D 313/10 (2006.01)
 C07D 213/89 (2006.01) C07D 333/28 (2006.01)
 C07D 231/14 (2006.01)

(21) International Application Number:

PCT/EP2010/054864

(22) International Filing Date:

14 April 2010 (14.04.2010)

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

0907824.7 6 May 2009 (06.05.2009) GB
 10150814.1 15 January 2010 (15.01.2010) EP

(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): MAIENFISCH, Peter [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Munchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). GODFREY, Christopher Richard Ayles [GB/CH]; Syngenta Crop Protection, Munchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). JUNG, Pierre Joseph Marcel [FR/CH]; Syngenta Crop Protection, Munchwilen AG,

Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). HUETER, Ottmar Franz [DE/CH]; Syngenta Crop Protection Munchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH). RENOLD, Peter [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Munchwilen AG, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH).

(74) Agent: HERRMANN, Jörg; Syngenta Crop Protection Munchwilen AG, Patent Department, Schaffhauserstrasse, CH-4332 Stein (CH).

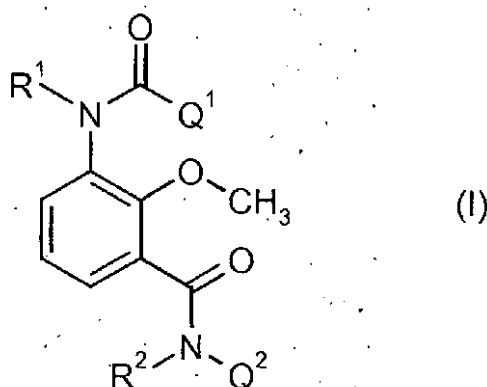
(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, 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, TH, 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, LR, 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:

[Continued on next page]

(54) Title: INSECTICIDAL COMPOUNDS



(57) Abstract: The present invention relates to bis-amide derivatives of formula (I), to processes and intermediates for preparing them, to methods of using them to control insect, acarine, nematode and mollusc pests, and to insecticidal, acaricidal, nematocidal and molluscicidal compositions comprising them.

WO 2010/127928 A1



— 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))

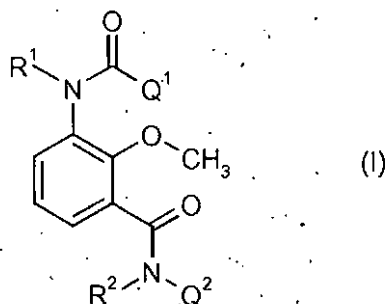
INSECTICIDAL COMPOUNDS

The present invention relates to bis-amide derivatives, to processes and intermediates for preparing them, to methods of using them to control insect, acarine, nematode and mollusc pests, and to insecticidal, acaricidal, nematocidal and molluscicidal compositions comprising them.

Compounds having insecticidal properties are disclosed in EP 1,714,958, JP 2006/306771, WO 2006/137376, EP 1,916,236, WO 2007/017075, WO 2008/000438, WO 2008/074427 and WO 2009/049845. There exists a need for alternative methods of control of pests. Preferably, new compounds may possess improved insecticidal properties, such as improved efficacy, improved selectivity, reduced toxicity, lower tendency to generate resistance or activity against a broader range of pests. Compounds may be more advantageously formulated or provide more efficient delivery and retention at sites of action, or may be more readily biodegradable.

It has surprisingly been found that certain bisamide derivatives, which are substituted by an arylperfluorobutyl group, have beneficial properties, which makes them particularly suitable for use as insecticides.

The present invention therefore provides a compound of formula (I)



wherein

Q^1 is aryl or heterocyclyl, each optionally substituted by one to five R^3 substituents, which may be the same or different;

Q^2 is selected from

- 2-ethyl-6-methyl-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl,
- 2-bromo-6-chloro-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl,
- 2,6-dichloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl,

2,6-dimethyl-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl,

2-chloro-6-methoxymethyl-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl, and

2-bromo-6-methoxymethyl-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl;

5 R^1 is selected from hydrogen, C_1 - C_8 alkyl, C_1 - C_8 alkylcarbonyl, C_1 - C_8 alkoxycarbonyl and C_1 - C_4 alkyl- $C(O)NH_2$;

R^2 is selected from hydrogen, C_1 - C_8 alkyl, C_1 - C_8 alkylcarbonyl, C_1 - C_8 alkoxycarbonyl and C_1 - C_4 alkyl- $C(O)NH_2$; and

R^3 is selected from cyano, nitro, halogen, hydroxyl, acetoxy, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkoxy- C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy-
10 C_1 - C_4 alkoxy, CN - C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkyl- $C(O)O$, C_1 - C_4 alkyl- $S(O)_2$, NH_2 , C_1 - C_4 alkylNH, $(C_1$ - C_4 alkyl) $_2N$, $(C_1$ - C_4 alkylO) $_2P(O)O$, phenyl and a five to six-membered monocyclic heterocycle containing 1 to 3 heteroatoms independently selected from nitrogen, oxygen and sulfur;

or an agrochemically acceptable salt or N-oxides thereof.

15 The compounds of formula (I) may exist in different geometric or optical isomers (enantiomers and/or diastereoisomers) or tautomeric forms. This invention covers all such isomers and tautomers and mixtures thereof in all proportions as well as isotopic forms such as deuterated compounds.

Unless otherwise indicated, alkyl, on its own or as part of another group, such as
20 alkoxy, alkylcarbonyl or alkoxycarbonyl, may be straight or branched chain and may preferably contain from 1 to 6 carbon atoms, more preferably 1 to 4, and most preferably 1 to 3. Examples of alkyl include methyl, ethyl, *n*-propyl, *iso*-propyl, *n*-butyl, *sec*-butyl, *iso*-butyl and *tert*-butyl.

Halogen means fluorine, chlorine, bromine or iodine.

25 Haloalkyl groups may contain one or more identical or different halogen atoms, and includes, for example, trifluoromethyl, chlorodifluoromethyl, 2,2,2-trifluoroethyl or 2,2-difluoroethyl. Perfluoroalkyl groups are alkyl groups which are completely substituted with fluorine atoms and include, for example, trifluoromethyl, pentafluoroethyl, heptafluoroprop-2-yl and nonafluoro-but-2-yl.

30 Aryl includes phenyl, naphthyl, anthracenyl, indenyl, phenanthrenyl and biphenyl, with phenyl being preferred.

Heteroaryl means a mono-, bi- or tricyclic, aromatic hydrocarbon, containing 3 to 14, preferably 4 to 10, more preferably 4 to 7, most preferably 5 to 6 ring-atoms, including 1 to 6, preferably 1 to 4, more preferably, 1, 2 or 3 heteroatoms independently selected from nitrogen, oxygen and sulfur. Examples include furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothienyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, benzothiadiazolyl, indazolyl, benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolyl, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxalinyl, quinazolinyl, cinnolinyl and naphthyridinyl. Preferred, are monocyclic heteroaryl groups containing 4 to 7, preferably 5 to 6 ring-atoms, including 1, 2 or 3 heteroatoms independently selected from nitrogen, oxygen and sulfur.

Heterocyclyl, as used herein, includes heteroaryl, and in addition may be a saturated or partially unsaturated monocyclic or bicyclic hydrocarbon containing from 3 to 10 ring-atoms including 1 to 6, preferably 1 to 4, more preferably 1, 2 or 3 heteroatoms independently selected from nitrogen, oxygen and sulfur. Examples of non-aromatic heterocyclyl groups are oxiranyl, azetidiny, tetrahydrofuranyl, thiolanyl, pyrrolidinyl, pyrrolinyl, imidazolidinyl, imidazoliny, sulfolanyl, dioxolanyl, dihydropyranyl, tetrahydropyranyl, piperidinyl, pyrazolinyl, pyrazolidinyl, 1,3-dioxanyl, 1,4-dioxanyl, morpholinyl, dithianyl, thiomorpholinyl, piperazinyl, azepinyl, oxazepinyl, thiazepinyl, thiazolinyl, diazapanyl, 2,3-dihydrobenzofuranyl, 3,4-dihydro-2H-benzo[b][1,4]dioxepinyl, benzo[1,3]dioxolanyl and 2,3-dihydrobenzo[1,4]dioxinyl.

Preferred values of Q^1 , Q^2 , R^1 , R^2 and R^3 are, in any combination, as set out below.

Preferably, Q^1 is aryl or heteroaryl; each optionally substituted by one to five R^3 substituents, which may be the same or different.

More preferably, Q^1 is selected from phenyl, biphenyl and a five to six-membered monocyclic heteroaryl group containing 1, 2 or 3 heteroatoms independently selected from nitrogen, oxygen and sulfur; each optionally substituted by one to five R^3 substituents, which may be the same or different.

Yet more preferably, Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl,

triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothienyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, benzothiadiazolyl, indazolyl, benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolyl, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxalyl, quinazolinyl, cinnolinyl and naphthyridinyl; each optionally substituted by one to five R^3 , and more
 5 preferably by one to three R^3 substituents, which may be the same or different.

Even more preferably, Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furanyl, pyridyl, thienyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl and pyrimidinyl; each optionally substituted by one to three R^3 substituents, which may be the same or different.

10 Preferably, R^3 is selected from cyano, nitro, fluoro, chloro, bromo, iodo, hydroxyl, acetoxy, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkoxy- C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy- C_1 - C_4 alkoxy, CH_2 -CN, $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, phenyl, N-pyrrolyl, thiadiazolyl, and pyridyl.

More preferably, R^3 is selected from cyano, nitro, fluoro, chloro, bromo, iodo,
 15 hydroxyl, acetoxy, methyl, ethyl, isopropyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, methylthio, isopropylthio, 3-ethoxy-n-propyl, methoxymethyl, 2-methoxyethoxy, CH_2 CN, $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, phenyl, N-pyrrolyl, thiadiazolyl, and pyridyl.

Most preferably, R^3 is selected cyano, nitro, bromo, chloro, fluoro, methyl, ethyl,
 20 trifluoromethyl, methoxy and trifluoromethoxy.

Most preferred Q^1 are as herein-defined in the examples and compounds of Tables A to M.

Preferably, Q^2 is selected from

25 2-ethyl-6-methyl-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl,
 2-bromo-6-chloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl, and
 2,6-dichloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl.

Preferably, R^1 is hydrogen. Preferably, R^2 is hydrogen.

In a first preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein Q^2 is 2-ethyl-6-methyl-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl; and Q^1 , R^1 , R^2 and R^3 are defined herein.

5 In a preferred embodiment of the first preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein

Q^2 is 2-ethyl-6-methyl-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl;

Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothienyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, benzothiadiazolyl, indazolyl, benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolyl, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxalinyl, quinazolinyl, cinnolinyl and naphthyridinyl; each optionally substituted by one to three R^3 substituents, which may be the same or different;

R^1 and R^2 are both hydrogen; and

15 R^3 is selected from cyano, nitro, fluoro, chloro, bromo, iodo, hydroxyl, acetoxy, methyl, ethyl, isopropyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, methylthio, isopropylthio, 3-ethoxy-n-propyl, methoxymethyl, 2-methoxyethoxy, CH_2-CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, phenyl, N-pyrrolyl, thiadiazolyl, and pyridyl.

20 In a more preferred embodiment of the first preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein

Q^2 is 2-ethyl-6-methyl-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl;

Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furanyl, pyridyl, thienyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl and pyrimidinyl; each optionally substituted by one to three R^3 substituents, which may be the same or different;

25 R^1 and R^2 are both hydrogen; and

R^3 is selected cyano, nitro, bromo, chloro, fluoro, methyl, ethyl, trifluoromethyl, methoxy and trifluoromethoxy.

30 In a second preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein Q^2 is 2-bromo-6-chloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl; and Q^1 , R^1 , R^2 and R^3 are defined herein.

In a preferred embodiment of the second preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein

Q^2 is 2-bromo-6-chloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl;

Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothienyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, benzothiadiazolyl, indazolyl, benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolyl, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxalinyl, quinazolinyl, cinnolyl and naphthyridinyl; each optionally substituted by one to three R^3 substituents, which may be the same or different;

R^1 and R^2 are both hydrogen; and

R^3 is selected from cyano, nitro, fluoro, chloro, bromo, iodo, hydroxyl, acetoxy, methyl, ethyl, isopropyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, methylthio, isopropylthio, 3-ethoxy-n-propyl, methoxymethyl, 2-methoxyethoxy, CH_2-CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, phenyl, N-pyrrolyl, thiadiazolyl, and pyridyl.

In a more preferred embodiment of the second preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein

Q^2 is 2-bromo-6-chloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl;

Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furanyl, pyridyl, thienyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl and pyrimidinyl; each optionally substituted by one to three R^3 substituents, which may be the same or different;

R^1 and R^2 are both hydrogen; and

R^3 is selected cyano, nitro, bromo, chloro, fluoro, methyl, ethyl, trifluoromethyl, methoxy and trifluoromethoxy.

In a third preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein Q^2 is 2,6-dichloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl; and Q^1 , R^1 , R^2 and R^3 are defined wherein.

In a preferred embodiment of the third preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein

Q^2 is 2,6-dichloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl;

Q¹ is selected from phenyl, biphenyl, furyl, thienyl, pyrrolyl, imidazolyl, pyrazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiadiazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, triazinyl, tetrazinyl, indolyl, benzothienyl, benzofuranyl, benzimidazolyl, benzothiadiazolyl, indazolyl, benzotriazolyl, benzothiazolyl, benzoxazolyl, quinolyl, isoquinolyl, phthalazinyl, quinoxalinyl, quinazolinyl, cinnolyl and naphthyridinyl; each optionally substituted by one to three R³ substituents, which may be the same or different;

R¹ and R² are both hydrogen; and

R³ is selected from cyano, nitro, fluoro, chloro, bromo, iodo, hydroxyl, acetoxy, methyl, ethyl, isopropyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, methylthio, isopropylthio, 3-ethoxy-n-propyl, methoxymethyl, 2-methoxyethoxy, CH₂-CN, C(O)OCH₃, S(O)₂CH₃, NH₂, N(CH₃)₂, OP(O)(CH₂CH₃)₂, phenyl, N-pyrrolyl, thiadiazolyl, and pyridyl.

In a more preferred embodiment of the third preferred aspect, the present invention provides a compound of formula (I) wherein

Q² is 2,6-dichloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl;

Q¹ is selected from phenyl, biphenyl, furanyl, pyridyl, thienyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl and pyrimidinyl; each optionally substituted by one to three R³ substituents, which may be the same or different;

R¹ and R² are both hydrogen; and

R³ is selected cyano, nitro, bromo, chloro, fluoro, methyl, ethyl, trifluoromethyl, methoxy and trifluoromethoxy.

Most preferred compounds of formula (I) are selected from

N-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methyl-phenyl]-3-(4-cyano-2-methylbenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A5 of Table A);

N-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(4-fluoro-2-chlorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A3 of Table A);

N-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-3-(4-fluoro-2-chlorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. B2 of Table B);

N-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-phenyl]-3-(4-cyano-2-methylbenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. B1 of Table B);

N-[2,6-dichloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-3-(4-fluoro-2-chlorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. C1 of Table C);

N-[2,6-dichloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-3-(4-cyano-2-methylbenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. C2 of Table C);

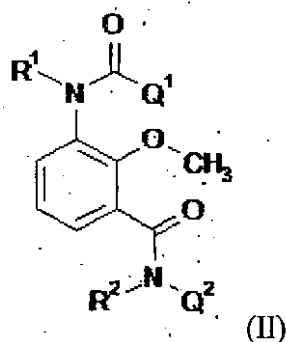
5 *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(4-fluorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A1 of Table A);

N-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methyl-phenyl]-3-(4-cyanobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A4 of Table A);

10 *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(2-methyl-3-nitrobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A2 of Table A); and

N-{3-[2-Bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-phenylcarbamoyl]-2-methoxyphenyl}-2,4,6-trifluorobenzamide (Compound No. B189 of Table B).

15 In an additional aspect the present invention provides a compound of formula (II),



wherein Q^1 , R^1 , R^2 and R^3 are as defined for formula (I) and the preferred embodiments thereof correspond to those of formula (I); and

Q^2 is selected from:

- 20 2-ethyl-6-methyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,
 2-bromo-6-chloro-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,
 2,6-dichloro-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,
 2,6-dimethyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl, and
 2-methyl-6-methoxymethyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl.

25

In a preferred embodiment, the present invention provides a compound of formula (II), wherein

Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furanyl, pyridyl, thienyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl and pyrimidinyl; each optionally substituted by one to three R^3 substituents, which may be the same or different;

R^1 and R^2 are both hydrogen; and

5 R^3 is selected cyano, nitro, bromo, chloro, fluoro, methyl, ethyl, trifluoromethyl, methoxy and trifluoromethoxy; and

Q^2 is selected from:

2-ethyl-6-methyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,

2-bromo-6-chloro-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,

10 2,6-dichloro-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,

2,6-dimethyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl, and

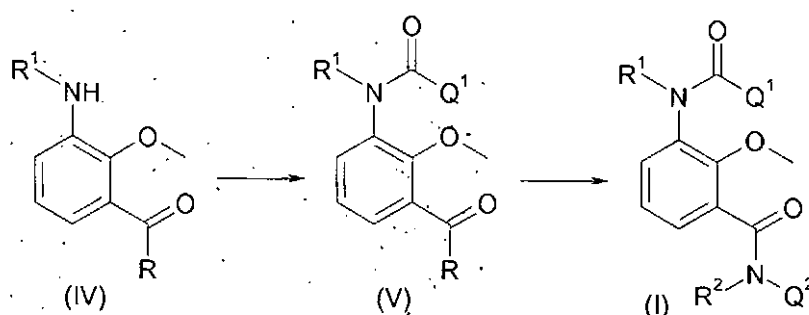
2-methyl-6-methoxymethyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl;

or an agrochemically acceptable salt or N-oxides thereof.

15 Most preferred compounds of formula (II) are those of Tables E, G, J, K and L.

The compounds of the invention may be made by a variety of methods, for example, the methods disclosed in WO 08/000438.

1) Compounds of formula (I) may be made by treatment of compounds of formula
20 (V), wherein R is OH, C_1 - C_6 alkoxy, Cl, F or Br with an amine of formula NHR^2Q^2 . When R is OH such reactions may be carried out in the presence of a coupling reagent, such as DCC (N,N'-dicyclohexylcarbodiimide), EDC (1-ethyl-3-[3-dimethylamino-propyl]carbodiimide hydrochloride) or BOP-Cl (bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphonic chloride), in the presence of a base, such as pyridine, triethylamine, 4-
25 (dimethylamino)pyridine or diisopropylethylamine, and optionally in the presence of a nucleophilic catalyst, such as hydroxybenzotriazole. When R is Cl, such reactions may be carried out under basic conditions, for example in the presence of pyridine, triethylamine, 4-(dimethylamino)pyridine or diisopropylethylamine, and optionally in the presence of a nucleophilic catalyst. Alternatively, the reaction may be conducted in a biphasic system
30 comprising an organic solvent, preferably ethyl acetate, and an aqueous solvent, preferably a solution of sodium bicarbonate. When R is C_1 - C_6 alkoxy the ester may be converted directly to the amide by heating the ester and amine together in a thermal process.

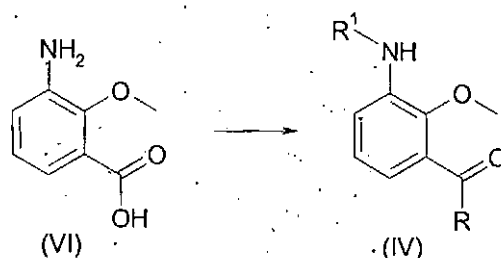


2) Acid halides of formula (V), wherein R is Cl, F or Br, may be made from carboxylic acids of formula (V), wherein R is OH by treatment with thionyl chloride or oxalyl chloride.

3) Carboxylic acids of formula (V), wherein R is OH, may be formed from esters of formula (V), wherein R is C₁-C₆alkoxy by treatment of the ester with an alkali hydroxide, such as sodium hydroxide, in a solvent, such as ethanol.

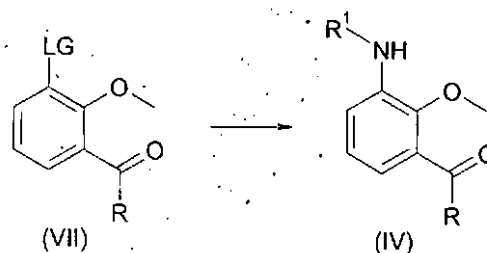
4) Esters of formula (V), wherein R is C₁-C₆alkoxy, may be made by treatment of compounds of formula (IV), wherein R is C₁-C₆alkoxy, by acylation with a carboxylic acid of formula Q¹-COOH or an acid halide of formula Q¹-COHal, wherein Hal is Cl, F or Br, under standard conditions as described in 1).

5) Compounds of formula (IV), wherein R is C₁-C₆alkoxy, may be made from compounds of formula (VI) by sequential treatment with an alcohol R-OH under acidic conditions and then formation of the N-R¹ bond. For example, reductive amination may be achieved by treatment of the amine with an aldehyde or ketone and a reducing agent such as sodium cyanoborohydride. Alternatively, alkylation may be achieved by treating the amine with an alkylating agent such as an alkyl halide, optionally in the presence of a base. Alternatively, arylation may be achieved by treatment of the amine with an aryl halide or sulfonate in the presence of a suitable catalyst/ligand system, often a palladium (0) complex.



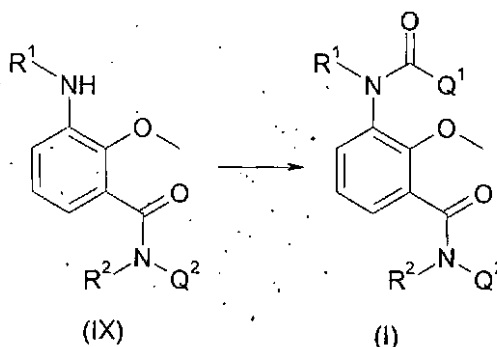
6) Alternatively, compounds of formula (IV), wherein R is C₁-C₆alkoxy, may be made from a compound of formula (VII), wherein R is C₁-C₆alkoxy and LG is a leaving group, such as fluoro, chloro or sulfonate, via the displacement of the leaving group by an

amine of formula R^1-NH_2 or other imine analogue followed by hydrolysis with a metal catalyst. See, for example: Chemical Communications (2009), (14), 1891-1893 or Journal of Organic Chemistry (2000), 65(8), 2612-2614.



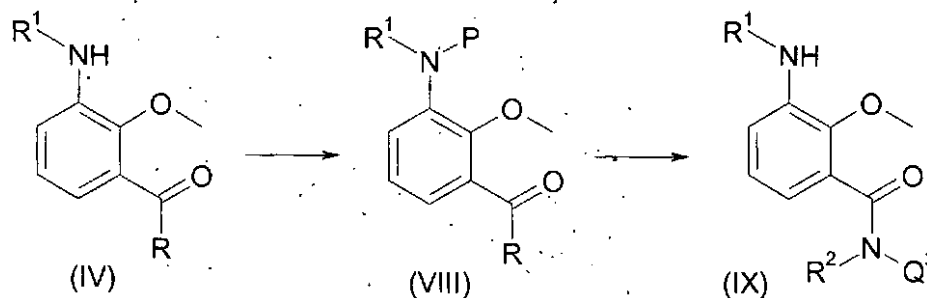
- 5 Compounds of formula (VII) and amines of formula R^1-NH_2 are either known compounds or may be made by methods known to a person skilled in the art.

7) Alternatively, compounds of formula (I), may be made by the treatment of compounds of formula (IX) with a carboxylic acid of formula Q^1-COOH or an acid halide of formula $Q^1-COHal$, wherein Hal is Cl, F or Br, under standard conditions as described in 1).



10

- 8) Compounds of formula (IX) may be formed from compounds of formula (VIII), wherein P is a suitable protecting group and R is OH, Cl or C_1-C_6 alkoxy, by amide bond formation with an amine of formula NHR^2Q^2 under standard conditions as described in 1),
 15 followed by removal of the protecting group P under standard conditions.



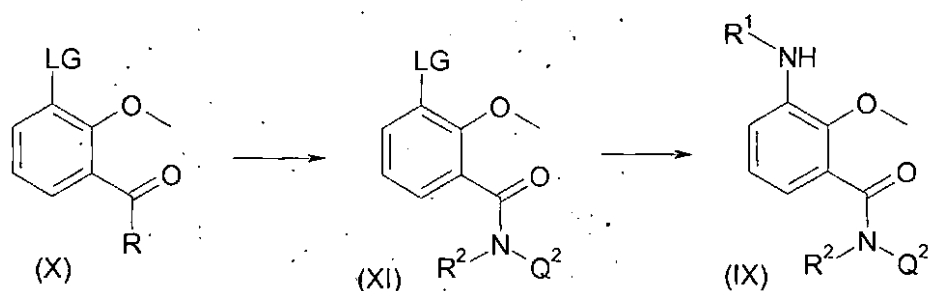
9) Compounds of formula (VIII), wherein R is OH or C₁-C₆alkoxy, may be made by the protection of the amine functionality in compounds of formula (IV), wherein R is OH or C₁-C₆alkoxy. Suitable protecting groups include carbamates (such as *tert*-butoxycarbonyl, allyloxycarbonyl and benzyloxycarbonyl), trialkylsilyl groups (such as *tert*-butyldimethylsilyl) and acyl groups (such as acetyl).

10) For compounds of formula (VIII) and compounds of formula (IV), the esters, wherein R is C₁-C₆alkoxy, may be hydrolysed to the acids, wherein R is OH, by treatment with an alkali hydroxide, such as sodium hydroxide, in a solvent, such as ethanol. The acids may be converted to the acid chlorides, wherein R is Cl, by treatment with thionyl chloride or oxalyl chloride as described in 2) and 3).

11) Alternatively, compounds of formula (IV), wherein R is OH, Cl, F, Br or C₁-C₆alkoxy, may be converted directly to compounds of formula (IX) by amide bond formation with an amine of formula NHR²Q² under standard conditions as described in 1).

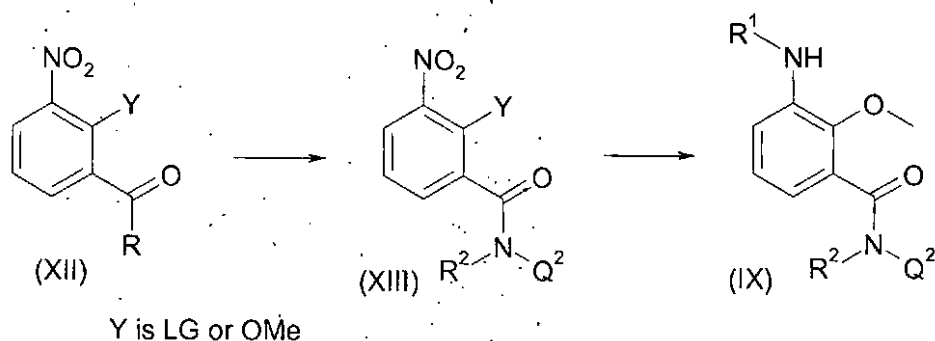
12) Alternatively, compounds of formula (IX) may be made from compounds of formula (XI), wherein LG is a leaving group such as iodo, bromo, chloro or sulfonate, by displacement of the leaving group with a compound of formula R¹-NH₂ or other imine analogue followed by hydrolysis with a metal catalyst. Ssee for example: Chemical Communications (2009), (14), 1891-1893 or Journal of Organic Chemistry (2000), 65(8), 2612-2614.

13) Compounds of formula (XI) may be made from compounds of formula (X), wherein R is Cl or OH and LG is a leaving group as described in 12), via amide bond formation under standard conditions as described in 1). Compounds of formula (X) and formula (IV) are either known compounds or may be made by methods known to the person skilled in the art.



14) An alternative synthesis of compounds of formula (IX), wherein R¹ is hydrogen, may be achieved by the reduction of nitro compounds of formula (XIII), such as by treatment

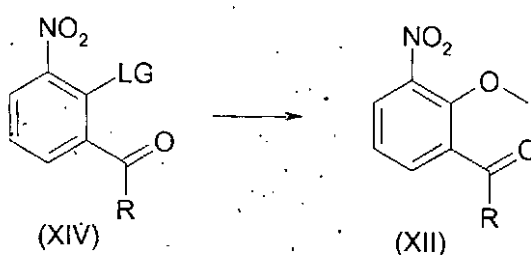
with tin chloride under acidic conditions, or hydrogenation catalysed by a noble metal such as palladium on carbon.



15 15) Compounds of formula (XIII) may be derived from compounds of formula (XII), wherein R is OH, Cl, or C₁-C₆alkoxy, via acylation with an amine of formula NHR²Q² under the standard conditions as described in 1).

16) For compounds of formula (XII), the esters, wherein R is C₁-C₆alkoxy, may be hydrolysed to the acids, wherein R is OH, by treatment with an alkali hydroxide, such as sodium hydroxide, in a solvent, such as ethanol as described in 3). The acids may be
 10 converted to the acid chlorides, wherein R is Cl, by treatment with thionyl chloride or oxalyl chloride as described in 2). Compounds of formula (XII) are either known or may be made by methods known to a person skilled in the art.

17) Compounds of formula (XII) can be made from a compound of formula (XIV)
 15 wherein LG is halogen, such as fluorine or chlorine, by reaction with methanol in the presence of a base, such as NaH.



The displacement of a halogen with an oxygen nucleophile can also be carried out on
 20 intermediates of formula (XIII).

The compounds of formula (I) can be used to 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
 5 hereinafter collectively referred to as pests. The pests which may be controlled by the use of the invention compounds include those pests associated with agriculture (which term includes the growing of crops for food and fiber 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
 10 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), *Nephotettix incticeps* (leafhopper), *Nezara* spp. (stinkbugs), *Euschistus* spp. (stinkbugs), *Leptocorisa* spp.
 15 (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),
 20 *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),
 25 *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*
 30 *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 sulfureus*), *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), *Rhizopholus* 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).

The invention therefore provides a method of controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying an insecticidally, acaricidally, nematocidally 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, preferably a plant, 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.

Crops are to be understood as also including those crops which have been rendered tolerant to herbicides or classes of herbicides (e.g. ALS-, GS-, EPSPS-, PPO- and HPPD-inhibitors) by conventional methods of breeding or by genetic engineering. An example of a crop that has been rendered tolerant to imidazolinones, e.g. imazamox, by conventional methods of breeding is Clearfield® summer rape (canola). Examples of crops that have been rendered tolerant to herbicides by genetic engineering methods include e.g. glyphosate- and glufosinate-resistant maize varieties commercially available under the trade names RoundupReady® and LibertyLink®.

Crops are also to be understood as being those which have been rendered resistant to harmful insects by genetic engineering methods, for example Bt maize (resistant to European corn borer), Bt cotton (resistant to cotton boll weevil) and also Bt potatoes (resistant to Colorado beetle). Examples of Bt maize are the Bt 176 maize hybrids of NK® (Syngenta Seeds). Examples of transgenic plants comprising one or more genes that code for an insecticidal resistance and express one or more toxins are KnockOut® (maize), Yield Gard® (maize), NuCOTIN33B® (cotton), Bollgard® (cotton), NewLeaf® (potatoes), NatureGard® and Protexcta®.

Plant crops or seed material thereof can be both resistant to herbicides and, at the same time, resistant to insect feeding ("stacked" transgenic events). For example, seed can have the ability to express an insecticidal Cry3 protein while at the same time being tolerant to glyphosate.

5 Crops are also to be understood as being those which are obtained by conventional methods of breeding or genetic engineering and contain so-called output traits (e.g. improved storage stability, higher nutritional value and improved flavor).

In order to apply a compound of formula (I) as an insecticide, acaricide, nematocide or molluscicide to a pest, a locus of pest, or to a plant susceptible to attack by a pest, a
10 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 surface active agent (SFA). 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,
15 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 to 10kg per hectare, preferably from 1g to 6kg per hectare, more preferably from 1g to 1kg per hectare.

20 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, nematocidal or molluscicidal composition comprising an insecticidally, acaricidally,
25 nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula (I) and a suitable carrier or diluent therefor. The composition is preferably an insecticidal or acaricidal composition.

The compositions can be chosen from a number of formulation types, including dustable powders (DP), soluble powders (SP), water soluble granules (SG), water dispersible
30 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), 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).

5 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, sulfur, lime, flours, talc and other organic and inorganic solid carriers) and mechanically grinding the mixture to a fine powder.

10 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 sulfate) 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
15 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
20 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,
25 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, sulfates 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
30 as polyvinyl acetates, polyvinyl alcohols, dextrans, 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 crystallization in a spray tank).

5 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;
10 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 C₈-C₁₀ fatty acid dimethylamide) and chlorinated hydrocarbons. An EC product may spontaneously emulsify on addition to water, to produce an emulsion with
15 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 emulsifying the resultant liquid or solution into water containing one or more SFAs, under high shear, to produce an
20 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
25 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 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
30 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.

5 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.

Aerosol formulations comprise a compound of formula (I) and a suitable propellant
10 (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-pressurized, 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
15 compound.

Capsule suspensions (CS) may be prepared in a manner similar to the preparation of EW formulations but with an additional polymerization 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
20 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.

25 A composition 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, spray additives based on oils, for example certain mineral oils or natural plant oils (such as soy bean and rape seed oil), and
30 blends of these with other bio-enhancing adjuvants (ingredients which may aid or modify the action of a compound of formula (I)).

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 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).

Wetting agents, dispersing agents and emulsifying agents may be surface 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 sulfuric acid (for example sodium lauryl sulfate), salts of sulfonated aromatic compounds (for example sodium dodecylbenzenesulfonate, calcium dodecylbenzenesulfonate, butylnaphthalene sulfonate and mixtures of sodium di-*isopropyl*- and tri-*isopropyl*-naphthalene sulfonates), ether sulfates, alcohol ether sulfates (for example sodium laureth-3-sulfate), 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), sulfosuccinamates, paraffin or olefine sulfonates, taurates and lignosulfonates.

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

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
5 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
10 culture systems), directly or it may be sprayed on, dusted on, applied by dipping, applied as a
cream or paste formulation, applied as a vapor 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
15 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
20 include DCs, SCs, 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
25 weight) depending upon the purpose for which they are to be used.

A compound of formula (I) may be used in mixtures with fertilizers (for example
nitrogen-, potassium- or phosphorus-containing fertilizers). Suitable formulation types
include granules of fertilizer. The mixtures preferably contain up to 25% by weight of the
compound of formula (I).

30 The invention therefore also provides a fertilizer composition comprising a fertilizer
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, insecticidal, nematocidal or acaricidal activity.

- The compound of formula (I) may be the sole active ingredient of the composition or
5 it may be admixed with one or more additional active ingredients such as a pesticide, fungicide, synergist, herbicide or plant growth regulator where appropriate. An additional active ingredient may: provide a composition having a broader spectrum of activity or increased persistence at a locus; synergize the activity or complement the activity (for example by increasing the speed of effect or overcoming repellency) of the compound of
10 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,
15 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,
20 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,
25 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;
 - 30 g) Macrolides, such as avermectins or milbemycins, for example abamectin, emamectin benzoate, ivermectin, milbemycin, spinosad, azadirachtin or spinetoram;
 - h) Hormones or pheromones;

- i) Organochlorine compounds, such as endosulfan (in particular alpha-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;
- 5 l) Neonicotinoid compounds, such as imidacloprid, thiacloprid, acetamiprid, nitenpyram, dinotefuran, thiamethoxam, clothianidin, nithiazine or flonicamid;
- m) Diacylhydrazines, such as tebufenozide, chromafenozide or methoxyfenozide;
- n) Diphenyl ethers, such as diofenolan or pyriproxifen;
- o) Indoxacarb;
- 10 p) Chlorfenapyr;
- q) Pymetrozine;
- r) Spirotetramat, spiroticlofen or spiromesifen;
- s) Diamides, such as flubendiamide, chlorantraniliprole or cyantraniliprole;
- t) Sulfoxaflor; or
- 15 u) Metaflumizone.

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).

Examples of fungicidal compounds which may be included in the composition of the invention are (E)-*N*-methyl-2-[2-(2,5-dimethylphenoxy)methyl]phenyl]-2-methoxy-iminoacetamide (SSF-129), 4-bromo-2-cyano-*N,N*-dimethyl-6-trifluoromethylbenzimidazole-1-sulfonamide, α -[*N*-(3-chloro-2,6-xylyl)-2-methoxyacetamido]- γ -butyrolactone, 4-chloro-2-cyano-*N,N*-dimethyl-5-*p*-tolylimidazole-1-sulfonamide (IKF-916, cyamidazosulfamid), 3-5-dichloro-*N*-(3-chloro-1-ethyl-1-methyl-2-oxopropyl)-4-methylbenzamide (RH-7281, zoxamide), *N*-allyl-4,5,-dimethyl-2-trimethylsilylthiophene-3-carboxamide (MON65500), *N*-

- (1-cyano-1,2-dimethylpropyl)-2-(2,4-dichlorophenoxy)propionamide (AC382042),
N-(2-methoxy-5-pyridyl)-cyclopropane carboxamide, acibenzolar (CGA245704), alanycarb,
 aldimorph, anilazine, azaconazole, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, biloxazol, bitertanol,
 blasticidin S, bromuconazole, bupirimate, captafol, captan, carbendazim, carbendazim
 5 chlorhydrate, carboxin, carpropamid, carvone, CGA41396, CGA41397, chinomethionate,
 chlorothalonil, chlorozolate, clozylacon, copper containing compounds such as copper
 oxychloride, copper oxyquinolate, copper sulfate, copper tallate and Bordeaux mixture,
 cymoxanil, cyproconazole, cyprodinil, debacarb, di-2-pyridyl disulfide 1,1'-dioxide,
 dichlofluanid, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazole, difenzoquat,
 10 diflumetorim, *O,O*-di-*iso*-propyl-*S*-benzyl thiophosphate, dimefluaazole, dimetconazole,
 dimethomorph, dimethirimol, diniconazole, dinocap, dithianon, dodecyl dimethyl ammonium
 chloride, dodemorph, dodine, doguadine, edifenphos, epoxiconazole, ethirimol, ethyl-
 (*Z*)-*N*-benzyl-*N*[(methyl(methyl-thioethylideneaminooxycarbonyl)amino]thio)- β -alaninate,
 etridiazole, famoxadone, fenamidone (RPA407213), fenarimol, fenbuconazole, fenfuram,
 15 fenhexamid (KBR2738), fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin acetate, fentin
 hydroxide, ferbam, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluoroimide,
 fluquinconazole, flusilazole, flutolanil, flutriafol, folpet, fuberidazole, furalaxyl, furametpyr,
 guazatine, hexaconazole, hydroxyisoxazole, hymexazole, imazalil, imibenconazole,
 iminoctadine, iminoctadine triacetate, ipconazole, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb
 20 (SZX0722), isopropanyl butyl carbamate, isoprothiolane, kasugamycin, kresoxim-methyl,
 LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipyrim, mepronil,
 metalaxyl, metconazole, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, myclobutanil, neoasozin,
 nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothal-*iso*propyl, nuarimol, ofurace, organomercury
 compounds, oxadixyl, oxasulfuron, oxolinic acid, oxpoconazole, oxycarboxin, pefurazoate,
 25 penconazole, pencycuron, phenazin oxide, phosetyl-Al, phosphorus acids, phthalide,
 picoxystrobin (ZA1963), polyoxin D, polyram, probenazole, prochloraz, procymidone,
 propamocarb, propiconazole, propineb, propionic acid, pyrazophos, pyrifenox, pyrimethanil,
 pyroquilon, pyroxyfur, pyrrolnitrin, quaternary ammonium compounds, quinomethionate,
 quinoxifen, quintozené, sipconazole (F-155), sodium pentachlorophenate, spiroxamine,
 30 streptomycin, sulfur, tebuconazole, tecloftalam, tecnazene, tetraconazole, thiabendazole,
 thifluzamid, 2-(thiocyanomethylthio)benzothiazole, thiophanate-methyl, thiram,
 timibenconazole, tolclofos-methyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triazbutil,

triazoxide, tricyclazole, tridemorph, trifloxystrobin (CGA279202), triforine, triflumizole, triticonazole, validamycin A, vapam, vinclozolin, zineb and 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.

5 Examples of suitable synergists for use in the compositions include piperonyl butoxide, sesamex, safroxan and dodecyl imidazole.

Suitable herbicides and plant-growth regulators for inclusion in the compositions will depend upon the intended target and the effect required.

10 An example of a rice selective herbicide which may be included is propanil. An example of a plant growth regulator for use in cotton is PIX™.

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.

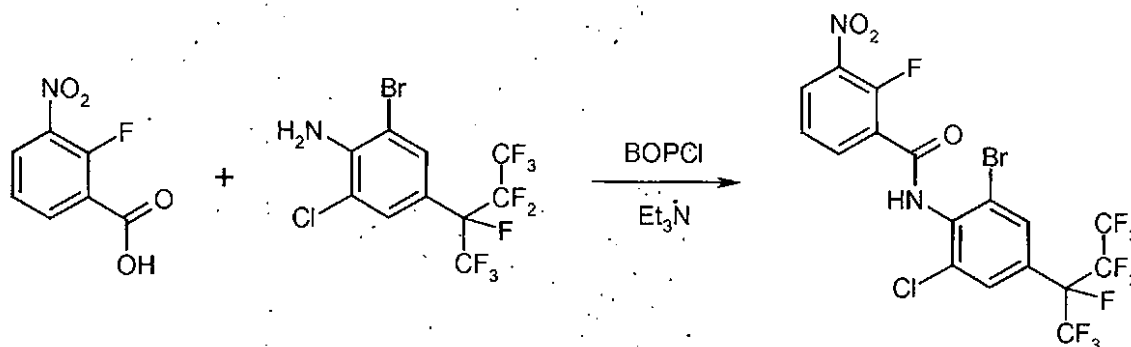
20

Examples

The following abbreviations were used throughout this section: s = singlet; bs = broad singlet; d = doublet; dd = double doublet; dt = double triplet; t = triplet, tt = triple triplet, q = quartet, sept = septet; m = multiplet; Me = methyl; Et = ethyl; Pr = propyl; Bu = butyl; M.p. = melting point; RT = retention time, MH⁺ = molecular cation (i.e. measured molecular weight).

25

Example 11: N-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-2-fluoro-3-nitrobenzamide



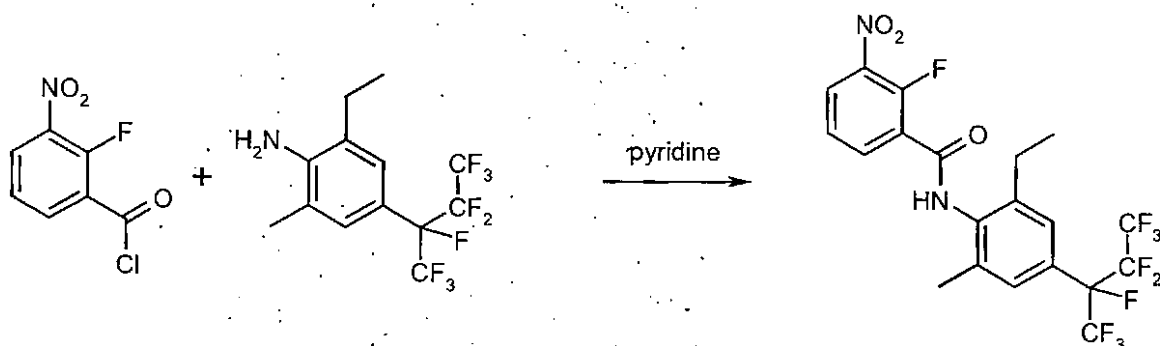
- 5 To a solution of 2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenylamine (Example 16) (20 g, 47.1 mmol) and 2-fluoro-3-nitrobenzoic acid (17.4 g, 94.2 mmol) in dichloromethane (230 ml) was added triethylamine (19.7 ml, 141 mmol) and bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphonic chloride ("BOP-Cl") (23.98 g, 94 mmol). The reaction mixture was heated to reflux for 6 hours. The reaction mixture was cooled to
- 10 ambient temperature and quenched by the addition of aqueous hydrochloric acid (1N). The mixture was then extracted three times with dichloromethane. The combined organic extracts were washed with saturated aqueous sodium hydrogen carbonate, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / ethyl acetate 7:3) to give N-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-
- 15 hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-2-fluoro-3-nitrobenzamide (12 g, 43% yield). ¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 8.48 (t, 1H), 8.30 (t, 1H), 8.18 (db, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.54 (t, 1H) ppm.

The following compound was made by the same procedure:

N-[2,6-dichloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-2-fluoro-3-nitro-benzamide

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 8.48 (t, 1H), 8.28 (t, 1H), 8.14 (db, 1H), 7.68 (s, 2H),
5 7.54 (t, 1H) ppm.

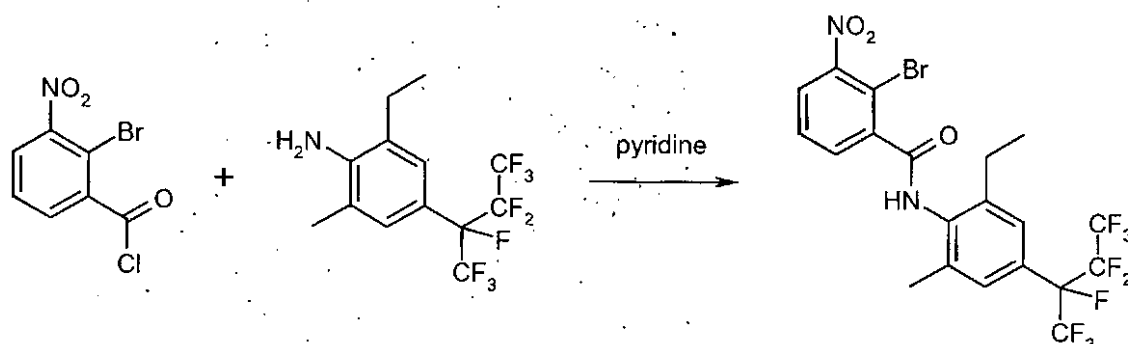
Example I2: *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-fluoro-3-nitrobenzamide



10 To a suspension of 2-fluoro-3-nitrobenzoic acid (6.3 g, 34 mmol) in dichloromethane (20 ml) was added oxalyl chloride (4.3 ml) at ambient temperature, followed by *N,N*-dimethylformamide (0.2 ml). The reaction mixture was stirred for 1 hour at ambient temperature and then heated to reflux for 3 hours. The reaction mixture was allowed to cool to ambient temperature and then concentrated. The residue was suspended in tetrahydrofuran
15 (50 ml). 2-Ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylaniline (preparation as described in WO 08/074427) (10 g, 28.3 mmol) was dissolved in tetrahydrofuran (50 ml) and pyridine (6.8 ml, 84.9 mmol) was added. The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 3 hours, then at reflux for 3 hours. The reaction was quenched by addition of saturated aqueous sodium hydrogen carbonate (100 ml) and the mixture extracted
20 twice with ethyl acetate (2x 200 ml). The combined organic extracts were dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / ethyl acetate 4:1 to 0:1) to give *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-fluoro-3-nitrobenzamide (6.32 g, 43% yield).

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 8.34 (m, 1H), 8.22 (m, 1H), 8.02 (bs, 1H), 7.45 (t, 1H),
25 7.48 (s, 2H), 2.70 (q, 2H), 1.22 (t, 3H).

Example I3: N-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-bromo-3-nitrobenzamide

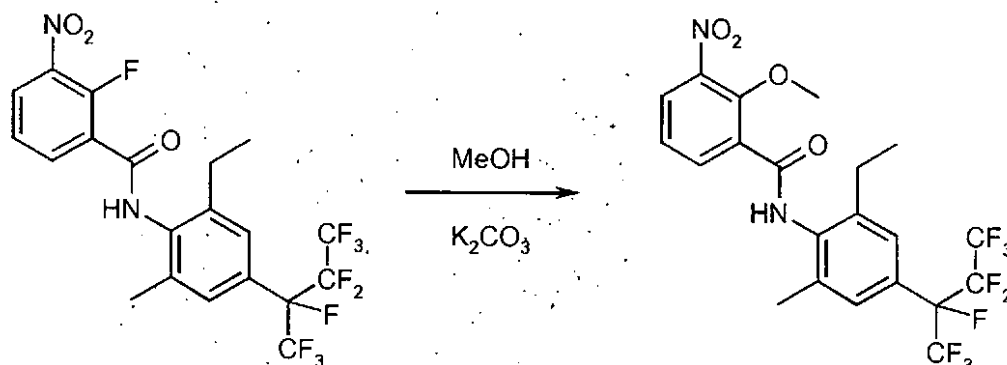


To a suspension of 2-bromo-3-nitrobenzoic acid (2.870 g, 0.0117 mol) in toluene (29 ml) was added *N,N*-dimethylformamide (90 μ l) at ambient temperature, followed by slow addition of thionyl chloride (1.69 ml, 0.02332 mol). The reaction mixture was stirred for 1 hour at 100°C. The reaction mixture was allowed to cool to ambient temperature and the toluene was evaporated. The appropriate amount of acyl chloride was dissolved in THF and use without extra purification.

To a solution of 2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylaniline (preparation as described in WO 08/074427) (106 mg, 0.3 mmol) in tetrahydrofuran (0.5 ml) was added pyridine (72.6 μ l, 0.9 mmol) at 0 to 5°C. A solution of 2-bromo-3-nitrobenzoic acid chloride (87 mg, 0.33 mmol) in tetrahydrofuran (0.5 ml) was added. The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 3 hours, then at reflux for 15 hours. After 15 hours, the reaction was not complete so *N,N*-dimethylacetamide ("DMA") (0.1 equivalents) and more 2-bromo-3-nitrobenzoic acid chloride (0.2 equivalents) were added. The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 41 hours. After 41 hours, the reaction was quenched by addition of saturated aqueous sodium hydrogen carbonate (10 ml) and the mixture extracted twice with ethyl acetate (2x 20 ml). The combined organic extracts were dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / ethyl acetate 6:1) to give *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-bromo-3-nitrobenzamide (0.133 g, 76% yield).

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 7.78 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.53 (t, 1H), 7.32 (s, 2H), 7.17 (bs, 1H), 2.71 (q, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.19 (t, 3H).

Example I4: N-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxy-3-nitrobenzamide



To a suspension of *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-fluoro-3-nitrobenzamide (Example I2) (5 g, 9.6 mmol) in methanol (195 ml) was added potassium carbonate (2.6 g, 16.2 mmol) at ambient temperature. The reaction mixture was stirred for 16 hours at ambient temperature. The reaction mixture was concentrated and the residue was dissolved in dichloromethane. The organic phase was washed with water, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / ethyl acetate 3:1) to give *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxy-3-nitrobenzamide (5.1 g, 99% yield). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.90 (bs, 1H), 8.32 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 7.38 (m, 3H), 4.19 (s, 3H), 2.70 (q, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.20 (t, 3H) ppm.

The following compounds were made by the same procedure:

N-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-2-methoxy-3-nitrobenzamide

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.23 (bs, 1H), 8.45 (dd, 1H), 8.07 (dd, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.46 (t, 1H), 4.18 (s, 3H) ppm.

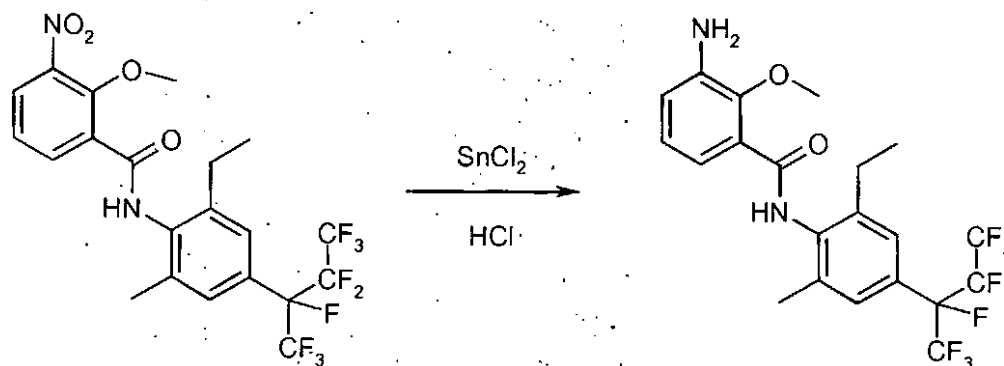
N-[2,6-dichloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-2-methoxy-3-nitrobenzamide

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.22 (bs, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.68 (s, 2H), 7.44 (t, 1H), 4.15 (s, 3H) ppm.

A similar procedure was applied to *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-bromo-3-nitrobenzamide (Example I3) to give

N-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxy-3-nitrobenzamide (92% yield).

Example 15: 3-amino-*N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxybenzamide



To a solution of *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxy-3-nitrobenzamide (Example 14) (5.1 g, 9.57 mmol) in isopropanol (50 ml) was added tin chloride (6.5 g, 34.5 mmol) at ambient temperature. The mixture was cooled to 0°C and concentrated aqueous hydrochloric acid (10 ml) was added slowly. The reaction mixture was stirred at 80°C for 0.5 hours. One third of the total volume of isopropanol was evaporated. Water (100 ml) was added to the concentrated mixture and aqueous sodium hydroxide (4N) was added to adjust the pH to 7 to 8. The aqueous phase was extracted three times with ethyl acetate (3x 200 ml). The combined organic extracts were dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / ethyl acetate 2:1 to 1:1) to give 3-amino-*N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxy benzamide (2.3 g, 48% yield).

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.12 (bs, 1H), 7.37 (dd, 1H), 7.26 (s, 2H), 6.91 (t, 1H), 6.80 (dd, 1H), 3.90 (bs, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.60 (q, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.11 (t, 3H) ppm.

The following compounds were made by the same procedure:

3-Amino-*N*-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-phenyl]-2-methoxybenzamide

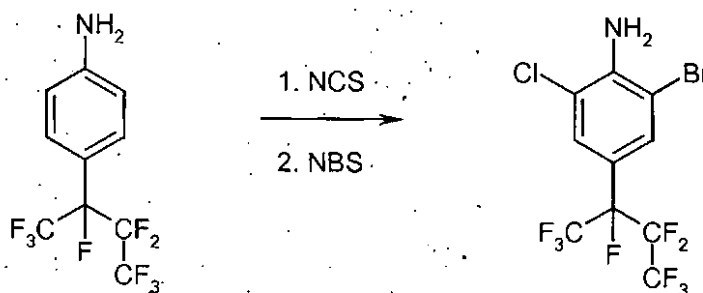
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7.73 (bs, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.47 (dd, 1H), 6.98 (t, 1H), 6.88 (dd, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.85 (bs, 2H) ppm.

3-Amino-N-[2,6-dichloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-phenyl]-2-methoxybenzamide

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.65 (s, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.10 (t, 1H), 6.98 (d, 1H), 3.98 (s, 3H), 3.93 (bs, 2H) ppm.

5

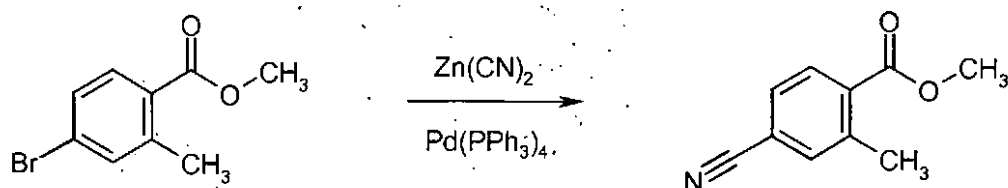
Example I6: 2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-phenylamine



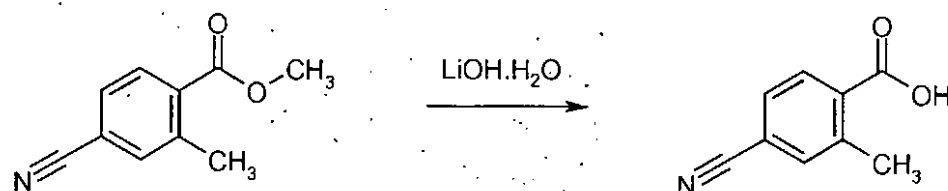
4-(1,2,2,3,3,3-Hexafluoro-1-trifluoromethylethyl)phenylamine (prepared according to EP 1,006,102) (175.8 g, 565 mmol) was dissolved in acetonitrile (1000 ml) and *N*-chloro-succinimide ("NCS") (76.2 g, 570.7 mmol) was added. The reaction mixture was heated to reflux for 90 minutes. The reaction mixture was concentrated under vacuum, the residue suspended in diethyl ether and the solids removed via filtration. The filtrate was concentrated and the residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / dichloromethane 9:1) to give 2-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenylamine. The same procedure was repeated using *N*-bromosuccinimide ("NBS") (100.5 g, 565 mmol) as reagent. This time the residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / dichloromethane 2:1) to give 2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenylamine (143.3 g, 59.7% yield).

20

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.70 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 4.82 (s, 2H) ppm.

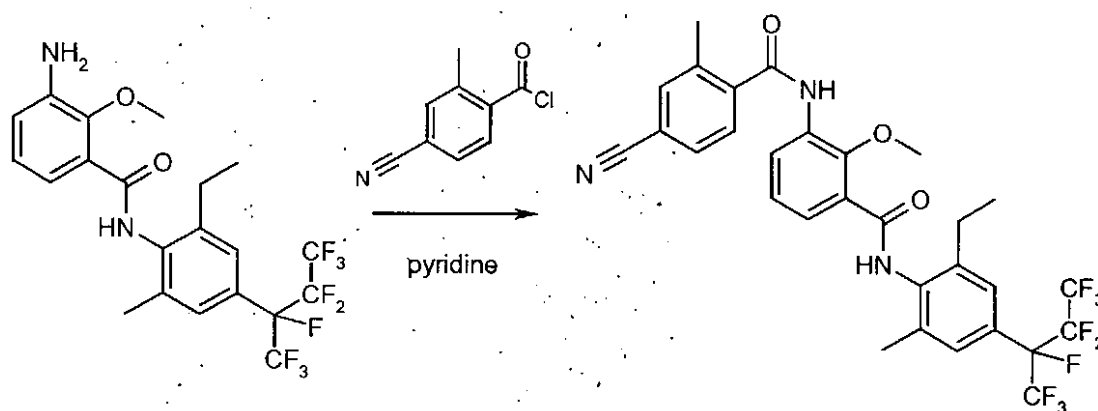
Example I7: 4-cyano-2-methylbenzoic acid methyl ester

To a solution of 4-bromo-2-methylbenzoic acid (108 g, 471 mmol) in *N,N*-dimethylformamide (4 L) under a nitrogen atmosphere was added zinc (II) cyanide (88.5 g, 753.6 mmol) and tetrakis(triphenylphosphine)palladium (65 g, 56.60 mmol). The reaction mixture was stirred at 100°C for 16 hours. The reaction mixture was diluted with toluene and the phases were separated. The aqueous phase was extracted twice with toluene. The combined organic phases were washed with brine and saturated aqueous ammonium hydroxide, dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: ethyl acetate / cyclohexane 1:5) to give 4-cyano-2-methylbenzoic acid methyl ester (73 g, 89% yield). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.78 (d, 1H), 7.52 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 2.62 (s, 3H) ppm.

Example I8: 4-cyano-2-methylbenzoic acid

To a solution of 4-cyano-2-methylbenzoic acid (Example I7) (61 g, 348 mmol) in a mixture of water (0.360 ml) and tetrahydrofuran (1.4 l) was added lithium hydroxide hydrate (31.4 g, 748.2 mmol). The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 3 hours. The reaction mixture was concentrated. The residue was acidified by addition of aqueous hydrochloric acid (1N) and extracted with a mixture of methanol and chloroform (5:95). The organic phase was dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was crystallized in a mixture of ethyl acetate and cyclohexane to give 4-cyano-2-methylbenzoic acid (55.5 g, 99% yield). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.89 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 2.51 (s, 3H) ppm.

Example P1: *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(4-cyano-2-methylbenzoylamino)-2-methoxybenzamide
 (Compound No. A5 of Table A)



To a solution of 4-cyano-2-methylbenzoic acid (Example 18) (0.141 g, 0.8 mmol) and *N,N*-dimethylformamide (2 drops) in dichloromethane (5 ml) under a nitrogen atmosphere was added oxalyl chloride (0.074 ml, 0.88 mmol). The reaction mixture was stirred for one hour at ambient temperature and then at 60°C for 1.5 hours. The reaction mixture was concentrated and the residue dissolved in tetrahydrofuran (10 ml). The solution was added dropwise to a solution of 3-amino-*N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxybenzamide (Example 15) (0.37 g, 0.73 mmol) and pyridine (0.12 ml, 1.46 mmol) in tetrahydrofuran (10 ml). The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 16 hours. The reaction mixture was poured into aqueous sodium hydrogen carbonate (1M) and the mixture extracted three times with ethyl acetate. The combined organic phases were dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: ethyl acetate / cyclohexane 1:3) to give Compound No. A5 of Table A (0.240 g, 51% yield). M.p. 104-105°C. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.68 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.66 (m, 3H), 7.41 (m, 3H), 4.00 (s, 3H), 2.72 (q, 2H), 2.62 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 1.25 (t, 3H) ppm.

The following compounds were made by the same procedure:

5 *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(4-fluoro-2-chlorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A3 of Table A)

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.76 (m, 2H), 8.71 (d, 1H), 7.98 (m, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.39 (m, 3H), 7.27 (dd, 1H), 7.18 (m, 1H), 4.03 (s, 3H), 2.73 (q, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.25 (t, 3H) ppm.

10 *N*-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-3-(4-fluoro-2-chlorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. B2 of Table B)

M.p. 178-179°C. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.12 (bs, 1H), 8.79 (bs, 1H), 8.73 (d, 1H), 7.79-7.72 (m, 2H), 7.84 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 4.07 (s, 3H) ppm.

15 *N*-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-phenyl]-3-(4-cyano-2-methylbenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. B1 of Table B)

M.p. 109-110°C. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.04 (bs, 1H), 8.69 (d, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.93 (dd, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.63 (m, 3H), 7.40 (t, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.61 (s, 3H) ppm.

20 *N*-[2,6-dichloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-3-(4-fluoro-2-chlorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. C1 of Table C)

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.12 (bs, 1H), 8.79-8.72 (m, 2H), 7.97 (m, 1H), 7.91 (dd, 1H), 7.68 (s, 2H), 7.48 (t, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.16 (m, 1H), 4.04 (s, 3H) ppm.

N-[2,6-dichloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-3-(4-cyano-2-methylbenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. C2 of Table C)

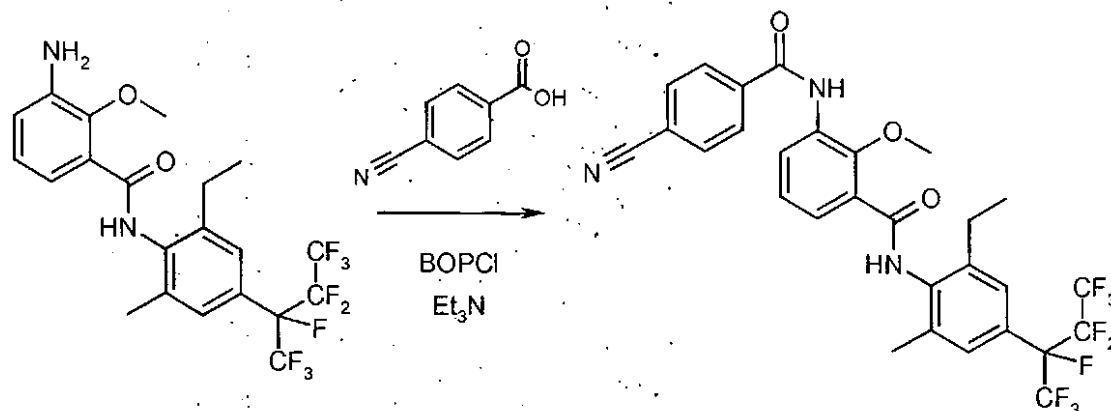
30 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.99 (bs, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.92 (dd, 1H), 7.68 (s, 2H), 7.62 (s, 3H), 7.40 (t, 1H), 4.02 (s, 3H), 2.60 (s, 3H) ppm.

The following compound was made by the same procedure except that the acyl chloride was used directly and triethylamine was used instead of pyridine:

5 *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(4-fluorobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A1 of Table A)

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.68 (s, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.89 (m, 2H), 7.80 (dd, 1H), 7.30 (m, 3H), 7.17 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 2.66 (q, 2H), 2.32 (s, 3H), 1.15 (t, 3H).

10 Example P2: *N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(4-cyanobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A4 of Table A)



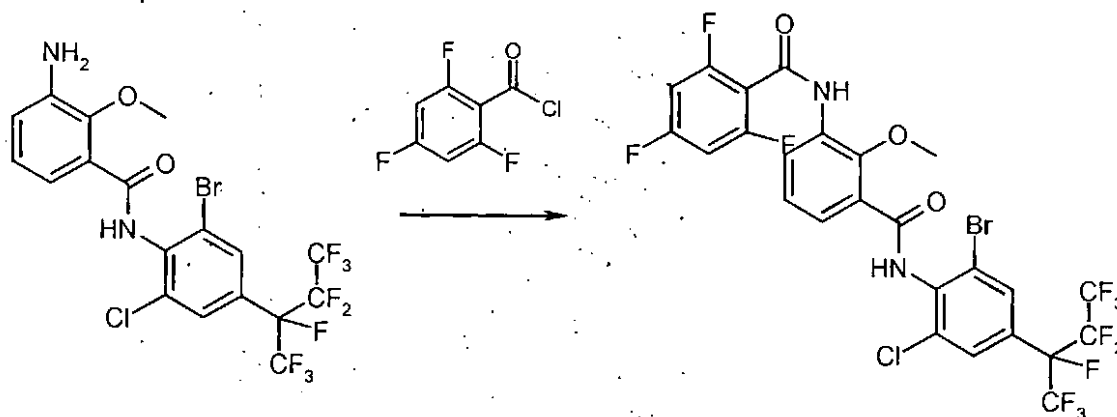
To a solution of 3-amino-*N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxybenzamide (Example I5) (30 mg, 0.06 mmol) in tetrahydrofuran (1.2 ml) was added triethylamine (25 μ l, 0.18 mmol). 4-Cyanobenzoic acid (17.6 mg, 0.12 mmol) and bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphonic chloride ("BOP-Cl") (30.4 mg, 0.12 mmol) were added. The reaction mixture was heated to reflux for 6 hours. The reaction mixture was cooled to ambient temperature and concentrated. The residue was dissolved in dichloromethane and washed with aqueous hydrochloric acid (1N) and with aqueous sodium hydrogen carbonate (saturated). The organic extract was dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by column chromatography on silica gel (eluent: cyclohexane / ethyl acetate 5:3) to give Compound No. A4 of Table A (35 mg, 93% yield). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.56 (m, 2H), 8.48 (bs, 1H), 7.97 (m, 2H), 7.82 (d, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.30 (m, 3H), 3.94 (s, 3H), 2.65 (q, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.13 (t, 3H) ppm.

The following compound was made by the same procedure:

N-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-3-(2-methyl-3-nitrobenzoylamino)-2-methoxybenzamide (Compound No. A2 of Table A)

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8.62 (d, 1H), 8.53 (s, 1H), 7.91 (m, 2H), 7.86 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.30 (m, 3H), 3.91 (s, 3H), 2.64 (q, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.14 (t, 3H) ppm.

Example P3: N-{3-[2-Bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]carbamoyl}-2-methoxyphenyl}-2,4,6-trifluorobenzamide

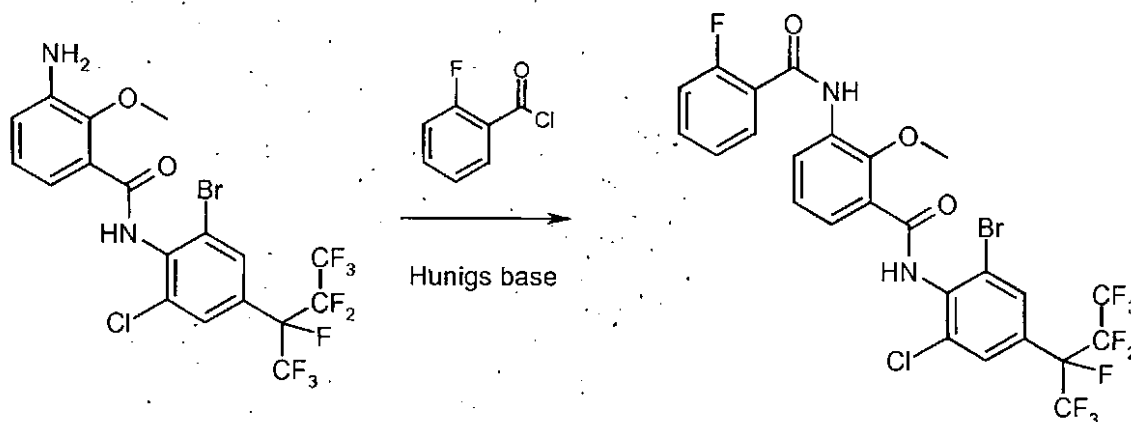


10

To a solution of 2,4,6-trifluorobenzoic acid (8.114 g, 46.08 mmol) and *N,N*-dimethylformamide (few drops) in dichloromethane (50 ml) under a nitrogen atmosphere was added oxalyl chloride (4.55 mL, 53.76 mmol). The reaction mixture was stirred for one hour at ambient temperature and then at 60°C for 1.5 hours. The reaction mixture was concentrated and the residue dissolved in tetrahydrofuran (200 ml). The solution was added drop-wise to a solution of 3-amino-*N*-[2-bromo-6-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)phenyl]-2-methoxybenzamide (Example I5) (22.03 g, 38.40 mmol) and pyridine (6.18 ml, 76.80 mmol) in tetrahydrofuran (200 ml). The reaction mixture was stirred at ambient temperature for 2 hours. The reaction mixture was poured into aqueous sodium hydrogen carbonate (1M) and the mixture extracted three times with ethyl acetate. The combined organic phases were dried over sodium sulfate and concentrated. The residue was purified by filtration on silica gel to give Compound No. B189 of Table B (28.0g, 99% yield). M.p. 179°C. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9.14 (s, 1H), 8.72 (d, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.97 (q, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.41 (t, 1H), 6.88 (t, 1H), 4.08 (s, 3H) ppm.

25

Example P4: Preparation of benzamides from acid chlorides which is amenable to parallel synthesis



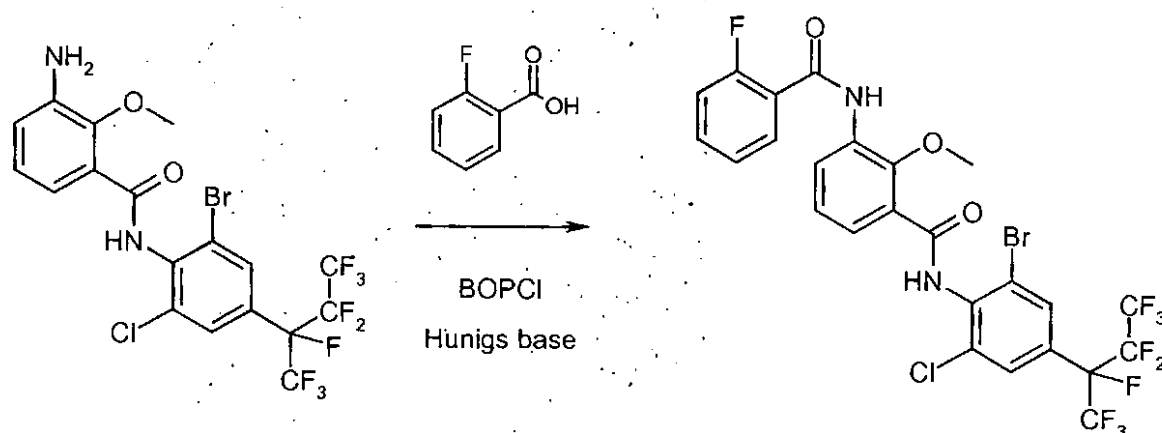
5 Solution A was prepared by dissolving the amino derivative (0.78 mmol), for example 3-amino-N-[2-chloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-bromophenyl]-2-methoxybenzamide (Example I5) in the case of Compound No. B3 of Table B, in toluene (15.6 ml). Solution B was prepared by dissolving the acid chloride (45 μ mol), for example 2-fluorobenzoyl chloride in the case of Compound No. B3 of Table B, in toluene

10 (0.36 ml). Solution A (0.6 ml, 30 μ mol) was put in a well and Solution B (0.36 ml, 45 μ mol) and diisopropylethylamine ("Hunig's Base") (30 μ l, 150 μ mol) were added successively to the well. The reaction mixture was stirred at 80°C for 16 hours. The solvent was evaporated and the mixture was diluted with a mixture of acetonitrile (0.6 ml) and

15 *N,N*-dimethylacetamide (0.2 ml) and then purified by HPLC to give the desired compound.

This method was used to prepare a number of compounds in parallel.

Example P5: Preparation of benzamides from carboxylic acids which is amenable to parallel synthesis



5 Solution A was prepared by dissolving the amino derivative (0.65 mmol), for example 3-amino-*N*-[2-ethyl-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluoromethylpropyl)-6-methylphenyl]-2-methoxybenzamide (Example I5) in the case of Compound No. A9 of Table A, in *N,N*-dimethylacetamide ("DMA") (9.6 ml). Solution B was prepared by dissolving the carboxylic acid (37.5 μ mol), for example 2-chlorobenzoic acid in the case of Compound No.

10 A9 of Table A, in *N,N*-dimethylacetamide ("DMA") (0.38 ml). Solution C was prepared by dissolving bis(2-oxo-3-oxazolidinyl)phosphinic chloride ("BOP-Cl") (1.95 mmol) in *N,N*-dimethylacetamide ("DMA") (7.8 ml). Solution A (0.4 ml, 0.025 mmol) was put in a well and Solution B (0.38 ml, 37.5 μ mol); Solution C (0.2 mL, 50 μ mol) and

15 diisopropylethylamine ("Hunig's Base") (40 μ l, 200 μ mol) were added successively to the well. The reaction mixture was stirred at 100°C for 16 hours. The solvent was evaporated and the mixture was diluted with a mixture of acetonitrile (0.6 ml) and *N,N*-dimethylacetamide (0.2 ml) and then purified by HPLC to give the desired compound.

This method was used to prepare a number of compounds in parallel.

20 The following HPLC-MS method was used for the analysis of the compounds of Table A to L:

Method 1:

MS	ZQ Mass Spectrometer from Waters (single quadrupole mass spectrometer), ionization method: electrospray, polarity: positive ionization, capillary (kV) 3.00, cone (V) 30.00, extractor (V) 3.00, source temperature (°C) 100, desolvation temperature (°C) 200, cone gas flow (L/Hr) 200, desolvation gas flow (L/Hr) 250, mass range: 150 to 800 Da:			
LC	1100er Series HPLC from Agilent: quaternary pump, heated column compartment and diode-array detector. Column: Waters Atlantis dc18; length: 20 mm; internal diameter: 3 mm; particle size: 3 µm, temperature (°C) 40, DAD wavelength range (nm): 200 to 500, solvent gradient: A = 0.1% of formic acid in water and B: 0.1% of formic acid in acetonitrile.			
	Time (min)	A%	B%	Flow (ml/min)
	0.0	80	20	1.7
	2.5	0.0	100	1.7
	2.8	0.0	100	1.7
	2.9	80	20	1.7

5

Method 2:

MS	ZQ Mass Spectrometer from Waters (single quadrupole mass spectrometer), ionization method: electrospray, polarity: positive ionization, capillary (kV) 3.00, cone (V) 30.00, extractor (V) 3.00, source temperature (°C) 100, desolvation temperature (°C) 200, cone gas flow (L/Hr) 200, desolvation gas flow (L/Hr) 250, mass range: 150 to 800 Da.			
LC	1100er Series HPLC from Agilent: quaternary pump, heated column compartment and diode-array detector. Column: Waters Atlantis dc18; length: 20 mm; internal diameter: 3 mm; particle size: 3 µm, temperature (°C) 40, DAD wavelength range (nm): 200 to 500, solvent gradient: A = 0.1% of formic acid in water and B: 0.1% of formic acid in acetonitrile.			
	Time (min)	A%	B%	Flow (ml/min)
	0.0	90	10	1.7
	5.5	0.0	100	1.7
	5.8	0.0	100	1.7
	5.9	90	10	1.7

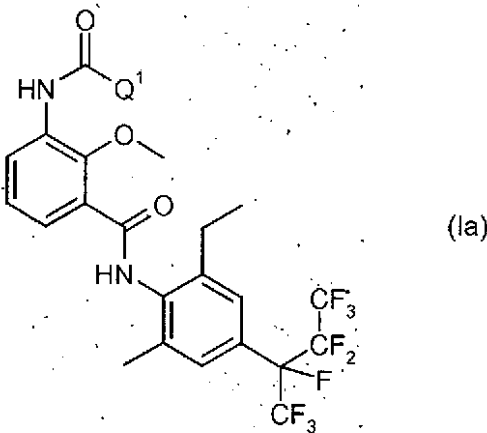
Method 3 :

MS	ZQ Mass Spectrometer from Waters (Single quadrupole mass spectrometer) Instrument Parameter: Ionisation method: Electrospray Polarity: 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 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 % HCOOH. B= Acetonitril/Methanol (4:1, v:v) + 0.04 % HCOOH			
	Time (min)	A%	B%	Flow (ml/min)
	0.00	95.0	5.0	1.7
	2.00	0.00	100.00	1.7
	2.80	0.00	100.00	1.7
	2.90	95.0	5.0	1.7
	3.00	95.0	5.0	1.7

5 Method 4:

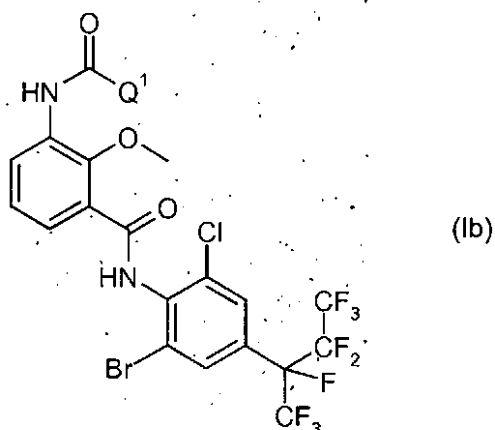
MS	ZQ Mass Spectrometer from Waters (Single quadrupole mass spectrometer) Instrument Parameter: Ionisation method: Electrospray . Polarity: negative ions Capillary (kV) 3.00, Cone (V) 30.00, Extractor (V) 2.00, Source Temperature (°C) 100, Desolvation Temperature (°C) 250, Conc Gas Flow (L/Hr) 50, Desolvation Gas Flow (L/Hr) 400. Mass range: 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 % HCOOH, B= Acetonitril/Methanol (4:1, v:v) + 0.04 % HCOOH			
	Time (min)	A%	B%	Flow (ml/min)
	0.00	95.0	5.0	1.7
	2.00	0.00	100.00	1.7
	2.80	0.00	100.00	1.7
	2.90	95.0	5.0	1.7
	3.00	95.0	5.0	1.7

Table A:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
A1	4-fluorophenyl	3.87	624.8		2
A2	2-methyl-3-nitrophenyl	-	-		
A3	2-chloro-4-fluorophenyl	-	-		
A4	4-cyanophenyl	3.77	631.9		2
A5	4-cyano-2-methylphenyl	-	-	104	
A6	2-chloropyrid-3-yl	3.65	641.8		2
A7	2-fluoropyrid-3-yl	3.79	625.8		2
A8	3-chlorophenyl	4.04	640.8		2
A9	2-chlorophenyl	3.94	640.8		2
A10	2-chloropyrid-4-yl	3.76	641.8		2
A11	5-bromopyrid-3-yl	3.75	687.7		2
A12	5-bromofuran-2-yl	3.98	676.7		2
A13	2-bromophenyl	3.94	686.7		2
A14	3-chloro-5-trifluoromethylpyrid-2-yl	4.3	709.8		2
A15	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.24	692.8		2
A16	2,5-dichlorophenyl	4.13	674.8		2
A17	6-chloropyrid-3-yl	3.67	641.8		2
A18	4-nitrophenyl	3.86	651.8		2
A19	phenyl	3.84	606.8		2
A20	2,3-difluorophenyl	4.07	642.8		2
A21	5-chlorothiophen-2-yl	4.07	646.8		2
A22	2-methyl-4-nitrophenyl			175	

Table B:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
B1	4-cyano-2-methylphenyl	-	-		
B2	2-chloro-4-fluorophenyl	2.2	730.7		1
B3	2-fluorophenyl	2.23	696.6		1
B4	2-methylphenyl	2.17	692.7		1
B5	2-chlorophenyl	2.18	712.7		1
B6	4-cyanophenyl	2.07	703.7		1
B7	4-nitrophenyl	2.06	722.0		1
B8	4-methylphenyl	2.21	692.7		1
B9	4-fluoro-2-methylphenyl	2.18	710.7		1
B10	5-chloro-2-fluorophenyl	2.34	730.6		1
B11	2-chloro-4-nitrophenyl	2.19	757.7		1
B12	furan-2-yl	2.06	668.7		1
B13	4-trifluoromethoxyphenyl	2.29	762.7		1
B14	4-fluoro-3-trifluoro-methylphenyl	2.27	764.7		1
B15	4-trifluoromethylphenyl	2.05	746.7		1
B16	2-trifluoromethoxyphenyl	2.26	762.7		1
B17	2-methoxyphenyl	2.28	708.7		1
B18	phenyl	2.12	678.6		1
B19	4-fluorophenyl	2.13	696.7		1
B20	2-trifluoromethylphenyl	2.17	746.7		1
B21	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	2.05	700.6		1
B22	2,3-difluorophenyl	2.25	714.7		1
B23	2,4-difluorophenyl	2.26	714.7		1
B24	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	2.34	764.7		1
B25	4-isopropylphenyl	4.55	719.07		2
B26	4-methylsulfanylphenyl	4.27	722.99		2
B27	2,5-dichlorophenyl	4.44	744.97		2
B28	4-methoxyphenyl	4.1	707		2
B29	2,4,5-trifluoro-3-chlorophenyl	4.59	764.98		2
B30	4-(pyrrol-1-yl)phenyl	4.35	742.06		2
B31	4-(1,2,3-thiadiazol-4-yl)phenyl	4.18	761.02		2

Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
B32	(3,4-dihydro-2H-benzo[b][1,4]dioxepine)-7-yl	4.16	749.06		2
B33	4-biphenyl	4.54	753.08		2
B34	3-methylpyridin-2-yl	4.55	692		2
B35	2-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.49	763		2
B36	2-bromophenyl	4.18	754.94		2
B37	pyridin-3-yl	3.57	677.98		2
B38	4-methoxythiophen-3-yl	4.41	712.99		2
B39	1,2,3-thiadiazol-4-yl	4.07	684.96		2
B41	5-phenyloxazol-4-yl	4.76	744.05		2
B42	2,5-dimethyl-2H-pyrazol-3-yl	3.91	695.04		2
B43	4-methyl-2-phenylpyrimidin-5-yl	4.41	769.07		2
B44	thiophen-2-yl	4.07	682.96		2
B45	2-methylsulfanylpyridin-3-yl	4.1	723.99		2
B46	5-methyl-3-phenylisoxazol-4-yl	4.39	758.06		2
B47	4-methyl-2-phenylthiazol-5-yl	4.6	774.06		2
B48	5-pyridin-2-ylthiophen-2-yl	4.22	760.02		2
B49	5-phenylfuran-2-yl	4.54	743.02		2
B50	5-methyl-1-phenyl-1H-pyrazol-4-yl	4.17	757.06		2
B51	6-morpholin-4-yl-pyrazin-2-yl	4.03	763.92		2
B52	5-bromofuran-2-yl	4.26	744.84		2
B53	pyridin-2-yl	4.46	677.9		2
B54	pyridin-4-yl	3.57	677.9		2
B55	N-oxopyridin-3-yl	3.23	693.91		2
B56	pyrazin-2-yl	4.03	678.91		2
B57	3-bromothiophen-2-yl	4.84	760.8		2
B58	2,5-dimethylfuran-3-yl	4.29	694.91		2
B61	5-nitrofuran-2-yl	4.03	711.88		2
B62	2-chloro-5-nitrophenyl	4.29	755.9		2
B63	2,5-dimethylfuran-3-yl	4.36	775.84		2
B64	2-nitro-4-chlorophenyl	4.26	755.91		2
B65	3-methyl-4-bromophenyl	4.54	768.9		2
B66	3-chloropyridin-4-yl	3.87	711.91		2
B67	5-chlorothiophen-2-yl	4.36	716.85		2
B68	3-chloro-5-iodophenyl	4.55	836.84		2
B69	2-methyl-3-nitrophenyl	4.11	735.96		2
B70	3-chloro-5-trifluoromethylphenyl	4.42	778.92		2
B71	pyrimidin-2-yl	3.76	678.91		2
B72	2-chloro-5-methylphenyl	4.39	724.9		2
B73	2-chloro-4,5-difluorophenyl	4.33	746.88		2
B74	2-nitro-5-methylphenyl	4.13	735.94		2
B75	2,6-dichloro-5-fluoropyridin-3-yl	4.37	763.86		2
B76	4-bromo-2-ethyl-5-methyl-2H-pyrazol-3-yl	4.59	786.91		2

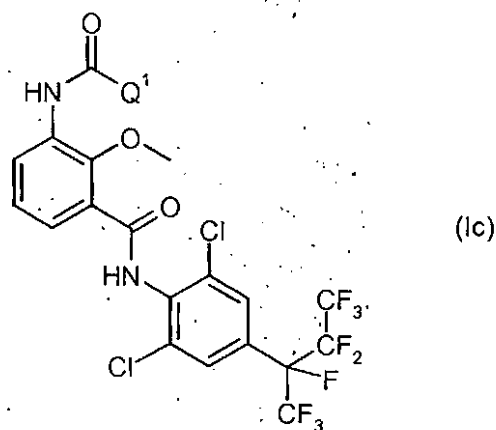
Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
B77	4-fluoro-3-nitrophenyl	4.13	739.92		2
B78	2-pyridin-3-ylthiazol-4-yl	4.26	760.91		2
B80	2-nitrophenyl	4.04	721.9		2
B81	2-trifluoromethylpyridin-3-yl	3.97	745.92		2
B82	3-methylpyridin-4-yl	3.45	691.94		2
B83	5-bromo-2-chlorophenyl	4.52	788.81		2
B84	3-bromo-4-methylphenyl	4.52	768.87		2
B85	2-bromo-3-nitrophenyl	4.13	799.85		2
B86	2-methyl-3,5-dinitrophenyl	4.24	780.97		2
B87	3-methyl-2-nitrophenyl	4.11	735.9		2
B88	3-methylthiophen-2-yl	4.31	696.87		2
B89	3-methoxyisoxazol-5-yl	4.04	697.88		2
B90	6-chloro-1-oxypyridin-2-yl	4.12	727.89		2
B91	2-hydroxy-3,5-trichlorophenyl	4.2	760.84		2
B92	1-methyl-5-trifluoromethyl-1H-pyrazol-3-yl	4.46	748.9		2
B93	3-chloro-2-methylpyridin-4-yl	3.98	725.88		2
B94	4-methyloxazol-5-yl	3.85	681.88		2
B95	2-methoxymethyl-4-methylthiazol-5-yl	4.02	741.93		2
B96	2,4-dimethylthiazol-5-yl	3.96	711.91		2
B97	2,6-dichloropyridin-4-yl	4.4	745.84		2
B98	3-methylisothiazol-4-yl	3.88	697.88		2
B99	2-methyl-3-carboxylic acid methyl ester-4-methylsulfanylphenyl	4.28	794.94		2
B100	1,5-dimethyl-1H-pyrazol-3-yl	4.15	694.9		2
B101	2-chloro-6-nitrophenyl	4.16	755.86		2
B102	4-chloro-2-fluoro-5-nitrophenyl	4.33	773.92		2
B103	4-chloro-5-difluoromethoxy-1-methyl-1H-pyrazol-3-yl	4.4	780.87		2
B104	4-methyl-2-trifluoromethylthiazol-5-yl	4.42	765.87		2
B105	2-chloro-4-methylthiazol-5-yl	4.36	731.83		2
B106	2,3-dichloro-4-(2-methoxyethoxy)phenyl	4.38	818.88		2
B107	5-cyano-6-methylpyridin-2-yl	4.45	716.9		2
B108	2-methanesulfonyl-4-trifluoromethylphenyl	4.13	822.89		2
B109	2,4-dichloro-3-methoxyphenyl	4.46	774.84		2
B110	3-cyanomethylphenyl	3.95	715.89		2
B111	pyrimidin-5-yl	3.55	678.85		2
B112	5-tert-butyl-2-methyl-2H-pyrazol-3-yl	4.41	736.95		2
B113	2-methyl-5-trifluoromethyl-2H-pyrazol-3-yl	4.29	748.9		2
B114	2-chloro-4-methanesulfonyl-3-methoxyphenyl	4.03	818.87		2

Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
B115	3-chloro-2-trifluoromethyl-pyridin-4-yl	4.3	779.85		2
B116	4-methylsulfanyl-2-nitrophenyl	4.2	767.85		2
B117	3-cyano-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl	3.82	705.98		2
B118	2-(2-chlorophenyl)-4-trifluoromethyl-thiazol-5-yl	4.85	861.85		2
B119	4-methanesulfonyl-3-methoxymethyl-2-methylphenyl	3.91	812.93		2
B120	3-[diethoxyphosphinyl]oxy]Phenyl	4.09	828.93		2
B121	2-isopropylsulfanylpyridin-3-yl	4.44	751.93		2
B122	2-(3-ethoxypropyl)-6-trifluoromethyl-pyridin-3-yl	4.48	831.96		2
B123	4'-chloro-4-methylbiphenyl-3-yl	4.81	800.91		2
B124	thiophen-3-yl	4.02	682.83		2
B125	2-methylsulfanyl-4-trifluoromethylphenyl	4.48	790.86		2
B126	4-trifluoromethylpyridin-5-yl	3.96	745.86		2
B127	2-methyl-6-trifluoromethylpyridin-3-yl	4.19	759.89		2
B128	2,6-dichloronicotin-3-yl	4.31	745.8		2
B129	6-methoxy-3-bromo-2-methylphenyl	4.49	798.83		2
B130	2-chloro-4-fluoro-5-nitrophenyl	4.31	773.84		2
B131	3-difluoromethyl-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl	3.9	730.88		2
B132	2-methoxypyridin-3-yl	4.47	707.87		2
B133	4-chloro-2-methyl-5-trifluoromethyl-2H-pyrazol-3-yl	4.64	782.84		2
B134	2-methyl-4-trifluoromethylthiazol-5-yl	4.19	765.83		2
B135	2-chloro-4-bromophenyl	4.55	788.8		2
B136	4-chloro-1-methyl-5-trifluoromethyl-1H-pyrazol-3-yl	4.56	782.84		2
B137	5-methylthiophen-2-yl	4.2	696.82		2
B138	4-bromo-2-methylphenyl	4.44	768.8		2
B139	4-bromo-3-methoxy-2-methylphenyl	4.42	798.83		2
B140	5-tert-butyl-2-methoxyphenyl	4.92	762.94		2
B141	3-chloro-5-trifluoromethylpyridin-2-yl	4.57	779.82		2
B142	5-chloro-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-yl	4.14	728.85		2
B143	4,5-dichloroisothiazol-3-yl	4.63	751.75		2
B144	5-methyl-2-trifluoromethylfuran-3-yl	4.36	748.83		2
B145	3-chlorothiophen-2-yl	4.61	716.78		2
B146	2-chloro-6-methoxypyridin-4-yl	4.32	741.83		2
B147	5-chloro-4-methoxythiophen-3-yl	4.62	746.8		2
B148	2-fluoro-5-nitrophenyl	4.34	739.85		2
B149	3-chloro-2-fluoro-6-trifluoromethylphenyl	4.48	796.81		2

Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
B150	6-difluoromethyl-2-methoxymethylpyridin-3-yl	4.09	771.9		2
B151	2-fluoropyridin-4-yl	3.88	695.84		2
B152	1-methyl-3-trifluoromethyl-1H-pyrazol-4-yl	4.02	748.85		2
B153	2,5-difluorophenyl	4.1	712.93		2
B154	2-chloro-5-fluorophenyl	4.19	728.91		2
B155	2,4-dichlorophenyl	4.39	744.89		2
B156	2-methyl-3-chlorophenyl	4.39	724.89		2
B157	3,5-dimethyl-isoxazol-4-yl	3.96	695.86		2
B158	2,6-dichlorophenyl			116	
B159	2-chloro-4-bromo-6-methylphenyl			114	
B160	2-hydroxyl-3,5-dichlorophenyl			200	
B161	2-iodo-3-methyl-4-nitrophenyl			175	
B162	2-bromo-3-methyl-4-nitrophenyl			172	
B163	2-chloro-3-methyl-4-nitrophenyl			127	
B164	2,6-dimethoxyphenyl			105	
B165	3,5-dimethyl-4-nitrophenyl			218	
B166	2-methoxy-6-fluorophenyl			112	
B167	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl			183	
B168	3,5-difluorophenyl			83	
B169	2,5-difluorophenyl			154	
B170	3-chloro-4-nitrophenyl			95	
B171	3-acetate-4-nitrophenyl			100	
B172	2,6-difluorophenyl			177	
B173	3-ethoxy-4-nitrophenyl			238	
B174	3-amino-4-nitrophenyl			205	
B175	3-(N,N-dimethylamino)-4-nitrophenyl			181	
B176	2,6-difluoro-4-cyanophenyl			214	
B177	2-methoxy-4-nitrophenyl			190	
B178	2-trifluoromethyl-4-nitrophenyl			140	
B179	3-trifluoromethyl-4-nitrophenyl			142	
B180	2,4-dinitrophenyl			246	
B181	3-hydroxyl-4-nitrophenyl			185	
B182	2-chloro-4-methylphenyl			172	
B183	2-chloro-3-nitrophenyl			123	
B184	2,3-dichlorophenyl			136	
B185	3,5-dichloropyridin-2-yl			181	
B186	2,5-dichlorothiophen-3-yl			188	
B187	5-bromopyrimidin-2-yl			204	
B188	3-trifluoromethylpyridin-2-yl			175	
B189	2,4,6-trifluorophenyl			179	
B190	3-methyl-4-nitrophenyl			107	
B191	2-fluoro-4-nitrophenyl			212	

Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
B192	3-fluoro-4-nitrophenyl			104	
B193	3-nitrophenyl			98	
B194	2-fluoro-pyridin-3-yl			167	
B195	3,4-dinitrophenyl			114	
B196	2-methyl-4-nitrophenyl			104	
B197	2-fluoro-4-nitrophenyl			199	
B198	2-chloro-4-cyanophenyl			211	
B202	2-chloro-pyridin-3-yl	2.05	710		4
B203	2-methoxy-4-cyano-6-hydroxyphenyl	2.1	599		4
B204	4-cyano-pyridin-3-yl	2.04	701		4
B205	3-fluoro-4-cyanophenyl	2.19	826		3
B206	3-bromo-4-cyanophenyl	2.18	778		3
B207	3-methoxy-4-nitrophenyl	2.12	750		4
B208	5-cyanopyridin-2-yl			208-210	
B209	4-bromo-2,6-dichlorophenyl			250	
B210	2,4-dichloropyrimidin-5-yl			114-115	
B211	2,4-dichloro-6-methylphenyl			113-118	
B212	2-methyl-4-fluoro-5-nitrophenyl			83-84	
B213	2-methyl-4-cyano-5-nitrophenyl			158-161	

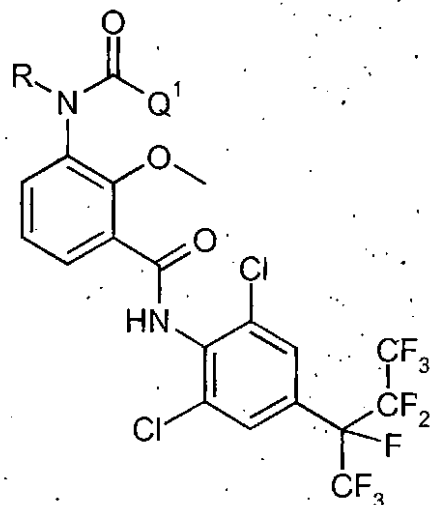
Table C:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
C1	2-chloro-4-fluorophenyl	2.19	686.7	1
C2	4-cyano-2-methylphenyl	-	-	-
C3	2-fluorophenyl	2.24	650.8	1

Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
C4	2-methylphenyl	2.16	646.8	1
C5	2-chlorophenyl	2.17	666.7	1
C6	4-cyanophenyl	2.05	657.8	1
C7	4-nitrophenyl	2.05	677.9	1
C8	4-methylphenyl	2.2	646.8	1
C9	4-fluoro-2-methylphenyl	2.18	664.8	1
C10	5-chloro-2-fluorophenyl	2.34	686.7	1
C11	2-chloro-4-nitrophenyl	2.16	713.7	1
C12	furan-2-yl	2.05	622.8	1
C13	4-trifluoromethoxyphenyl	2.28	716.8	1
C14	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	2.27	718.8	1
C15	4-trifluoromethylphenyl	2.05	700.8	1
C16	2-trifluoromethoxyphenyl	2.26	716.8	1
C17	2-methoxyphenyl	2.27	662.8	1
C18	phenyl	2.12	634.7	1
C19	4-fluorophenyl	2.13	650.8	1
C20	2-trifluoromethylphenyl	2.17	700.7	1
C21	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	2.04	654.7	1
C22	2,3-difluorophenyl	2.24	668.7	1
C23	2,4-difluorophenyl	2.25	668.7	1
C24	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	2.34	718.7	1
C25	2-methyl-4-nitrophenyl	2.15	690	3
C26	2, 4-dichlorophenyl	2.22	699	3
C27	2, 3-dichlorophenyl	2.2	699	3
C28	3-nitrophenyl	2.13	676	3
C29	2-chloropyridine-3-yl	2.07	666	3
C30	3,5-dimethylisoxazol-4-yl	2.09	650	3
C31	2-fluoro-4-cyanophenyl	2.14	674	3
C32	2-methyl-3-chlorophenyl	2.21	679	3
C33	2,4,6-trifluorophenyl	2.15	685	3
C34	2-fluoropyridin-3-yl	2.12	650	3
C35	3-methyl-4-nitrophenyl	2.17	690	3
C36	2-fluoro-4-nitrophenyl	2.17	694	3
C37	3-fluoro-4-nitrophenyl	2.14	694	3
C38	3,4-dinitrophenyl	2.14	721	3
C39	3-hydroxy-4-nitrophenyl	2.11	692	3
C40	2-chloro-4-cyanophenyl	2.13	690	3
C41	3-fluoro-4-cyanophenyl	2.12	674	3
C42	4-fluoro-3-cyanophenyl	2.11	674	3
C43	2-chloro-4-methylphenyl	2.21	679	3
C44	2-chloro-3-nitrophenyl	2.14	710	3

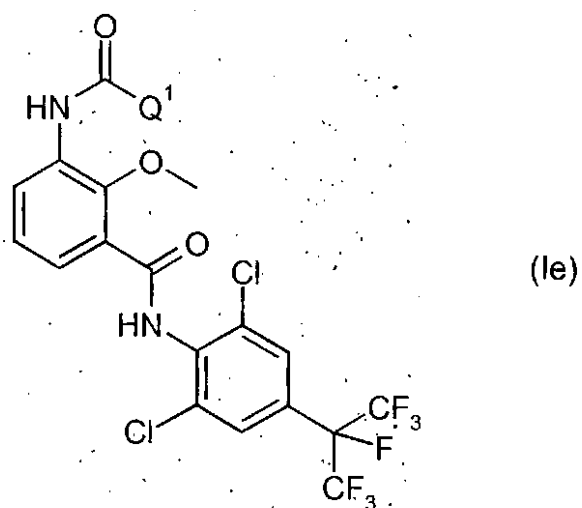
Table D:



Comp. No.	Q ¹	R ¹	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
D1	phenyl	Me	3.92	646.98	2
D2	phenyl	Et	4.07	660.95	2
D3	4-cyanophenyl	Me	3.8	671.94	2
D4	4-cyanophenyl	Et	3.96	685.97	2
D5	4-fluoro-2chlorophenyl	Me	4.1	698.9	2
D6	4-fluoro-2chlorophenyl	Et	4.23	712.87	2
D7	2-fluorophenyl	Me	3.94	664.88	2
D8	2-methylphenyl	Me	4.02	660.96	2
D9	2-chlorophenyl	Me	4.05	682.92	2
D10	4-methylphenyl	Me	4.06	660.97	2
D11	4-fluoro-2-methylphenyl	Me	4.04	678.96	2
D12	5-chloro-2-fluorophenyl	Me	4.13	698.93	2
D13	2-chloro-4-nitrophenyl	Me	4.08	725.94	2
D14	furan-2-yl	Me	3.75	636.92	2
D15	4-trifluoromethoxyphenyl	Me	4.26	730.94	2
D16	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	Me	4.23	732.95	2
D17	4-trifluoromethylphenyl	Me	4.19	714.95	2
D18	2-trifluoromethoxyphenyl	Me	4.21	730.94	2
D19	2-methoxyphenyl	Me	3.9	676.97	2
D2	4-fluorophenyl	Me	3.95	664.96	2
D21	2-trifluoromethylphenyl	Me	4.15	714.95	2
D22	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	Me	3.79	668.94	2
D23	2,3-difluorophenyl	Me	3.97	682.94	2
D24	2,4-difluorophenyl	Me	4.01	682.96	2
D25	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	Me	4.22	732.95	2
D26	2-fluorophenyl	Et	4.1	678.97	2
D27	2-methylphenyl	Et	4.17	674.99	2
D28	2-chlorophenyl	Et	4.18	694.94	2
D29	4-methylphenyl	Et	4.2	674.99	2

Comp. No.	Q ¹	R ¹	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
D30	4-fluoro-2-methylphenyl	Et	4.19	692.99	2
D31	5-chloro-2-fluorophenyl	Et	4.29	712.94	2
D32	2-chloro-4-nitrophenyl	Et	4.22	739.84	2
D33	furan-2-yl	Et	3.93	650.95	2
D34	4-trifluoromethoxyphenyl	Et	4.4	744.96	2
D35	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	Et	4.34	746.92	2
D36	4-trifluoromethylphenyl	Et	4.34	728.93	2
D37	2-trifluoromethoxyphenyl	Et	4.34	744.91	2
D38	2-methoxyphenyl	Et	4.05	690.93	2
D39	4-fluorophenyl	Et	4.11	678.95	2
D40	2-trifluoromethylphenyl	Et	4.26	728.92	2
D41	2,3-difluorophenyl	Et	4.14	696.89	2
D42	2,4-difluorophenyl	Et	4.14	696.89	2
D43	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	Et	4.34	746.92	2
D44	2-chloro-4-cyanophenyl	Me	2.11	704	4
D45	2-chloro-4-cyanophenyl	Et	2.13	718	4
D46	4-nitrophenyl	Me	2.1	690	4
D47	4-nitrophenyl	Et	2.15	704	4
D48	2,6-difluorophenyl	Me	2.12	681	4
D49	2,6-difluorophenyl	Et	2.17	696	4

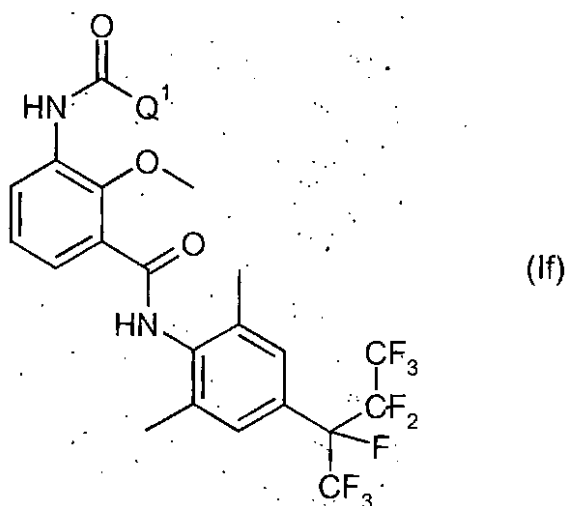
Table E:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
E1	2-fluorophenyl	4.27	600.78		2
E2	2-methylphenyl	4.13	596.83		2
E3	2-chlorophenyl	4.11	616.78		2
E4	4-cyanophenyl	3.87	607.81		2
E5	4-nitrophenyl	4.06	627.82		2
E6	4-methylphenyl	4.17	596.86		2

E7	4-fluoro-2-methylphenyl	4.12	614.83		2
E8	5-chloro-2-fluorophenyl	4.46	634.78		2
E9	2-chloro-4-nitrophenyl	4.19	661.78		2
E10	furan-2-yl	3.87	572.85		2
E11	4-trifluoromethoxyphenyl	4.35	666.82		2
E12	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.31	668.82		2
E13	4-trifluoromethylphenyl	4.3	650.85		2
E14	2-trifluoromethoxyphenyl	4.3	666.87		2
E15	2-methoxyphenyl	4.29	612.87		2
E16	phenyl	4	582.87		2
E17	4-fluorophenyl	4.04	600.85		2
E18	2-trifluoromethylphenyl	4.13	650.88		2
E19	2-chloro-4-fluorophenyl	4.16	634.82		2
E20	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	3.81	604.82		2
E21	2,3-difluorophenyl	4.24	618.85		2
E22	2,4-difluorophenyl	4.31	618.85		2
E23	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	4.48	668.86		2
E24	2,5-difluoro-4-cyanophenyl			192	
E25	2-methyl-4-cyanophenyl	2.08	620		4
E26	3-methyl-4-nitrophenyl	2.13	640		4
E27	2-methyl-4-nitrophenyl	2.11	640		4
E28	2,4,6-trifluorophenyl	2.11	635		4
E29	2,6-difluorophenyl	2.09	617		4

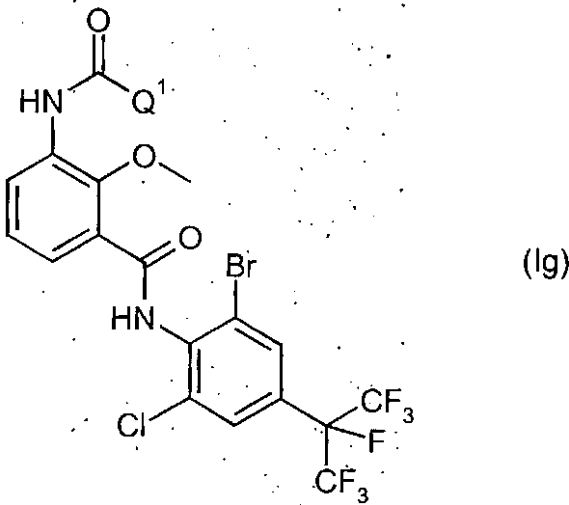
Table F:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
F1	2-fluorophenyl	4.2	610.92		2
F2	2-methylphenyl	4.05	606.96		2
F3	2-chlorophenyl	4.07	626.9		2
F4	furan-2-yl	3.85	582.98		2

F5	4-trifluoromethoxyphenyl	4.3	676.94		2
F6	3-trifluoromethyl-4-fluorophenyl	4.28	678.96		2
F7	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	3.8	614.95		2
F8	2,3-difluorophenyl	4.2	628.96		2
F9	2,4-difluorophenyl	4.23	628.97		2
F10	2,4,6-trimethylphenyl	4.29	635.03		2
F11	2,3-dimethylphenyl	4.17	621.05		2
F12	2-fluoro-5-chlorophenyl	4.42	644.97		2
F13	2-fluoro-4-chlorophenyl	4.42	644.97		2
F14	2-fluoro-4-trifluoromethylphenyl	4.43	679		2
F15	2,4-dichlorophenyl	4.29	660.95		2
F16	2-chloro-4-methanesulfonylphenyl	3.78	704.95		2
F17	3,4-dichlorophenyl	4.38	660.91		2
F18	4-methanesulfonylphenyl	3.64	670.96		2
F19	4-chlorophenyl	4.19	626.97		2
F20	3-fluorophenyl	4.05	611		2
F21	3-cyanophenyl	3.9	618		2
F22	3-methoxyphenyl	4.03	623		2
F23	3-methyl-4-nitrophenyl			179	
F24	2-methyl-4-nitrophenyl			203	
F25	2,4,6-trifluorophenyl			194	
F26	4-trifluoromethylphenyl			163	
F27	2-methyl-4-fluorophenyl			178	
F28	2-chloro-4-nitrophenyl			207	
F29	4-nitrophenyl			105	
F30	2-chloro-4-fluorophenyl			164	

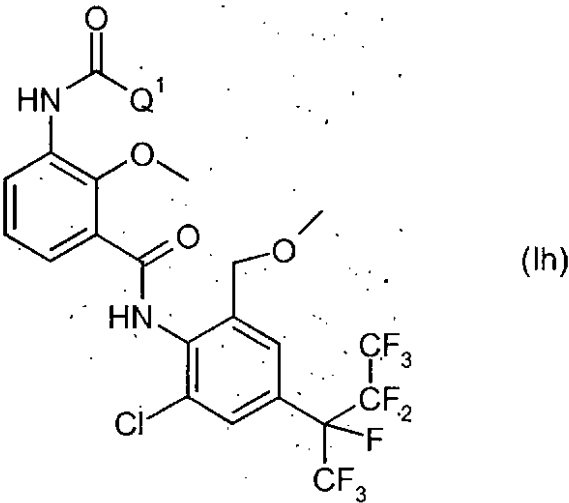
Table G:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
G1	2-methyl-4-cyanophenyl			190	
G2	2-chloro-4-cyanophenyl			211	

G3	2,4,6-trifluorophenyl			181	
G4	2,6-difluoro-4-cyanophenyl			118	
G5	2-chloro-4-fluorophenyl	4.23	679.1	183	2
G6	2-fluorophenyl	4.3	645.15		2
G7	2-methylphenyl	4.15	641.19		2
G8	2-chlorophenyl	4.17	661.13		2
G9	4-cyanophenyl	3.93	652.17		2
G10	4-nitrophenyl	4.08	672.14		2
G11	4-methylphenyl	4.23	641.19		2
G12	4-fluoro-2-methylphenyl	4.19	659.17		2
G13	5-chloro-2-fluorophenyl	4.52	679.12		2
G14	2-chloro-4-nitrophenyl	4.2	706.1		2
G15	furan-2-yl	3.94	617.14		2
G16	4-trifluoromethoxyphenyl	4.41	711.11		2
G17	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.4	713.12		2
G18	4-trifluoromethylphenyl	4.36	695.12		2
G19	2-trifluoromethoxyphenyl	4.37	711.11		2
G20	2-methoxyphenyl	4.43	657.17		2
G21	phenyl	4.07	627.15		2
G22	4-fluorophenyl	4.09	645.15		2
G23	2-trifluoromethylphenyl	4.18	695.12		2
G24	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	3.88	649.12		2
G25	2,3-difluorophenyl	4.3	663.15		2
G26	2,4-difluorophenyl	4.34	663.15		2
G27	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	4.54	713.12		2

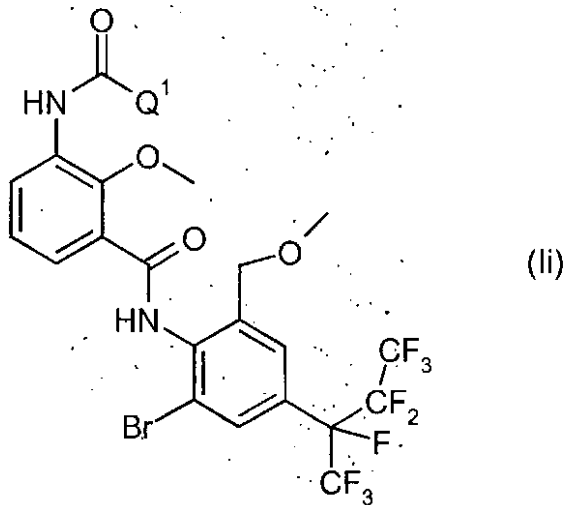
Table H:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
H1	2-methyl-4-cyanophenyl			110	
H2	2,4,6-trifluorophenyl			138	
H3	2-fluorophenyl	4.44	661.33		2

H4	2-methylphenyl	4.32	657.37		2
H5	2-chlorophenyl	4.33	677.32		2
H6	4-cyanophenyl	4.12	668.35		2
H7	4-nitrophenyl	4.22	688.35		2
H8	4-methylphenyl	4.38	657.24		2
H9	4-fluoro-2-methylphenyl	4.35	675.36		2
H10	5-chloro-2-fluorophenyl	4.68	695.29		2
H11	2-chloro-4-nitrophenyl	4.34	722.28		2
H12	furan-2-yl	4.13	633.33		2
H13	4-trifluoromethoxyphenyl	4.55	727.29		2
H14	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.51	729.3		2
H15	4-trifluoromethylphenyl	4.5	711.3		2
H16	2-trifluoromethoxyphenyl	4.53	727.32		2
H17	2-methoxyphenyl	4.52	673.35		2
H18	phenyl	4.2	643.27		2
H19	4-fluorophenyl	4.24	661.27		2
H20	2-trifluoromethylphenyl	4.34	711.3		2
H21	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	4.04	665.3		2
H22	2,3-difluorophenyl	4.48	679.32		2
H23	2,4-difluorophenyl	4.48	679.29		2
H24	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	4.66	729.3		2
H25	2-chloro-4-fluorophenyl	4.39	695.26	98	2

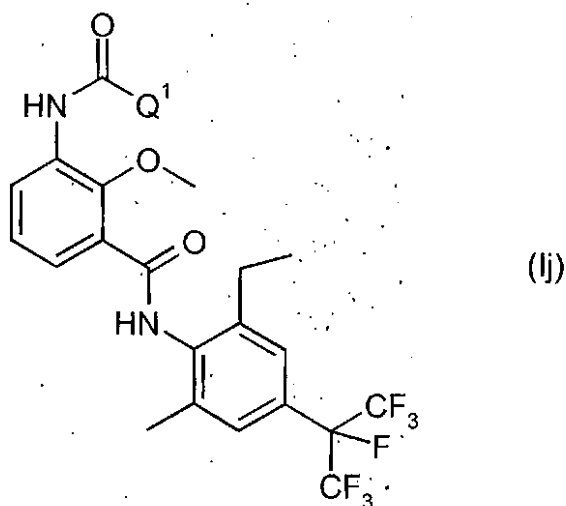
Table I:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
I1	2-methyl-4-cyanophenyl			130	-
I2	2,4,6-trifluorophenyl			190	-
I3	2-fluorophenyl	4.47	705.3		2
I4	2-methylphenyl	4.3	701.3		2
I5	2-chlorophenyl	4.33	721.2		2
I6	4-cyanophenyl	4.18	712.3		2

I7	4-nitrophenyl	4.22	732.3		2
I8	4-methylphenyl	4.39	701.29		2
I9	4-fluoro-2-methylphenyl	4.39	719.29		2
I10	5-chloro-2-fluorophenyl	4.66	739.24		2
I11	2-chloro-4-nitrophenyl	4.5	766.26		2
I12	furan-2-yl	4.12	677.26		2
I13	4-trifluoromethoxyphenyl	4.55	771.28		2
I14	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.51	773.29		2
I15	4-trifluoromethylphenyl	4.5	755.29		2
I16	2-trifluoromethoxyphenyl	4.54	771.28		2
I17	2-methoxyphenyl	4.52	717.34		2
I18	phenyl	4.23	687.32		2
I19	4-fluorophenyl	4.24	705.32		2
I20	2-trifluoromethylphenyl	4.34	755.29		2
I21	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	4.05	709.29		2
I22	2,3-difluorophenyl	4.45	723.27		2
I23	2,4-difluorophenyl	4.5	723.31		2
I24	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	4.68	773.29		2
I25	2-chloro-4-fluorophenyl	4.4	739.26	113	2

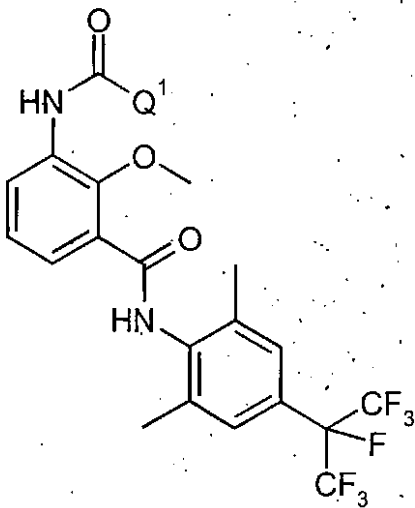
Table J:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	MP (°C)	LC-MS Method
J1	2-chloro-4-cyanophenyl			110	
J2	2,6-difluoro-4-cyanophenyl			113	
J3	2,4,6-trifluorophenyl			96	
J4	2-methyl-4-cyanophenyl			102	
J5	2-fluorophenyl	4.34	575.36		2
J6	2-methylphenyl	4.16	571.33		2
J7	2-chlorophenyl	4.15	591.35		2
J8	4-cyanophenyl	3.99	582.38		2
J9	4-nitrophenyl	4.07	602.36		2

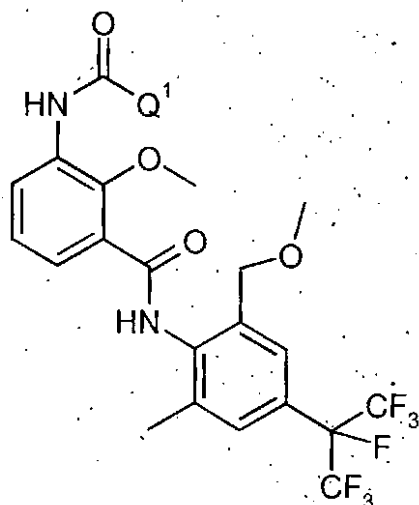
J10	4-methylphenyl	4.22	571.4		2
J11	4-fluoro-2-methylphenyl	4.19	589.4		2
J12	5-chloro-2-fluorophenyl	4.52	609.32		2
J13	2-chloro-4-nitrophenyl	4.23	636.31		2
J14	furan-2-yl	3.95	547.36		2
J15	4-trifluoromethoxyphenyl	4.41	641.32		2
J16	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.4	643.33		2
J17	4-trifluoromethylphenyl	4.37	625.33		2
J18	2-trifluoromethoxyphenyl	4.38	641.32		2
J19	2-methoxyphenyl	4.37	587.38		2
J20	phenyl	4.08	557.36		2
J21	4-fluorophenyl	4.08	575.36		2
J22	2-trifluoromethylphenyl	4.19	625.33		2
J23	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	3.87	579.33		2
J24	2,3-difluorophenyl	4.33	593.36		2
J25	2,4-difluorophenyl	4.34	593.36		2
J26	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	4.54	643.33		2
J27	2-chloro-4-fluorophenyl	4.23	609.29	88	2

Table K:



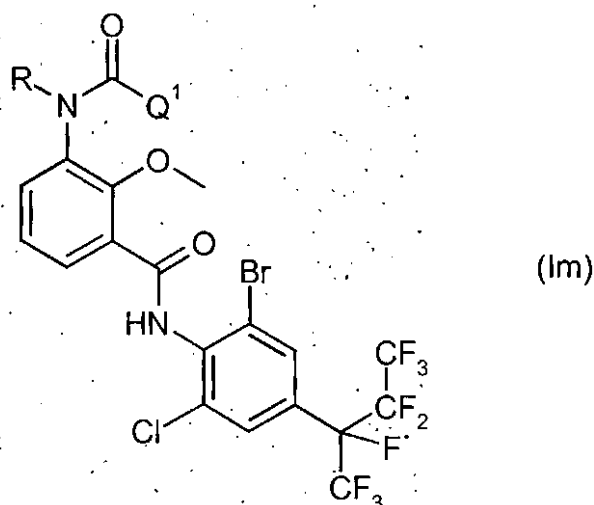
Comp. No.	Q ¹	MP (°C)
K1	2,4,6-trifluorophenyl	173
K2	4-nitrophenyl	190
K3	2-chloro-4-cyanophenyl	133
K4	2-methyl-4-cyanophenyl	152

Table L:



Comp. No.	Q ¹	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
L1	2-fluorophenyl	4.34	639.5	2
L2	2-methylphenyl	4.2	635.53	2
L3	2-chlorophenyl	4.21	655.45	2
L4	4-cyanophenyl	4.01	646.52	2
L5	4-nitrophenyl	4.11	666.48	2
L6	4-methylphenyl	4.26	635.52	2
L7	4-fluoro-2-methylphenyl	4.23	653.23	2
L8	5-chloro-2-fluorophenyl	4.53	673.43	2
L9	2-chloro-4-nitrophenyl	4.22	700.45	2
L10	furan-2-yl	3.98	611.52	2
L11	4-trifluoromethoxyphenyl	4.43	705.51	2
L12	4-fluoro-3-trifluoromethylphenyl	4.4	707.51	2
L13	4-trifluoromethylphenyl	4.38	689.52	2
L14	2-trifluoromethoxyphenyl	4.4	705.29	2
L15	2-methoxyphenyl	4.41	651.52	2
L16	phenyl	4.1	621.4	2
L17	4-fluorophenyl	4.13	639.5	2
L18	2-trifluoromethylphenyl	4.22	689.51	2
L19	2-chloro-4-fluorophenyl	4.25	673.48	2
L20	4-methyl-1,2,3-thiadiazol-5-yl	3.93	643.46	2
L21	2,3-difluorophenyl	4.33	657.02	2
L22	2,4-difluorophenyl	4.36	657.51	2
L23	2-fluoro-5-trifluoromethylphenyl	4.55	707.51	2

Table M:



Comp. No.	Q ¹	R	RT (min)	MH ⁺	LC-MS Method
M1	2-methyl-4-cyanophenyl	Et	2.14	742	4
M2	3-methyl-4-nitrophenyl	Et	2.17	762	4

Biological examples

- 5 These Examples illustrate the insecticidal and acaricidal properties of the compounds of formula (I). The tests were performed as follows:

Spodoptera littoralis (Egyptian cotton leafworm):

- 10 Cotton leaf discs were placed on agar in a 24-well microtiter plate and sprayed with test solutions at an application rate of 200 ppm. After drying, the leaf discs were infested with 5 L1 larvae. The samples were checked for mortality, feeding behavior, and growth regulation 3 days after treatment (DAT).

- The following compound gave at least 80% control of *Spodoptera littoralis*: A1 to A22, B202 to B207, B188, B187, B186, B185, B159, B158, B152, B151, B150, B166, B148, B147, B146, B144, B142, B141, B139, B138, B137, B135, B134, B131, B130, B128, B127, B126, B124, B120, B117, B116, B115, B114, B113, B112, B111, B110, B109, B105, B104, B102, B101, B100, B99, B98, B97, B96, B95, B94, B93, B92, B89, B88, B87, B86, B85, B84, B82, B81, B83, B80, B77, B74, B73, B72, B71, B70, B69, B68, B67, B66, B65, B64, B62, B61, B58, B56, B55, B54, B52, B48, B45, B44, B42, B39, B37, B36, B32, B31, B30, B28, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B170, B169, B168, B167, B154, B172, B153, B180, B179, B178, B182, B184, B183, B156, B195, B194, B193, B155, B192, B191, B190,
- 15
- 20

B189, B157, B198, B197, B196, B24, B23, B22, B21, B20, B19, B18, B17, B16, B15, B14, B13, B12, B11, B10, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B3, B2, B1, C1 to C15, C18 to C23, C25 to C36, D1 to D13, D15, D17, D20, D23, D22, D26 to D30, D32 to D36, D39 to D42, D44 to D49, E1 to E22, E24, E25 to E29, F1 to F9, F12, F13, F15 to F30, G1 to G5, K1 to K4, M1, M2.

Heliothis virescens (Tobacco budworm):

Eggs (0-24 h old) were placed in 24-well microtiter plate on artificial diet and treated with test solutions at an application rate of 200 ppm (concentration in well 18 ppm) by pipetting.

After an incubation period of 4 days, samples were checked for egg mortality, larval mortality, and growth regulation.

The following compound gave at least 80% control of *Heliothis virescens*: A1, A4, A6 to A21, B202 to B207, B188, B185, B163, B162, B161, B159, B158, B152, B151, B150, B166, B148, B146, B144, B141, B139, B138, B137, B135, B134, B131, B130, B128, B127, B126, B125, B124, B120, B117, B116, B115, B114, B113, B112, B111, B110, B109, B104, B102, B101, B100, B99, B98, B97, B96, B95, B94, B93, B89, B88, B87, B86, B85, B84, B82, B81, B83, B80, B77, B74, B73, B72, B70, B69, B68, B67, B66, B65, B64, B62, B61, B58, B56, B55, B52, B48, B45, B44, B42, B39, B36, B32, B31, B30, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B171, B170, B169, B168, B167, B172, B153, B180, B179, B178, B182, B184, B183, B156, B195, B194, B193, B155, B192, B191, B190, B189, B157, B198, B197, B23, B22, B21, B20, B19, B18, B17, B15, B13, B12, B11, B10, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B3, B2, B1, C1 to C23, C25 to C29, C31 to C35, D1 to D7, D10 to D13, D15, D16, D20, D22 to D24, D26, D28 to D30, D32, D35, D36, D39 to D42, D44 to D49, E1 to E24, E25 to E29, F1 to F9, F12, F13, F15 to F30, G1 to G5, H1, H2, H25, I1, I2, I25, J2 to J4, J27, K1 to K4, M1, M2.

Plutella xylostella (Diamond back moth):

24-well microtiter plate (MTP) with artificial diet was treated with test solutions at an application rate of 200 ppm (concentration in well 18 ppm) by pipetting. After drying, the MTP's were infested with L2 larvae (7-12 per well). After an incubation period of 6 days, samples were checked for larval mortality and growth regulation.

The following compound gave at least 80% control of *Plutella xylostella*: A1, A2, A4 to A22, B202 to B207, B187, B185, B164, B163, B162, B161, B160, B159, B158, B152, B151, B150, B166, B148, B146, B144, B141, B139, B138, B137, B135, B134, B131, B130, B128, B127, B126, B125, B124, B120, B117, B116, B115, B114, B113, B112, B111, B110, B109, 5 B105, B104, B102, B101, B100, B99, B98, B97, B96, B95, B94, B93, B89, B88, B87, B86, B85, B84, B82, B81, B83, B80, B77, B74, B73, B72, B71, B69, B67, B66, B65, B64, B62, B61, B58, B57, B56, B55, B54, B52, B48, B45, B44, B42, B39, B37, B36, B32, B31, B28, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B171, B170, B169, B168, B154, B172, B153, B180, B179, B178, B182, B184, B183, B156, B195, B194, B193, B155, B192, B191, B190, B189, 10 B198, B197, B196, B23, B22, B21, B20, B19, B18, B16, B15, B14, B13, B12, B11, B10, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B3, B2, B1, C1 to C9, C11 to C13, C15, C18 to C23, C25 to C29, C31 to C35, D1 to D13, D15, D16, D20, D22 to D24, D26 to D30, D32, D36, D39 to D42, D44 to D49, E4 to E22, E24, E25 to E29, F1 to F9, F11, F15 to F27, F29, F30, G1 to G5, H1, H2, H25, I1, I2, I25, J1 to J4, J27, K1 to K4, M1, M2.

15

Diabrotica balteata (Corn root worm):

A 24-well microtiter plate (MTP) with artificial diet was treated with test solutions at an application rate of 200 ppm (concentration in well 18 ppm) by pipetting. After drying, the MTP's were infested with L2 larvae (6-10 per well). After an incubation period of 5 days, 20 samples were checked for larval mortality and growth regulation.

The following compound gave at least 80% control of *Diabrotica balteata*: A1, A3 to A13, A15 to A20, A22, B202 to B206, B187, B185, B163, B162, B161, B159, B158, B151, B150, B166, B146, B144, B137, B135, B134, B131, B130, B128, B127, B126, B125, B120, B117, B116, B115, B113, B112, B111, B110, B109, B101, B100, B98, B97, B96, B93, B92, B89, 25 B87, B86, B85, B84, B82, B81, B83, B80, B74, B73, B72, B69, B67, B66, B64, B62, B61, B58, B56, B55, B54, B52, B45, B44, B42, B37, B36, B32, B30, B28, B27, B26, B25, B174, B170, B169, B168, B167, B154, B153, B180, B179, B178, B181, B184, B183, B156, B194, B155, B192, B22, B21, B20, B18, B9, B5, B4, B3, C1 to C13, D15, C19 to C23, C25 to C29, C31 to C36, D1 to D13, D15 to D17, D20 to D23, D26 to D30, D32, D36, D39, D42, 30 D41, D44 to D49, E1 to E7, E8, E9, E11, E13, E16 to E22, E24, E25 to E29, F1, F3, F7 to F9, F12, F15 to F23, F24 to F30, G1 to G5, H2, H25, I1, I2, I25, J1 to J4, J27, K1 to K4, M2.

Thrips tabaci (Onion thrips):

Sunflower leaf discs were placed on agar in a 24-well microtiter plate and sprayed with test solutions at an application rate of 200 ppm. After drying, the leaf discs were infested with an aphid population of mixed ages. After an incubation period of 7 days, samples were checked for mortality.

The following compounds gave at least 80% control of *Thrips tabaci*: A2 to A13, A17 to A20, A22, B202, B204, B163, B162, B161, B151, B150, B146, B137, B135, B134, B127, B124, B115, B113, B112, B111, B110, B109, B101, B97, B93, B92, B89, B87, B82, B81, B80, B74, B73, B67, B66, B65, B64, B58, B55, B54, B52, B49, B46, B45, B44, B42, B37, B36, B28, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B169, B168, B167, B154, B172, B153, B180, B178, B184, B183, B156, B155, B192, B191, B190, B21, B20, B9, B4, B1, C1 to C9, C11, C13, C15, C18, C19, C20 to C23, C25, C26, C29, C31, C33, D1 to D5, D9, D12, D15, D17, D20, D22, D23, D26 to D30, D32 to D36, D44 to D49, E1 to E7, E9, E11, E12, E13, E16 to E22, E25, E27 to E29, F3, F7, F8, F20, F21, F29, F30, H25, I2, I25, J27, K1, K2, M1.

Tetranychus urticae (Two-spotted spider mite):

Bean leaf discs on agar in 24-well microtiter plates were sprayed with test solutions at an application rate of 200 ppm. 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.

The following compounds gave at least 80% control of *Tetranychus urticae*: A2 to A7, A10, A11, A16 to A18, A22, B202, B204, B159, B158, B151, B150, B139, B138, B135, B134, B128, B127, B113, B111, B110, B109, B106, B104, B101, B98, B97, B96, B93, B82, B81, B80, B74, B73, B69, B67, B66, B65, B64, B61, B55, B54, B42, B36, B28, B26, B174, B176, B171, B170, B169, B168, B154, B172, B153, B180, B179, B178, B184, B183, B156, B195, B194, B193, B155, B192, B191, B190, B189, B198, B197, B196, B23, B21, B19, B15, B13, B11, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B2, B1, C2, C4 to C9, C11, C12, C13, C15, C19 to C23, C25, C26, C29, C33, D2 to D6, D8, D11, D13, D20, D22, D32, D39, D44 to D49, E4, E5, E7, E9, E12, E13, E17, E19, E20, E24, E25, E27 to E29, F21, F18, F15, F7, F5, F1, F28, F27, F25, F24, F29, F30, G1 to G5, J2, J27, K1 to K4, M1.

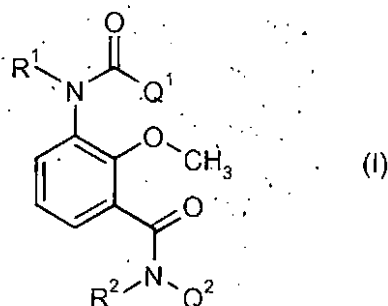
Myzus persicae (Green peach aphid):

Sunflower leaf discs were placed on agar in a 24-well microtiter plate and sprayed with test solutions at an application rate of 200 ppm. After drying, the leaf discs were infested with an aphid population of mixed ages. After an incubation period of 6 DAT, samples were checked for mortality.

The following compounds gave at least 80% control of *Myzus persicae*: A3, A4, A10, A11, A13, A17, A18, A22, B204, B151, B150, B137, B124, B111, B106, B98, B93, B89, B82, B80, B66, B55, B54, B45, B44, B42, B37, B36, B28, B26, B174, B168, B153, B156, B155, B189, B19, B18, B15, B8, B7, B6, B5, B4, B2, C1, C4 to C6, C8, C18, C19, D1 to D4, D20, D21, D39, D45, D48, D49, E1, E2, E4 to E6, E9, E11, E12, E13, E16, E17, E21, E25, E27 to E29, F7, F30, G3, G4, G5, H1, H25, I2, I25, J27, K2, K27.

CLAIMS

1. A compound of formula (I)



5 wherein

Q^1 is aryl or heterocyclyl, each optionally substituted by one to five R^3 substituents, which may be the same or different;

Q^2 is selected from

- 2-ethyl-6-methyl-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl,
- 10 2-bromo-6-chloro-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl,
- 2,6-dichloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl,
- 2,6-dimethyl-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl,
- 2-chloro-6-methoxymethyl-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl, and
- 2-bromo-6-methoxymethyl-4-(nonafluorobut-2-yl)phenyl;

15 R^1 is selected from hydrogen, C_1 - C_8 alkyl, C_1 - C_8 alkylcarbonyl, C_1 - C_8 alkoxycarbonyl and C_1 - C_4 alkyl- $C(O)NH_2$;

R^2 is selected from hydrogen, C_1 - C_8 alkyl, C_1 - C_8 alkylcarbonyl, C_1 - C_8 alkoxycarbonyl and C_1 - C_4 alkyl- $C(O)NH_2$; and

R^3 is selected from cyano, nitro, halogen, hydroxyl, acetoxy, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkylthio, C_1 - C_4 alkoxy- C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy- C_1 - C_4 alkoxy, CN - C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkyl- $C(O)O$, C_1 - C_4 alkyl- $S(O)_2$, NH_2 , C_1 - C_4 alkylNH, $(C_1$ - C_4 alkyl) $_2N$, $(C_1$ - C_4 alkylO) $_2P(O)O$, phenyl and a five to six-membered monocyclic heterocycle containing 1 to 3 heteroatoms independently selected from nitrogen, oxygen and sulfur;

25 or an agrochemically acceptable salt or N-oxides thereof.

2. A compound according to claim 1 wherein Q^1 is selected from phenyl, biphenyl and a five to six-membered monocyclic heteroaryl group containing 1, 2 or 3 heteroatoms independently selected from nitrogen, oxygen and sulfur; each optionally substituted by one to five R^3 substituents, which may be the same or different.

3. A compound according to claim 2 wherein Q^1 is selected from phenyl, biphenyl, furanyl, pyridyl, thienyl, thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, pyrazolyl and pyrimidinyl; each optionally substituted by one to three R^3 substituents, which may be the same or different.

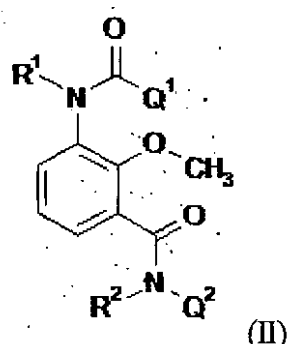
4. A compound according to any one of claims 1 to 3 wherein R^3 is selected from cyano, nitro, fluoro, chloro, bromo, iodo, hydroxyl, acetoxy, methyl, ethyl, isopropyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, methoxy, ethoxy, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, methylthio, isopropylthio, 3-ethoxy-n-propyl, methoxymethyl, 2-methoxyethoxy, CH_2CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, phenyl, N-pyrrolyl, thiadiazolyl, and pyridyl.

5. A compound according to claim 4 wherein R^3 is selected cyano, nitro, bromo, chloro, fluoro, methyl, ethyl, trifluoromethyl, methoxy and trifluoromethoxy.

6. A compound according to any one of claims 1 to 5 wherein R^1 and R^2 are both hydrogen.

7. A compound according to any one of claims 1 to 6 wherein Q^2 is selected from 2-ethyl-6-methyl-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl, 2-bromo-6-chloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl, and 2,6-dichloro-4-(nonafluoro-but-2-yl)phenyl.

8. A compound of formula (II)



wherein

Q^1 is as defined in any one of claims 1 to 3;

R^1 and R^2 are as defined in either claim 1 or claim 6;

5 R^3 is as defined in any one of claims 1, 4 or 5; and

Q^2 is selected from:

- 2-ethyl-6-methyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,
 2-bromo-6-chloro-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,
 2,6-dichloro-4-(perfluoroisopropyl)phenyl,
 10 2,6-dimethyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl, and
 2-methyl-6-methoxymethyl-4-(perfluoroisopropyl)phenyl;
 or an agrochemically acceptable salt or N-oxides thereof.

9. A method of controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying to a pest, to a locus of a pest, or to a plant susceptible to attack by a pest an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula (I) as defined in any one of claims 1 to 8,

10. An insecticidal, acaricidal, nematocidal or molluscicidal composition comprising an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula (I) as defined in any one of claims 1 to 8 together with an agrochemically acceptable diluent or carrier.

11. A composition according to claim 10 which further comprises one or more additional insecticidal, acaricidal, nematocidal or molluscicidal compounds.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2010/054864

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07C237/44 C07C255/57 A01N31/00 A01N37/18 C07D207/34 C07D213/60 C07D213/89 C07D231/14 C07D239/28 C07D261/10 C07D285/06 C07D307/36 C07D307/56 C07D313/10 C07D333/28 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07C A01N 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		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2008/000438 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; MAIENFISCH PETER [CH]; ZAMBACK WERNER) 3 January 2008 (2008-01-03) cited in the application claim 1; tables 1-25; compound 1.008	1-11
A,P	EP 2 072 501 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 24 June 2009 (2009-06-24) claim 1; table 1	1-11
☐ 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 August 2010		13/08/2010
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Scheid, Günther

000074

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2010/054864

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2008000438	A1	03-01-2008	CN 101489990 A	22-07-2009
			EP 2044006 A1	08-04-2009
			JP 2009541390 T	26-11-2009
			US 2010048715 A1	25-02-2010
EP 2072501	A1	24-06-2009	AR 069764 A1	17-02-2010
			AU 2008340737 A1	02-07-2009
			WO 2009080203 A2	02-07-2009
			PE 10992009 A1	25-07-2009
			UY 31525 A1	03-08-2009

COMPUESTOS INSECTICIDAS

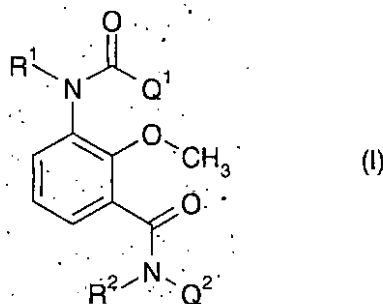
La presente invención se relaciona con derivados de bis-amida, con procesos e intermediarios para su preparación, con métodos para utilizarlos para el control de plagas de insectos, ácaros, nematodos y moluscos y con composiciones insecticidas, acaricidas, nematicidas y molusquicidas que los comprenden.

Se han descrito compuestos con propiedades insecticidas en EP 1.714.958, JP 2006/306771, WO 2006/137376, EP 1.916.236, WO 2007/017075, WO 2008/000438, WO 2008/074427 y WO 2009/049845. Existe la necesidad de métodos alternativos para el control de plagas. De preferencia, los nuevos compuestos pueden poseer propiedades insecticidas mejoradas, tales como eficacia mejorada, selectividad mejorada, toxicidad reducida, menor tendencia a generar resistencia o actividad contra un espectro más amplio de plagas. Los compuestos se pueden formular más ventajosamente o proporcionar una aplicación y retención más eficientes en los sitios de acción, o pueden ser más fácilmente biodegradables.

Se ha encontrado con sorpresa que ciertos derivados de bisamida, que están sustituidos con un grupo arilperfluorbutilo, tienen propiedades beneficiosas, lo que los convierte en particularmente adecuados para usar como insecticidas.

Por lo tanto, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula

(I)



en la cual

Q^1 es arilo o heterocíclico, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

Q^2 se selecciona entre

2-etil-6-metil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,

5 2-bromo-6-cloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,

2,6-dicloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo;

2,6-dimetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,

2-cloro-6-metoximetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo, y

2-bromo-6-metoximetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo;

10 R^1 se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquilcarbonilo C_1-C_8 , alcoxycarbonilo C_1-C_8 y alquil $C_1-C_4-C(O)NH_2$;

R^2 se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquilcarbonilo C_1-C_8 , alcoxycarbonilo C_1-C_8 y alquil $C_1-C_4-C(O)NH_2$; y

15 R^3 se selecciona entre ciano, nitro, halógeno, hidroxilo, acetoxi, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alcoxi C_1-C_4 , CN-alquilo C_1-C_4 , alquil $C_1-C_4-C(O)O$, alquil $C_1-C_4-S(O)_2$, NH_2 , alquil C_1-C_4NH , (alquil C_1-C_4) $_2N$, (alquil C_1-C_4O) $_2P(O)O$, fenilo y un heterociclo monocíclico de cinco a seis miembros que contiene de 1 a 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre

20 nitrógeno, oxígeno y azufre;

o una sal agroquímicamente aceptable o los N-óxidos del mismo.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden existir en diferentes formas de isómeros geométricos u ópticos (enantiómeros y/o diastereoisómeros) o tautoméricas. Esta invención cubre todos dichos isómeros y tautómeros y mezclas

25 de los mismos en todas las proporciones, como así también las formas isotópicas tales como compuestos deuterados.

A menos que se indique lo contrario, el alquilo, solo o como parte de un grupo de mayor tamaño tal como alcoxi, alquilcarbonilo o alcoxycarbonilo, puede ser de

cadena recta o ramificada y pueden contener, de preferencia, de 1 a 6 átomos de carbono, más preferentemente de 1 a 4 y muy preferentemente de 1 a 3. Entre los ejemplos de alquilo se incluyen metilo, etilo, *n*-propilo, *iso*-propilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, *iso*-butilo y *terc*-butilo.

5 Halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquilo pueden contener uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes e incluyen, por ejemplo, trifluormetilo, clorodifluormetilo, 2,2,2-trifluoetilo o 2,2-difluoetilo. Los grupos perfluoralquilo son grupos alquilo que están completamente sustituidos con átomos de flúor e incluyen, por ejemplo,
10 trifluormetilo, pentafluoetilo, heptafluorprop-2-ilo y nonafluor-but-2-ilo.

Arilo incluye fenilo, naftilo, antracenilo, indenilo, fenantrenilo y bifenilo, entre los cuales se prefiere fenilo.

Heteroarilo se refiere a un hidrocarburo aromático mono-, bi- o tricíclico, que contiene 3 a 14, de preferencia 4 a 10, más preferentemente 4 a 7, muy
15 preferentemente de 5 a 6 átomos de anillo, incluyendo 1 a 6, preferentemente de 1 a 4, más preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Entre los ejemplos se incluye furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo,
20 pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotienilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzotiadiazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo y naftiridinilo. Son preferibles los grupos heteroarilo monocíclicos que contienen de 4 a 7, preferentemente de 5 a 6 átomos de anillo, incluyendo 1, 2 o 3
25 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre.

Heterociclilo, incluye, en el presente contexto, heteroarilo y además puede ser un hidrocarburo monocíclico o bicíclico saturado o parcialmente insaturado que

contiene de 3 a 10 átomos de anillo, incluyendo de 1 a 6, de preferencia de 1 a 4, más preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Son ejemplos de grupos heterocíclico no aromáticos oxiranilo, azetidino, tetrahydrofuranilo, tiolanilo, pirrolidinilo, pirrolinilo, imidazolidinilo, imidazolinilo, sulfolanilo, dioxolanilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, piperidinilo, pirazolinilo, pirazolidinilo, 1,3-dioxanilo, 1,4-dioxanilo, morfolinilo, ditanilo, tiomorfolinilo, piperazinilo, azepinilo, oxazepinilo, tiazepinilo, tiazolinilo, diazapanilo, 2,3-dihidrobenzofuranilo, 3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]dioxepinilo, benzo[1,3]dioxolanilo y 2,3-dihidrobenzo[1,4]dioxinilo.

10 Los valores preferidos de Q^1 , Q^2 , R^1 , R^2 y R^3 son, en cualquier combinación, los expuestos a continuación.

De preferencia, Q^1 es arilo o heteroarilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes.

15 Más preferentemente, Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo y un grupo heteroarilo monocíclico de cinco a seis miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes.

20 Aun más preferentemente, Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotienilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzotiadiazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo y naftiridinilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R^3 y más preferentemente con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes.

25

Aun más preferentemente, Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furanilo, piridilo, tienilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo y pirimidinilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes.

5 De preferencia, R^3 se selecciona entre ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxilo, acetoxi, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alcoxi C_1-C_4 , CH_2-CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, fenilo, N-pirroilo, tiadiazolilo y piridilo.

10 Más preferentemente, R^3 se selecciona entre ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxilo, acetoxi, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoxi, etoxi, difluormetoxi, trifluormetoxi, metiltio, isopropiltio, 3-etoxi-n-propilo, metoximetilo, 2-metoxietoxi, CH_2CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, fenilo, N-pirroilo, tiadiazolilo y piridilo.

15 Muy preferentemente, R^3 se selecciona entre ciano, nitro, bromo, cloro, flúor, metilo, etilo, trifluormetilo, metoxi y trifluormetoxi.

Los Q^1 más preferidos son los definidos en este documento, en los ejemplos y compuestos de las Tablas A a M.

De preferencia, Q^2 se selecciona entre

20 2-etil-6-metil-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo,
2-bromo-6-cloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo, y
2,6-dicloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo.

De preferencia, R^1 es hidrógeno. De preferencia, R^2 es hidrógeno.

25 En un primer aspecto preferido, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual Q^2 es 2-etil-6-metil-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo; y Q^1 , R^1 , R^2 y R^3 son los definidos en la presente.

En una realización preferida del primer aspecto preferido, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual

Q^2 es 2-etil-6-metil-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo;

Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotienilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzotiadiazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo y naftiridinilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

10 R^1 y R^2 son hidrógeno en ambos casos; y

R^3 se selecciona entre ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxilo, acetoxi, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoxi, etoxi, difluormetoxi, trifluormetoxi, metiltio, isopropiltio, 3-etoxi-n-propilo, metoximetilo, 2-metoxietoxi, CH_2-CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$,
15 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, fenilo, N-pirrolilo, tiadiazolilo y piridilo.

En una realización más preferida del primer aspecto preferido, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual

Q^2 es 2-etil-6-metil-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo;

Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furanilo, piridilo, tienilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo y pirimidinilo; cada uno de los
20 cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

R^1 y R^2 son hidrógeno en ambos casos; y

R^3 se selecciona entre ciano, nitro, bromo, cloro, flúor, metilo, etilo, trifluormetilo, metoxi y trifluormetoxi.
25

En un segundo aspecto preferido, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual Q^2 es 2-bromo-6-cloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo; y Q^1 , R^1 , R^2 y R^3 son los definidos en la presente.

En una realización preferida del segundo aspecto preferido, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual

Q^2 es 2-bromo-6-cloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo;

Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, 5 pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotienilo, benzofuranilo, benoimidazolilo, benzotiadiazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo y naftiridinilo; cada uno de los cuales está 10 opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

R^1 y R^2 son hidrógeno en ambos casos; y

R^3 se selecciona entre ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxilo, acetoxi, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoxi, 15 etoxi, difluormetoxi, trifluormetoxi, metiltio, isopropiltio, 3-etoxi-n-propilo, metoximetilo, 2-metoxietoxi, CH_2-CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$, $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, fenilo, N-pirroilo, tiadiazolilo y piridilo.

En una realización más preferida del segundo aspecto preferido, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual

20 Q^2 es 2-bromo-6-cloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo;

Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furanilo, piridilo, tienilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo y pirimidinilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

25 R^1 y R^2 son hidrógeno en ambos casos; y

R^3 se selecciona entre ciano, nitro, bromo, cloro, flúor, metilo, etilo, trifluormetilo, metoxi y trifluormetoxi.

En un tercer aspecto preferido, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual Q^2 es 2,6-dicloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo; y Q^1 , R^1 , R^2 y R^3 son como se definen en la presente.

En una realización preferida del tercer aspecto preferido, la presente
5 invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual

Q^2 es 2,6-dicloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo;

Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo,
10 indolilo, benzotienilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, benzotiadiazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo y naftiridinilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

15 R^1 y R^2 son hidrógeno en ambos casos; y

R^3 se selecciona entre ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxilo, acetoxi, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoxi, etoxi, difluormetoxi, trifluormetoxi, metiltio, isopropiltio, 3-etoxi-n-propilo, metoximetilo, 2-metoxietoxi, CH_2-CN , $C(O)OCH_3$, $S(O)_2CH_3$, NH_2 , $N(CH_3)_2$,
20 $OP(O)(CH_2CH_3)_2$, fenilo, N-pirroilo, tiadiazolilo y piridilo.

En una realización más preferida del tercer aspecto preferido t, la presente invención da a conocer un compuesto de la fórmula (I) en la cual

Q^2 es 2,6-dicloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo;

Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furanilo, piridilo, tienilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo y pirimidinilo; cada uno de los
25 cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

R^1 y R^2 son hidrógeno en ambos casos; y

R³ se selecciona entre ciano, nitro, bromo, cloro, flúor, metilo, etilo, trifluormetilo, metoxi y trifluormetoxi.

Los compuestos muy preferidos de la fórmula (I) son seleccionados entre

N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metil-fenil]-3-(4-ciano-2-metilbenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A5 de la Tabla A);

N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-3-(4-flúor-2-clorobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A3 de la Tabla A);

10 N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-3-(4-flúor-2-clorobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. B2 de la Tabla B);

N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-fenil]-3-(4-ciano-2-metilbenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. B1 de la Tabla B);

15 N-[2,6-dicloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-3-(4-flúor-2-clorobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. C1 de la Tabla C);

20 N-[2,6-dicloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-3-(4-ciano-2-metilbenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. C2 de la Tabla C);

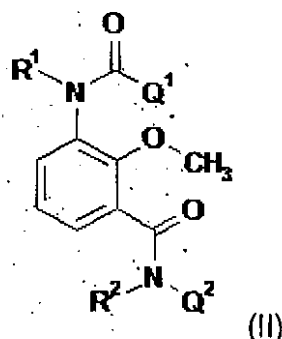
N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-3-(4-fluorbenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A1 de la Tabla A);

25 N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metil-fenil]-3-(4-cianobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A4 de la Tabla A);

N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-3-(2-metil-3-nitrobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A2 de la Tabla A); y

N-{3-[2-Bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluorometilpropil)-
fenilcarbamoil]-2-metoxifenil}-2,4,6-trifluorbenzamida (Compuesto No. B189 de
la Tabla B).

En otro aspecto la presente invención da a conocer un compuesto de la
5 fórmula (II),



en la cual Q^1 , R^1 , R^2 y R^3 son como se los define para la fórmula (I) y las
realizaciones preferidas del mismo corresponden a las de la fórmula (I); y

Q^2 se selecciona entre los siguientes:

- 10 2-etil-6-metil-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2-bromo-6-cloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dicloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dimetil-4-(perfluorisopropil)fenilo, y
2-metil-6-metoximetil-4-(perfluorisopropil)fenilo.

15 En una realización preferida, la presente invención da a conocer un
compuesto de la fórmula (II), en el cual

Q^1 se selecciona entre fenilo, bifenilo, furanilo, piridilo, tienilo, tiadiazolilo,
oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo y pirimidinilo; cada uno de los
cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R^3 , que pueden
20 ser iguales o diferentes;

R^1 y R^2 son hidrógeno en ambos casos; y

R^3 se selecciona entre ciano, nitro, bromo, cloro, flúor, metilo, etilo,
trifluorometilo, metoxi y trifluorometoxi; y

Q^2 se selecciona entre los siguientes:

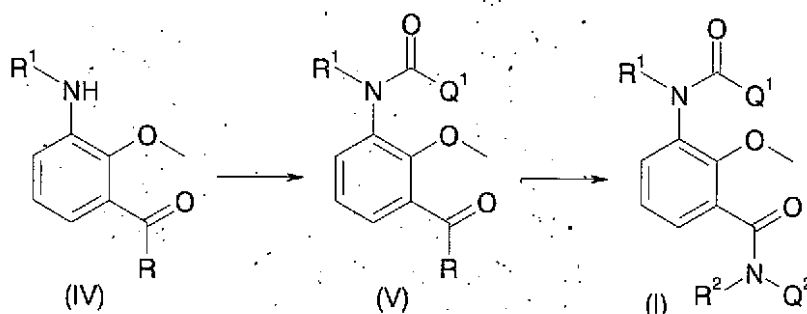
2-etil-6-metil-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2-bromo-6-cloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dicloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dimetil-4-(perfluorisopropil)fenilo y
5 2-metil-6-metoximetil-4-(perfluorisopropil)fenilo;

o una sal agroquímicamente aceptable o los N-óxidos del mismo.

Muy preferentemente, los compuestos de la fórmula (II) son los enumerados en las Tablas E, G, J, K y L.

Los compuestos de la invención se pueden preparar mediante una variedad
10 de métodos, por ejemplo, los métodos descriptos en WO 08/000438.

1) Los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar mediante el tratamiento de los compuestos de la fórmula (V), en la cual R es OH, alcoxi C_1-C_6 , Cl, F o Br con una amina de la fórmula NHR^2Q^2 . Cuando R es OH, dichas reacciones se pueden llevar a cabo en presencia de un reactivo de acoplamiento
15 tal como DCC (N,N'-diciclohexilcarbodiimida), EDC (1-etil-3-[3-dimetilamino-propil]carbodiimida clorhidrato) o BOP-Cl (cloruro bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfónico), en presencia de una base tal como piridina, trietilamina, 4-(dimetilamino)piridina o diisopropiletilamina y, opcionalmente, en presencia de un catalizador nucleofílico tal como hidroxibenzotriazol. Cuando R es Cl, dichas
20 reacciones se pueden llevar a cabo en condiciones básicas, por ejemplo en presencia de piridina, trietilamina, 4-(dimetilamino)piridina o diisopropiletilamina y opcionalmente en presencia de un catalizador nucleofílico. Por otro lado, la reacción se puede llevar a cabo en un sistema bifásico que comprenda un solvente orgánico, de preferencia acetato de etilo, y un solvente acuoso, de
25 preferencia una solución de bicarbonato de sodio. Cuando R es alcoxi C_1-C_6 el éster se puede convertir directamente a la amida mediante el calentamiento del éster y la amina juntos en un proceso térmico.

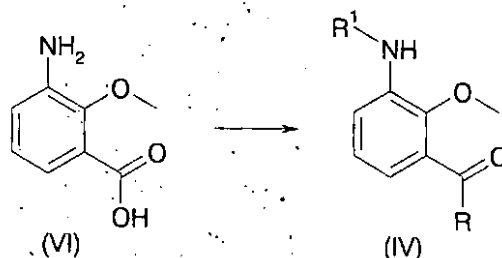


2) Los haluros de ácido de la fórmula (V), donde R es Cl, F o Br, se pueden preparar a partir de los ácidos carboxílicos de la fórmula (V), en la cual R es OH mediante tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo.

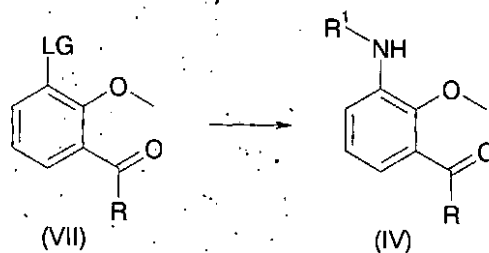
5 3) Los ácidos carboxílicos de la fórmula (V), en los cuales R es OH, se pueden formar a partir de los ésteres de la fórmula (V), en la cual R es alcoxi C₁-C₆ mediante el tratamiento del éster con un hidróxido alcalino tal como hidróxido de sodio, en un solvente tal como etanol.

10 4) Los ésteres de la fórmula (V), en los cuales R es alcoxi C₁-C₆, se pueden preparar mediante el tratamiento de los compuestos de la fórmula (IV), en la cual R es alcoxi C₁-C₆, mediante acilación con un ácido carboxílico de la fórmula Q¹-COOH o un haluro de ácido de la fórmula Q¹-COHal, donde Hal es Cl, F o Br, en condiciones normales de acuerdo con lo descrito en 1).

15 5) Los compuestos de la fórmula (IV), en los cuales R es alcoxi C₁-C₆, se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (VI) mediante el tratamiento sucesivo con un alcohol R-OH en condiciones ácidas y luego la formación de un enlace N-R¹. Por ejemplo, se puede obtener la aminación reductiva mediante el tratamiento de la amina con un aldehído o cetona y un agente reductor tal como cianoborohidruro de sodio. Por otro lado, se puede
20 realizar la alquilación mediante tratamiento de la amina con un agente de alquilación tal como un haluro de alquilo, opcionalmente en presencia de una base. Por otro lado, se puede obtener la arilación mediante el tratamiento de la amina con un haluro o sulfonato de arilo en presencia de un sistema catalizador/ligando adecuado, con frecuencia un complejo de paladio (0).

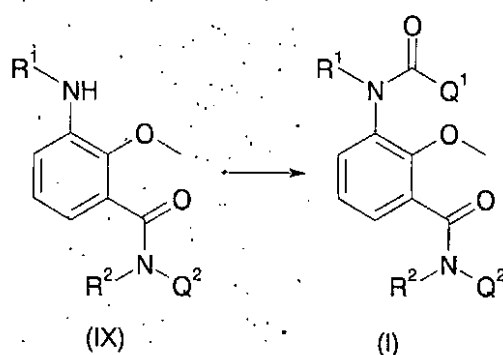


6) Por otro lado, los compuestos de la fórmula (IV), en la cual R es alcoxi C₁-C₆, se pueden preparar a partir de un compuesto de la fórmula (VII), en la cual R es alcoxi C₁-C₆ y LG es un grupo saliente, como por ejemplo flúor, cloro o sulfonato, mediante el desplazamiento del grupo saliente por una amina de la fórmula R¹-NH₂ u otro análogo de imina, seguido por hidrólisis con un catalizador de metal. Véase, por ejemplo: Chemical Communications (2009), (14), 1891-1893 o Journal of Organic Chemistry (2000), 65(8), 2612-2614.

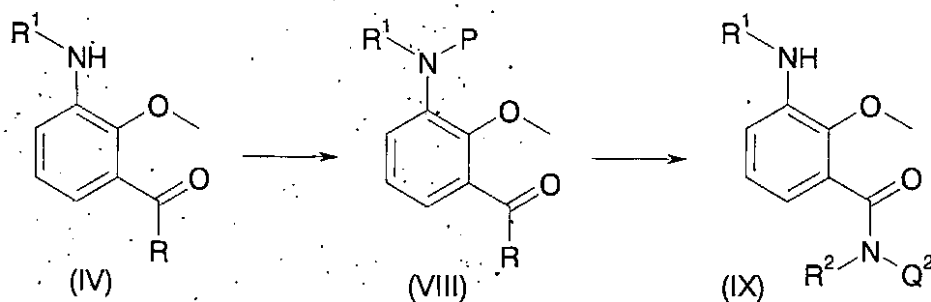


Los compuestos de la fórmula (VII) y las aminas de la fórmula R¹-NH₂ son compuestos conocidos o se los puede preparar por métodos conocidos por la persona capacitada en la técnica.

7) Por otro lado, los compuestos de la fórmula (I), se pueden preparar mediante el tratamiento de los compuestos de la fórmula (IX) con un ácido carboxílico de la fórmula Q¹-COOH o un haluro de ácido de la fórmula Q¹-COHal, en la cual Hal es Cl, F o Br, en condiciones normales descriptas en 1).



8) Los compuestos de la fórmula (IX) se pueden formar a partir de los compuestos de la fórmula (VIII), en la cual P es un grupo protector adecuado y R es OH, Cl o alcoxi C₁-C₆, mediante la formación de enlaces amídicos con una amina de la fórmula NHR²Q² en condiciones normales descritas en 1), seguida de la eliminación del grupo protector P en condiciones normales.



9) Los compuestos de la fórmula (VIII), en la cual R es OH o alcoxi C₁-C₆, se pueden preparar mediante la protección de la funcionalidad amina en los compuestos de la fórmula (IV), en la cual R es OH o alcoxi C₁-C₆. Los grupos protectores adecuados incluyen carbamatos (como por ejemplo *tert*-butiloxycarbonilo, aliloxycarbonilo y benciloxycarbonilo), grupos trialquilsililo (tales como *tert*-butildimetilsililo) y grupos acilo (tales como acetilo).

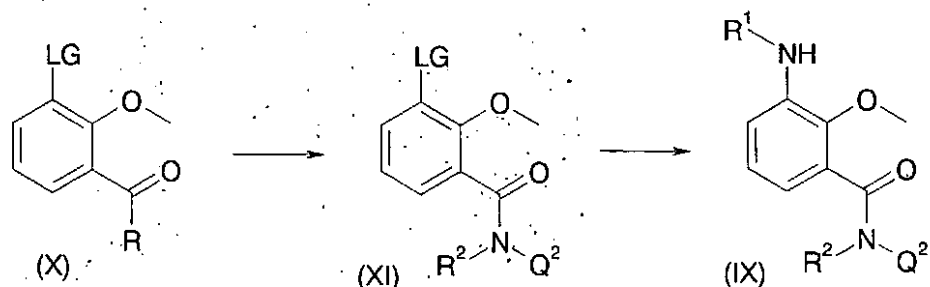
10) En el caso de los compuestos de la fórmula (VIII) y los compuestos de la fórmula (IV), los ésteres, en los cuales R es alcoxi C₁-C₆, pueden ser hidrolizados a los ácidos, donde R es OH, mediante tratamiento con un hidróxido alcalino, tal como hidróxido de sodio, en un solvente tal como etanol. Los ácidos

se pueden convertir a los cloruros de ácido, en los cuales R es Cl, mediante tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo según se describe en 2) y 3).

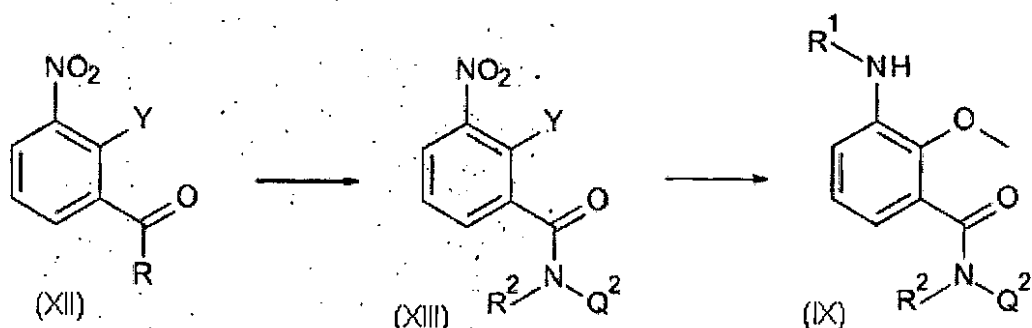
11) Por otro lado, los compuestos de la fórmula (IV), en la cual R es OH, Cl, F, Br o alcóxi C_1-C_6 , se pueden convertir directamente a los compuestos de la fórmula (IX) mediante la formación de enlaces amídicos con una amina de la fórmula NHR^2Q^2 en condiciones normales como se describe en 1).

12) Por otro lado, los compuestos de la fórmula (IX) se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (XI), en la cual LG es un grupo saliente tal como yodo, bromo, cloro o sulfonato, mediante el desplazamiento del grupo saliente con un compuesto de la fórmula R^1-NH_2 u otro análogo de imina seguido por la hidrólisis con un catalizador de metal. Véase, por ejemplo: Chemical Communications (2009), (14), 1891-1893 o Journal of Organic Chemistry (2000), 65(8), 2612-2614.

13) Los compuestos de la fórmula (XI) se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (X), en la cual R es Cl o OH y LG es un grupo saliente como se describe en 12), mediante la formación de un enlace amídico en condiciones normales, como se describe en 1). Los compuestos de la fórmula (X) y la fórmula (IV) son compuestos conocidos o se los puede preparar por métodos conocidos por la persona capacitada en la técnica.



14) Se puede obtener una síntesis alternativa de los compuestos de la fórmula (IX), en la cual R¹ es hidrógeno, mediante la reducción de compuestos nitro de la fórmula (XIII), por ejemplo mediante tratamiento con cloruro de estaño en condiciones ácidas, o hidrogenación catalizada por un metal noble tal como paladio sobre carbón.

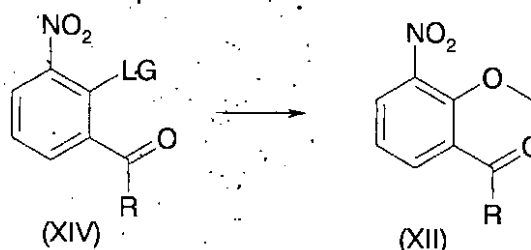


Y es LG u OMe

15 15) Los compuestos de la fórmula (XIII) se pueden derivar de los compuestos de la fórmula (XII), en la cual R es OH, Cl, o alcoxi C_1-C_6 , mediante acilación con una amina de la fórmula NHR^2Q^2 en las condiciones standard descriptas en 1).

10 16) En el caso de los compuestos de la fórmula (XII), los ésteres, en los cuales R es alcoxi C_1-C_6 , pueden ser hidrolizados a ácidos, donde R es OH, mediante tratamiento con un hidróxido alcalino tal como hidróxido de sodio, en un solvente tal como etanol como se describe en 3). Los ácidos se pueden convertir a los cloruros de ácido, en los cuales R es Cl, mediante tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo, como se describe en 2). Los compuestos de la fórmula (XII) son conocidos o se los puede preparar por métodos conocidos por la persona capacitada en la técnica.

15 17) Los compuestos de la fórmula (XII) se pueden preparar a partir de un compuesto de la fórmula (XIV) en la cual LG es halógeno tal como flúor o cloro, mediante reacción con metanol en presencia de una base tal como NaH.



20 El desplazamiento de un halógeno con un nucleófilo de oxígeno también se puede llevar a cabo en intermediarios de la fórmula (XIII).

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar para controlar infestaciones de plagas de insectos tales como Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera e Isoptera y también otras plagas de invertebrados, como por ejemplo plagas de ácaros, nematodos y moluscos. En adelante se hace referencia a insectos, ácaros, nematodos y moluscos, en forma colectiva, como plagas. Las plagas que se pueden controlar mediante el uso de los compuestos de la presente invención incluyen las plagas asociadas a la agricultura (término que incluye el desarrollo de cultivos para productos alimenticios y textiles), la horticultura y la cría de animales, animales de compañía, silvicultura y el almacenamiento de productos de origen vegetal (tales como frutos, granos y madera), las plagas asociadas al deterioro de estructuras hechas por el hombre y la transmisión de enfermedades en el hombre y los animales, además de plagas molestas (como las moscas).

Entre los ejemplos de especies de plagas que pueden ser controladas por los compuestos de la fórmula (I) se incluyen: *Myzus persicae* (áfido), *Aphis gossypii* (áfido), *Aphis fabae* (áfido), *Lygus* spp. (cápsidos), *Dysdercus* spp. (cápsidos), *Nilaparvata lugens* (saltamontes marrón), *Nephotettix inciticeps* (saltamontes), *Nezara* spp. (chinchas), *Euschistus* spp. (chinchas), *Leptocorisa* spp. (chinchas), *Frankliniella occidentalis* (trips), *Trips* spp. (trips), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la papa de Colorado), *Anthonomus grandis* (picudo del algodón), *Aonidiella* spp. (cochinillas), *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Bemisia tabaci* (mosca blanca), *Ostrinia nubilalis* (barrenador del maíz europeo), *Spodoptera littoralis* (gusano de las hojas del algodón), *Heliothis virescens* (gusano de las yemas del tabaco), *Helicoverpa armigera* (lagarta del algodón), *Helicoverpa zea* (lagarta del algodón), *Sylepta derogata* (enrolla-hojas del algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (polilla del repollo), *Agrotis* spp. (gusanos cortadores), *Chilo suppressalis* (barrenador de los tallos de arroz), *Locusta migratoria* (langosta), *Chortiocetes terminifera* (langosta),

Diabrotica spp. (gusanos de las raíces), *Panonychus ulmi* (arañuela roja europea),
Panonychus citri (arañuela roja de los cítricos), *Tetranychus urticae* (arañuela roja
 común), *Tetranychus cinnabarinus* (arañuela carmesí), *Phyllocoptruta oleivora*
 (agamuzado de los cítricos), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro blanco),
 5 *Brevipalpus* spp. (falsa arañuela roja), *Boophilus microplus* (garrapata del ganado),
Dermacentor variabilis (garrapata americana de los perros), *Ctenocephalides felis*
 (pulga de los felinos), *Liriomyza* spp. (minador de los cítricos), *Musca domestica*
 (mosca doméstica), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Culex*
 spp. (mosquitos), *Lucilia* spp. (moscardones), *Blattella germanica* (cucaracha),
 10 *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 sulfureus*), *Solenopsis geminata* (fire ant
 15 "hormiga de fuego"), *Monomorium pharaonis* (hormiga faraón), *Damalinea* spp. y
Linognathus spp. (piojos mordedores y succionadores), *Meloidogyne* spp.
 (nematodos de la anguiculosis de la raíz), *Globodera* spp. y *Heterodera* spp.
 (nematodos quísticos), *Pratylenchus* spp. (nematodos causantes de lesiones),
Rhodopholus spp. (nematodos de la anguiculosis de la banana), *Tylenchulus* spp. (
 20 nematodos de los cítricos), *Haemonchus contortus* (gusano barber pole),
Caenorhabditis elegans (nematodo del vinagre), *Trichostrongylus* spp. (nematodos
 gastrointestinales) y *Deroceras reticulatum* (babosa).

Por lo tanto, la invención presenta un método para controlar insectos,
 ácaros, nematodos o moluscos, que comprende aplicar una cantidad efectiva
 25 como insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de la
 fórmula (I), o una composición que contenga un compuesto de la fórmula (I), a una
 plaga, a un locus de una plaga, preferentemente una panta, o a una planta

susceptible al ataque de una plaga. Los compuestos de la fórmula (I) se utilizan preferentemente contra insectos o ácaros.

El término "planta" utilizado en este contexto incluye plántulas, arbustos y árboles.

5 Se debe entender que los cultivos incluyen asimismo los cultivos que se han tornado tolerantes a los herbicidas o a clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS-, GS-, EPSPS-, PPO- y HPPD-) por métodos convencionales de reproducción asexual o por ingeniería genética. Un ejemplo de cultivo que se ha tornado tolerante a las imidazolinonas, por ejemplo imazamox,
10 por métodos convencionales de reproducción asexual tales como la colza de verano Clearfield® (canola). Entre los ejemplos de cultivos que se han vuelto tolerantes a los herbicidas por métodos de ingeniería genética se incluyen, por ejemplo, las variedades de maíz resistentes al glifosato y al glufosinato existentes en el comercio bajo las denominaciones comerciales RoundupReady® y
15 LibertyLink®.

También se ha de entender que los cultivos son los que se han tornado resistentes a insectos dañinos por métodos de ingeniería genética, por ejemplo el maíz Bt (resistente al barrenador europeo del maíz), algodón Bt (resistente al picudo o gorgojo del algodón) y también las papas Bt (resistentes al escarabajo
20 Colorado). Los ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt 176 de NK® (Syngenta Seeds). Los ejemplos de plantas transgénicas que comprenden uno o más genes que codifican para resistencia a un insecticida y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (papa), NatureGard® y Protexcta®.

25 Los cultivos vegetales o el material de semillas de los mismos pueden ser resistentes a los herbicidas en ambos casos y, al mismo tiempo, resistentes a la alimentación de insectos (eventos transgénicos "apilados"). Por ejemplo, la semilla

puede tener la capacidad de expresar una proteína Cry3 insecticida y, al mismo tiempo, ser tolerante al glifosato.

También se ha de entender que los cultivos son aquellos que se obtienen por medios convencionales de reproducción asexual o ingeniería genética y que
5 contienen supuestamente características de producción (por ejemplo, estabilidad mejorada al almacenamiento, valor nutricional más elevado y sabor mejorado).

Para aplicar un compuesto de la fórmula (I) como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida a una plaga, a un locus de plaga o a una planta susceptible de ataque por una plaga, habitualmente se formula una composición
10 que incluye, además del compuesto de la fórmula (I), un diluyente o vehículo inerte adecuado y, optativamente, un agente tensioactivo (SFA). Los SFA son sustancias químicas que pueden modificar las propiedades de una interfaz, por ejemplo las interfaces líquido/sólido, líquido/aire o líquido/líquido) reduciendo la tensión interfacial y, de esa manera, dando lugar a cambios en las demás propiedades
15 (por ejemplo, dispersión, emulsionamiento y humectación). Es preferible 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 la fórmula (I). La composición se utiliza generalmente para el control de plagas, de tal manera que se aplica un compuesto de la fórmula (I) en
20 una proporción de 0,1 g a 10 kg por hectárea, preferentemente de 1 g a 6 kg por hectárea, más preferentemente de 1 g a 1 kg por hectárea.

Cuando se lo utiliza en un tratamiento de semillas, se utiliza un compuesto de la fórmula (I) en una proporción de 0,0001 g a 10 g (por ejemplo de 0,001 g o 0,05g), preferentemente de 0,005 g a 10 g, más preferentemente de 0,005 g a 4 g,
25 por kilogramo de semillas.

En otro aspecto, la presente invención da a conocer una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida, que comprende una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto

de la fórmula (I) y un vehículo o diluyente adecuado para el mismo. La composición es preferentemente una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida.

Las composiciones pueden ser elegidas de un número de tipos de formulación, incluyendo polvos para espolvorear (DP), polvos solubles (SP),
5 gránulos hidrosolubles (SG), gránulos dispersables en agua (WG), polvos humectables (WP), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles en aceite (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC),
10 emulsiones (tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (SC), aerosoles, formulaciones para fumigación/humo, suspensiones en cápsulas (CS) y formulaciones de tratamiento de las semillas. El tipo de formulación elegido en todo caso dependerá del propósito específico contemplado y de las propiedades
15 físicas, químicas y biológicas del compuesto de la fórmula (I).

Los polvos para espolvorear (DP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, kiesselguhr, tiza, tierras de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre,
20 cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta obtener un polvo fino.

Los polvos solubles (SP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con una o más sales inorgánicas hidrosolubles (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más
25 sólidos orgánicos hidrosolubles (como un polisacárido) y, optativamente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes para mejorar la dispersabilidad/solubilidad en agua. Seguidamente

se muele la mezcla hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos hidrosolubles (SG).

Los polvos humectables (WP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o
5 más agentes humectantes y, preferentemente, uno o más agentes dispersantes y, optativamente, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. Seguidamente se muele la mezcla hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (WG).

10 Los gránulos (GR) se pueden formar granulando una mezcla un compuesto de la fórmula (I) y uno o más diluyentes o vehículos sólidos en polvo, o a partir de gránulos en bruto preformados absorbiendo el compuesto de la fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material granulado poroso (tal como piedra pómez, arcillas de attapulgita, tierra Fuller, kiesselguhr, tierras de
15 diatomeas o panojas de maíz molidas) o adsorbiendo el compuesto de la fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material de núcleo rígido (tal como arenas, silicatos, carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y secándolo si fuera necesario. Los agentes que se utilizan comúnmente para contribuir a la absorción o adsorción incluyen solventes (tales como solventes de
20 petróleo alifáticos o aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes de adherencia (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes de polivinilo, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se puede incluir en los gránulos uno o más aditivos (por ejemplo un agente emulsionante, un agente humectante o un agente dispersante).

25 Los Concentrados Dispersables (DC) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en agua o un solvente orgánico tal como una cetona, alcohol o éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente tensioactivo

(por ejemplo para mejorar la dilución en agua o prevenir la cristalización en un tanque de fumigación).

Los Concentrados emulsionables (EC) o emulsiones de aceite en agua (EW) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en un
5 solvente orgánico (que optativamente contiene uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los solventes orgánicos adecuados para usar en los EC incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, ejemplificados por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200, SOLVESSO es una marca
10 registrada), cetonas tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (como por ejemplo alcohol bencílico, alcohol furfúrico o butanol), N-alquilpirrolidonas (tales como N-metilpirrolidona o N-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de ácidos grasos C₈-C₁₀) e hidrocarburos clorados. Un producto en EC puede emulsionar
15 espontáneamente tras la adición de agua, para producir una emulsión con una estabilidad suficiente para permitir la aplicación de rocío por medio del equipamiento apropiado. La preparación de una EW implica la obtención un compuesto de la fórmula (I) ya sea en forma de líquido (si no es líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable,
20 generalmente inferior a 70°C) o en solución (disolviéndolo en un solvente apropiado) y luego emulsionando el líquido o solución así obtenida en agua que contenga uno o más SFA, bajo alto corte, para producir una emulsión. Los solventes adecuados para usar en las EW incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), solventes aromáticos (tales
25 como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros solventes orgánicos apropiados con baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más solventes con uno o más SFA, para producir

espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un compuesto de la fórmula (I) está presente en un principio en el agua o la mezcla de solvente/SFA. Los solventes adecuados para usar en las ME incluyen los descriptos anteriormente para usar en las EC o EW. Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (se puede determinar qué sistema está presente por medio de mediciones de la conductividad) y puede ser adecuada para mezclarse con pesticidas hidrosolubles y oleosolubles en la misma formulación. Una ME es adecuada para la dilución en agua, ya sea manteniéndose como microemulsión o formando una emulsión convencional de aceite en agua.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas finamente divididas de un compuesto de la fórmula (I). Los SC se pueden preparar mediante molienda con bolas o perlas del compuesto de la fórmula (I) en un medio adecuado, optativamente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de finas partículas del compuesto. Se puede incluir uno o más agentes humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual se asientan las partículas. Por otro lado, se pueden moler en seco un compuesto de la fórmula (I) y agregarlo al agua, que contiene los agentes antes descriptos, para producir el producto final pretendido.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de la fórmula (I) y un impelente adecuado (por ejemplo n-butano). También se puede disolver o dispersar un compuesto de la fórmula (I) en un medio adecuado (por ejemplo, agua o un líquido miscible en agua tal como n-propanol) para producir composiciones para usar en bombas de rocío no presurizadas accionadas manualmente.

Se puede mezclar un compuesto de la fórmula (I) en estado seco con una mezcla pirotécnica para formar una composición adecuada para la generación, en un espacio cerrado, de un humo que contiene el compuesto.

Las suspensiones en cápsulas (CS) se pueden preparar de manera similar a la preparación de las formulaciones de EW aunque con una etapa adicional de polimerización de tal manera que se obtenga una dispersión de gotas de aceite en la cual cada gota de aceite esté encapsulada por una cáscara polimérica y contenga un compuesto de la fórmula (I) y, optativamente un vehículo o diluyente para el mismo. La cáscara polimérica se puede producir mediante una reacción interfacial de policondensación o mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden dar lugar a la liberación controlada del compuesto de la fórmula (I) y se las puede utilizar para el tratamiento de las semillas. También se puede formular un compuesto de la fórmula (I) en una matriz polimérica biodegradable para dar lugar a una liberación lenta y controlada del compuesto.

Una composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar la eficiencia biológica de la composición (por ejemplo mejorando la humectación, la retención o distribución sobre las superficies, la resistencia a la lluvia en las superficies tratadas o la captación o movilidad de un compuesto de la fórmula (I)). Dichos aditivos incluyen agentes tensioactivos, aditivos para rociar a base de aceites, por ejemplo ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de porotos de soja y semillas de colza) y mezclas de estos con otros adyuvantes potenciadores biológicos (ingredientes que pueden o no modificar la acción de un compuesto de la fórmula (I)).

También se puede formular un compuesto de la fórmula (I) para usar como tratamiento de las semillas, por ejemplo como composición en polvo, incluyendo un polvo para el tratamiento en seco de las semillas (DS), un polvo hidrosoluble (SS) o un polvo dispersable en agua para el tratamiento en suspensión (WS) o en forma de composición líquida, incluyendo un concentrado fluido (FS), una solución

(LS) o una suspensión en cápsulas (CS). Las preparaciones de las composiciones de DS; SS; WS; FS y LS son muy similares a las composiciones de DP, SP, WP, SC y DC descritas anteriormente. Las composiciones para el tratamiento de las semillas pueden incluir un agente para contribuir a la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de película).

Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser SFA superficiales del tipo catiónico, aniónico, anfotérico o no iónico.

Los SFA adecuados del tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo, bromuro de cetiltrimetil amonio), imidazolinas y sales de aminas.

Los SFA aniónicos adecuados incluyen las sales de metales alcalinos de ácidos grasos, las sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo lauril sulfato de sodio), las sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecibencensulfonato de sodio, dodecibencensulfonato de calcio, sulfonato de butilnaftaleno y mezclas de di-isopropil- y tri-isopropil-naftalensulfonatos de sodio), éter sulfatos, éter sulfatos de alcohol (por ejemplo, éter sulfatos (por ejemplo laureth-3-sulfato de sodio), éter carboxilatos (por ejemplo laureth-3-carboxilato de sodio), ésteres de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (predominantemente monoésteres) o pentóxido de sodio (predominantemente diésteres) por ejemplo la reacción entre alcohol laurílico y ácido tetrafosfórico; además, estos productos pueden ser etoxilados), sulfosuccinamatos, sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos de parafina u olefina.

Los SFA adecuados del tipo anfotérico incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

Los SFA adecuados del tipo no iónico incluyen los productos de la condensación de óxidos de alquileo 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 u octilcresol), ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol, productos de la condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno, polímeros de bloques (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno), alcanolamidas, ésteres simples (por ejemplo, ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol), óxidos amínicos (por ejemplo óxido de dlauril dimetilamina) y lecitinas.

Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa sódica) y arcillas dilatables (tales como bentonita o attapulgita).

Un compuesto de la fórmula (I) se puede aplicar por cualquiera de los medios conocidos para la aplicación de compuestos pesticidas. Por ejemplo, se lo puede aplicar, formuladas o sin formular, a las plagas o a un locus de las plagas (tal como un hábitat de las plagas o a una planta en desarrollo pasible de infestación por las plagas) o a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, los tallos, ramas o raíces, a la semilla antes de su plantación o a cualquier otro medio en el cual las plantas se desarrollen o se vayan a plantar (tal como la tierra que rodea a las raíces, el suelo en general, el agua de arrozales o sistemas de cultivo hidropónico), directamente o se lo puede rociar, espolvorear, aplicar mediante inmersión, aplicar como formulación en crema o pomada, aplicar en forma de vapor o aplicar por medio de la distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granulada o una composición envasada en una bolsa hidrosoluble) en el suelo u otro medio acuoso.

También se puede inyectar un compuesto de la fórmula (I) en las plantas o rociarlo sobre la vegetación utilizando técnicas de fumigación electrodinámicas, u otros métodos de bajo volumen, o aplicarla por medio de sistemas de irrigación terrestre o aérea.

Las composiciones para usar en forma de preparaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) se presentan, en general, en forma de concentrado con una elevada proporción del ingrediente activo, agregándose el concentrado al agua antes de su uso. Estos concentrados, que pueden incluir DC, SC, EC, EW, ME, SG, SP, WP, WG y CS, a menudo deben tolerar el almacenamiento durante períodos de tiempo prolongados y, después de dicho almacenamiento, poder agregarse al agua para formar preparaciones acuosas que se mantienen homogéneas durante un tiempo suficiente para dar lugar a su aplicación por equipamiento de fumigación convencional. Dichas preparaciones acuosas pueden contener cantidades variadas de un compuesto de la fórmula (I) (por ejemplo de 0,0001 a 10 % en peso) dependiendo del propósito para el cual se las ha de utilizar.

Se puede utilizar un compuesto de la fórmula (I) en mezclas con fertilizantes (por ejemplo fertilizantes con contenido de nitrógeno, potasio o fósforo). Entre los tipos de formulación adecuados se cuentan los gránulos de fertilizante. Las mezclas contienen preferentemente hasta 25 % en peso del compuesto de la fórmula (I).

Por lo tanto, la invención presenta asimismo una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de la fórmula (I).

Las composiciones de la presente invención pueden contener otros compuestos con actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o compuestos con actividad fungicida o que poseen actividad reguladora del crecimiento de las plantas, herbicida, insecticida, nematocida o acaricida.

El compuesto de la 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, fungicida, sinergizante, herbicida o regulador del crecimiento de las plantas, cuando resulte apropiado. Un ingrediente activo adicional puede dar origen a una composición con un espectro de actividad más

amplio o mayor persistencia en un locus, synergizar la actividad o complementar la actividad (por ejemplo, aumentando la velocidad del efecto o superando la repelencia) del compuesto de la fórmula (I) o contribuir a superar o prevenir el desarrollo de resistencia a los componentes individuales. El ingrediente activo
5 adicional específico depende del uso pretendido de la composición. Entre los ejemplos de pesticidas adecuados se incluyen los siguientes.

a) Piretroides, tales como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cialotrina (especialmente lambda-cihalotrina), bifentrina, fenpropatrina, ciflutrina, beta-ciflurtina, teflutrina, piretroides inocuos
10 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-ildienmetil)ciclopropano;

b) Organofosfatos, como por ejemplo profenofos, sulprofos, acefato, metil paratión, azinfos-metilo, demeton-s-metil, heptenofos, tiometon, fenamifos,
15 monocrotofós, profenofos, triazofos, metamidofos, dimetoato, fosfamidón, malatión, clorpirifos, fosalona, terbufos, fensulfotión, fonofos, forato, foxim, pirimifos-metilo, pirimifos-etilo, fenitrotión, fostiazato o diazinón;

c) Carbamatos (incluyendo aril carbamatos) tales como pirimicarb, triazamato, cloethocarb, carbofurano, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox,
20 carbosulfán, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomil u oxamil;

d) Benzoil ureas, como por ejemplo diflubenzurón, triflumurón, hexaflumurón, flufenoxurón o clorfluazurón;

e) Compuestos orgánicos de estaño tales como cihexaestaño, óxido de fenbutaestaño o azocicloestaño;

25 f) Pirazoles tales como tebfenpirad y fenpiroximato;

g) Macrólidos tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, espinosad, azadiractina o espinotoroam;

- h) Hormonas o feromonas;
- i) Compuestos organoclorados tales como endosulfán (especialmente alfa-endosulfán), hexacloruro de benceno, DDT, clordano o dieldrina;
- j) Amidinas tales como clordimeform o amitraz;
- 5 k) Agentes de fumigación tales como cloropicrina, dicloropropano, bromuro de metilo o metam;
- l) Compuestos neonicotinoides tales como imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid, nitenpiram, dinotefurán, tiametoxam, clotianidina, nitiazina o flonicamid;
- 10 m) Diacilhidracinas tales como tebufenozida, cromafenozida o metoxifenozida;
- n) Éteres difenólicos tales como diofenolano o piriproxifeno;
- o) Indoxacarb;
- p) Clorfenapir;
- 15 q) Pimetrozina;
- r) Espirotetramat, espirodiclofeno o espiromesifeno;
- s) Diamidas, tales como flubendiamida, clorantraniliprol o ciantraniliprol;
- t) Sulfoxaflor; o
- u) Metaflumizona
- 20 Además de las clases de pesticidas químicos más importantes antes enumeradas, se pueden emplear otros pesticidas con objetivos específicos en la mezcla o la composición, si resultare apropiado para el uso pretendido de la composición. Por ejemplo, se pueden incorporar insecticidas selectivos para cultivos específicos, por ejemplo se pueden utilizar insecticidas específicos para
- 25 los barrenadores del tallo (tales como cartap) o insecticidas específicos para saltamontes (tales como buprofezina) para usar en el arroz. Por otro lado, también se pueden incluir insecticidas o acaricidas específicos para determinadas especies/etapas de insectos (por ejemplo acaricidas ovo-larvicidas tales como

clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifón, acaricidas motilicidas tales como dicofol o propargita; acaricidas tales como bromopropilato o clorobencilato o reguladores del crecimiento tales como hidrametilnon, ciromazina, metopreno, clorfluazurón o diflubenzurón).

5 Son ejemplos de compuestos fungicidas que se pueden incluir en la composición de la presente invención (E)-N-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximatil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-N,N-dimetil-6-trifluormetil-bencimidazol-1-sulfonamida, α -[N-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxi-acetamido]- γ -butirolactona, 4-cloro-2-ciano-N,N-dimetil-5-p-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidazosulfamid), 3-5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), N-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofen-3-carboxamida (MON65500), N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida (AC382042), N-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropan carboxamida, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorf, 15 anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxil, benomil, biloxazol, bitertanol, blasticidin S, bromuconazol, bupirimato, captafol, captano, carbendazim, carbendazim clorhidrato, carboxina, carpropamid, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonilo, clorozolinato, clozilacón, compuestos con contenido de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre y 20 mezcla Bordeaux, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, debacarb, di-2-piridil disulfuro 1,1'-dióxido, diclofluanid, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, O,O-di-iso-propil-S-bencil tiofosfato, dimefluazol, dimetconazol, dimetomorf, dimetirimol, diniconazol, dinocap, ditianon, cloruro de dodecil dimetil amonio, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfos, 25 epoxiconazol, etirimol, etil(Z)-N-bencil-N([metil(metil-tioetilidenamino-oxicarbonil)amino]tio)- β -alaninato, etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid (KBR2738), fenpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina,

ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluorimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanilo, flutriafol, folpet, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxiisoxazol, himexazol, imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, iminoctadina triacetato, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb (SZX0722),
5 isopropanil butil carbamato, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominostrobina, miclobutanilo, neoasozina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-iso-propilo, nuarimol, ofurace, compuestos de organomercurio, oxadixilo, oxasulfurón, ácido
10 oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, pencicurón, óxido de fenazina, fosetil-Al, ácidos de fósforo, ftalida, picoxistrobina (ZA1963), polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, pirazofos, pirifenox, pirimetanilo, piroquilón, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario,
15 quinometionato, quinoxifeno, quintoceno, sipconazol (F-155), pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomina, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnaceno, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamid, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, timibenconazol, tolclofos-metilo, tolilfluand, triadimefon, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina (CGA279202), triforina,
20 triflumizol, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, zineb y ziram.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden mezclar asimismo con tierra, turba u otro medio de enraizado para la protección de las plantas contra las enfermedades fúngicas de las semillas, el suelo o las hojas.

Entre los ejemplos de sinergizantes adecuados para usar en las
25 composiciones se incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroxan y dodecil imidazol.

Los herbicidas adecuados y reguladores del crecimiento de las plantas adecuados para ser incluidos en las composiciones dependen del objetivo pretendido y del efecto buscado.

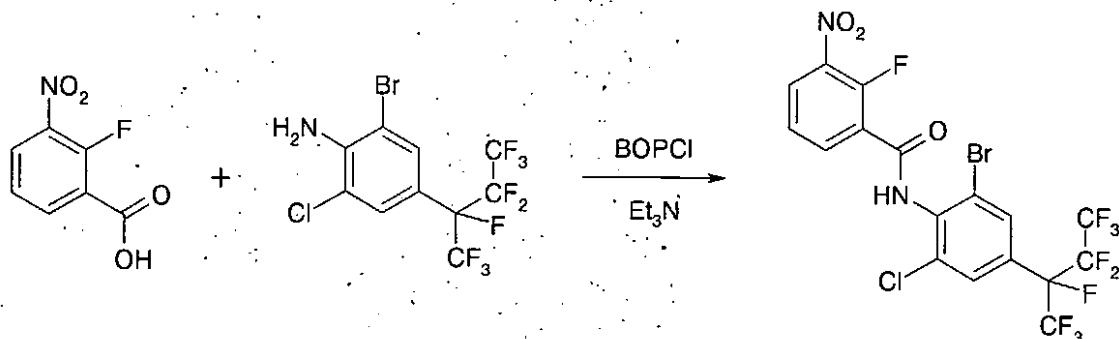
Un ejemplo de herbicida selectivo del arroz que se puede incluir es propanilo. Un ejemplo de regulador del crecimiento de las plantas para usar en el algodón es PIXTM.

Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de manera que no se presten fácilmente al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias se pueden preparar otros tipos de formulación. Por ejemplo, en los casos en que un ingrediente activo es un sólido hidrosoluble y el otro un líquido insoluble en agua, de todas maneras puede ser posible dispersar cada ingrediente activo en la misma fase acuosa continua mediante la dispersión del ingrediente activo sólido en forma de suspensión (utilizando una preparación análoga a la de un SC), pero dispersando el ingrediente activo líquido en forma de emulsión (utilizando una preparación análoga a la de una EW). La composición así obtenida es una formulación de suspoemulsión (SE).

Ejemplos

En toda esta sección se utilizaron las siguientes abreviaturas: s = singlete; bs = singlete amplio; d = doblete; dd = doblete doble; dt = triplete doble; t = triplete, tt = triple triplete, q = cuartete, sept = septete; m = multiplete; Me = metilo; Et = etilo; Pr = propilo; Bu = butilo; P.f. = punto de fusión; TR = tiempo de retención, MH⁺ = catión molecular (es decir, peso molecular medido).

Ejemplo 11: N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-2-flúor-3-nitrobenzamida



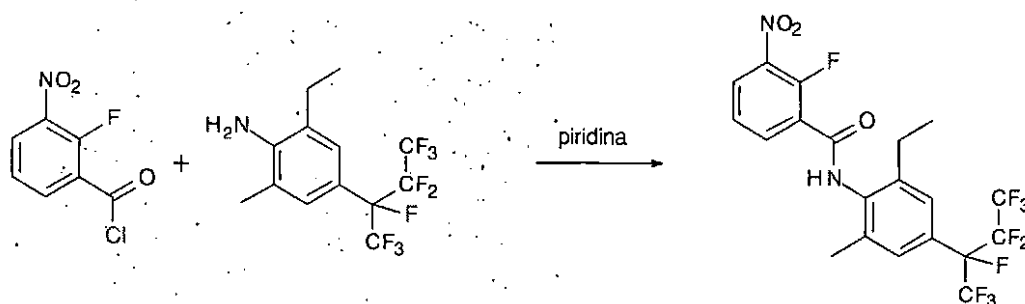
- 5 A una solución de 2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetil-propil)fenilamina (Ejemplo 16) (20 g, 47,1 mmol) y ácido 2-flúor-3-nitrobenzoico (17,4 g, 94,2 mmol) en diclorometano (230 ml) se agregó trietilamina (19,7 ml, 141 mmol) y cloruro bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfónico ("BOP-Cl") (23,98 g, 94 mmol). La mezcla de reacción fue calentada a reflujo por espacio de 6
- 10 horas. La mezcla de reacción fue enfriada a temperatura ambiente y desactivada mediante la adición de ácido clorhídrico acuoso (1N). A continuación se extrajo la mezcla tres veces con diclorometano. Se lavaron los extractos orgánicos combinados con hidrógeno carbonato de sodio acuoso saturado, se los secó sobre sulfato de sodio y concentró. El residuo fue purificado por cromatografía en
- 15 columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / acetato de etilo 7:3) para dar N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-2-flúor-3-nitrobenzamida (12 g, 43% de rendimiento). ^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz): 8,48 (t, 1H), 8,30 (t, 1H), 8,18 (db, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,54 (t, 1H) ppm.

Por el mismo procedimiento se preparó el siguiente compuesto:

N-[2,6-dicloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-2-flúor-3-nitro-benzamida

¹H NMR (CDCl₃, 400 MHz): 8,48 (t, 1H), 8,28 (t, 1H), 8,14 (db, 1H), 7,68 (s, 2H), 7,54 (t, 1H) ppm.

Ejemplo 12: *N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metil-fenil]-2-flúor-3-nitrobenzamida

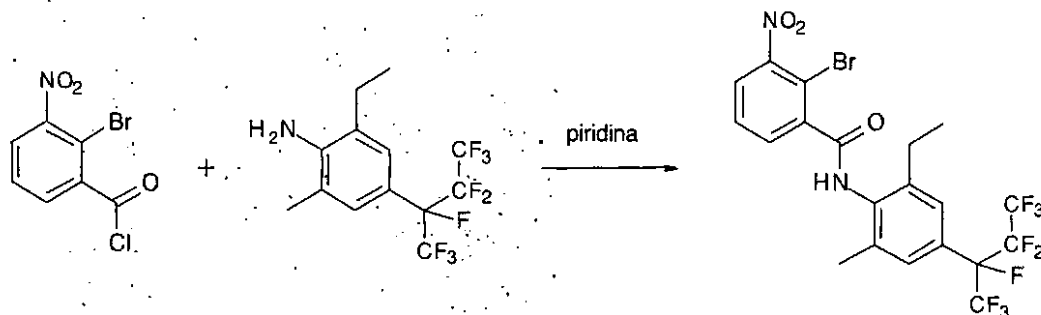


A una suspensión de ácido 2-flúor-3-nitrobenzoico (6,3 g, 34 mmol) en diclorometano (20 ml) se agregó cloruro de oxalilo (4,3 ml) a temperatura ambiente, seguido por *N,N*-dimetilformamida (0,2 ml). Se agitó la mezcla de reacción durante 1 hora a temperatura ambiente y luego se la calentó a reflujo por espacio de 3 horas. Se dejó enfriar la mezcla de reacción a temperatura ambiente y luego se la concentró. Se suspendió el residuo en tetrahidrofurano (50 ml). Se disolvió 2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilanilina (preparación descrita en WO 08/074427) (10 g, 28,3 mmol) en tetrahidrofurano (50 ml) y se agregó piridina (6,8 ml, 84,9 mmol). Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente por espacio de 3 horas, luego a reflujo durante 3 horas. Se desactivó la reacción mediante la adición de hidrógeno carbonato de sodio acuoso saturado (100 ml) y se extrajo la mezcla dos veces con acetato de etilo (2x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados fueron secados sobre sulfato de sodio y concentrados. El residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / acetato de etilo 4:1 a 0:1) para dar *N*-[2-etil-4-

(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-2-flúor-3-nitrobenzamida (6,32 g, 43% de rendimiento).

^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz): 8,34 (m, 1H), 8,22 (m, 1H), 8,02 (bs, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,48 (s, 2H), 2,70 (q, 2H), 1,22 (t, 3H).

5 Ejemplo 13: N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metil-fenil]-2-bromo-3-nitrobenzamida



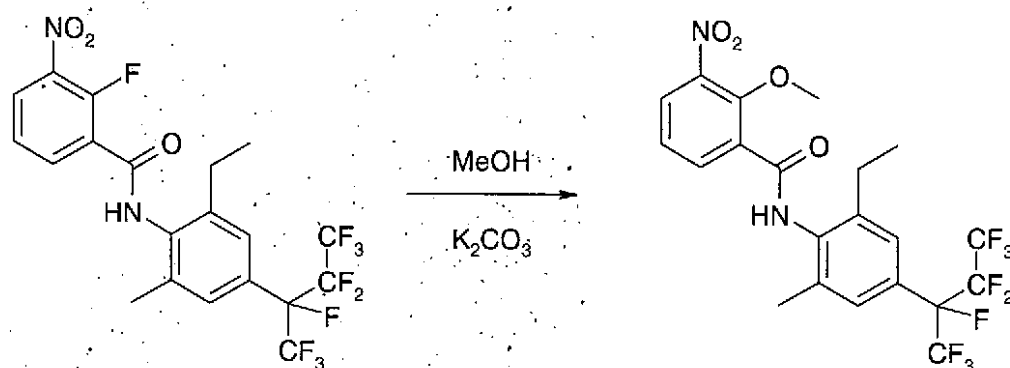
A una suspensión de ácido 2-bromo-3-nitrobenzoico (2,870 g, 0,0117 mol) en tolueno (29 ml) se agregó *N,N*-dimetilformamida (90 μl) a temperatura ambiente, seguida por la adición lenta de cloruro de tionilo (1,69 ml, 0,02332 mol). Se agitó la mezcla de reacción por espacio de 1 hora a 100°C. Se dejó enfriar la mezcla de reacción a temperatura ambiente y se evaporó el tolueno. Se disolvió la cantidad apropiada de cloruro de acilo en THF y se utilizó sin más purificación.

15 A una solución de 2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilanilina (preparación de acuerdo con lo descrito WO 08/074427) (106 mg, 0,3 mmol) en tetrahidrofurano (0,5 ml) se agregó piridina (72,6 μl , 0,9 mmol) a una temperatura de 0 a 5°C. Se agregó una solución de cloruro de ácido 2-bromo-3-nitrobenzoico (87 mg, 0,33 mmol) en tetrahidrofurano (0,5 ml). Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente por espacio de 3 horas, luego a reflujo durante 15 horas. Al cabo de 15 horas, la reacción no se había completado, por lo que se agregó *N,N*-dimetilacetamida ("DMA") (0,1 equivalente) y más cloruro de ácido 2-bromo-3-nitrobenzoico (0,2 equivalentes). Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente por espacio de 41 horas. Transcurridas las 41 horas, se desactivó la reacción mediante la adición de hidrógeno carbonato de

sodio acuoso saturado (10 ml) y se extrajo la mezcla dos veces con acetato de etilo (2x 20 ml). Los extractos orgánicos combinados fueron secados sobre sulfato de sodio y concentrados. El residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / acetato de etilo 6:1) para dar *N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluorometilpropil)-6-metilfenil]-2-bromo-3-nitrobenzamida (0,133 g, 76% de rendimiento).

^1H NMR (CDCl_3 , 400 MHz): 7,78 (dd, 1H), 7,72 (dd, 1H), 7,53 (t, 1H), 7,32 (s, 2H), 7,17 (bs, 1H), 2,71 (q, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,19 (t, 3H).

Ejemplo 14: *N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluorometilpropil)-6-metilfenil]-2-metoxi-3-nitrobenzamida



A una suspensión de *N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluorometilpropil)-6-metilfenil]-2-flúor-3-nitrobenzamida (Ejemplo 12) (5 g, 9,6 mmol) en metanol (195 ml) se agregó carbonato de potasio (2,6 g, 16,2 mmol) a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla de reacción por espacio de 16 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción fue concentrada y el residuo fue disuelto en diclorometano. La fase orgánica fue lavada con agua, secada sobre sulfato de sodio y concentrada. El residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / acetato de etilo 3:1) para dar *N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluorometilpropil)-6-metilfenil]-2-metoxi-3-nitrobenzamida (5,1 g, 99% de rendimiento). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8,90 (bs,

1H), 8,32 (d, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,38 (m, 3H), 4,19 (s, 3H), 2,70 (q, 2H), 2,24 (s, 3H), 1,20 (t, 3H) ppm.

Por el mismo procedimiento se prepararon los siguientes compuestos:

N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-2-metoxi-3-nitrobenzamida

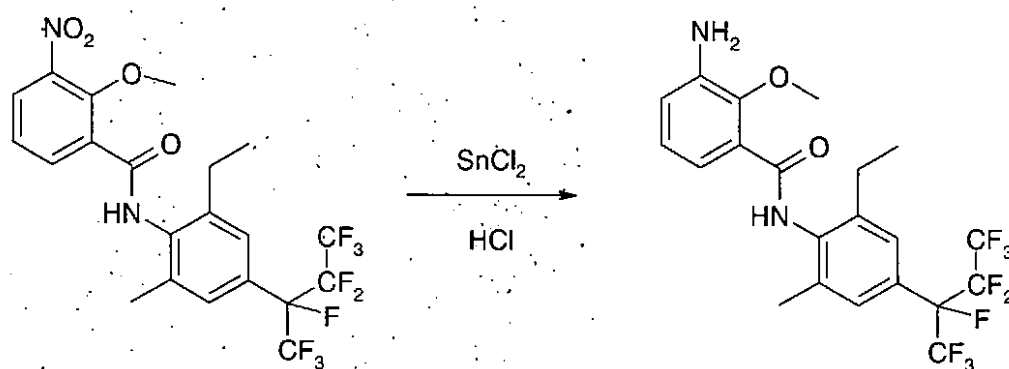
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9,23 (bs, 1H), 8,45 (dd, 1H), 8,07 (dd, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,46 (t, 1H), 4,18 (s, 3H) ppm.

N-[2,6-dicloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-2-metoxi-3-nitrobenzamida

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9,22 (bs, 1H), 8,42 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,68 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 4,15 (s, 3H) ppm.

Se aplicó un procedimiento similar a N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-2-bromo-3-nitrobenzamida (Ejemplo I3) para dar N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-2-metoxi-3-nitrobenzamida (92% de rendimiento).

Ejemplo I5: 3-amino-N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-2-metoxibenzamida



A una solución de N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-2-metoxi-3-nitrobenzamida (Ejemplo I4) (5,1 g, 9,57 mmol) en isopropanol (50 ml) se agregó cloruro de estaño (6,5 g, 34,5 mmol) a temperatura ambiente. Se enfrió la mezcla a 0°C y se agregó lentamente ácido clorhídrico

acuoso concentrado (10 ml). Se agitó la mezcla de reacción a 80°C por espacio de media hora. Se evaporó un tercio del volumen total de isopropanol. Se agregó agua (100 ml) a la mezcla concentrada y se agregó hidróxido de sodio acuoso (4N) para ajustar el pH a 7 a 8. Se extrajo la fase acuosa tres veces con acetato de etilo (3x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados fueron secados sobre sulfato de sodio y concentrados. El residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / acetato de etilo 2:1 a 1:1) para dar 3-amino-N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-2-metoxi benzamida (2,3 g, 48% de rendimiento).

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): 9,12 (bs, 1H), 7,37 (dd, 1H), 7,26 (s, 2H), 6,91 (t, 1H), 6,80 (dd, 1H), 3,90 (bs, 2H), 3,80 (s, 3H), 2,60 (q, 2H), 2,24 (s, 3H), 1,11 (t, 3H) ppm.

Por el mismo procedimiento se prepararon los siguientes compuestos:

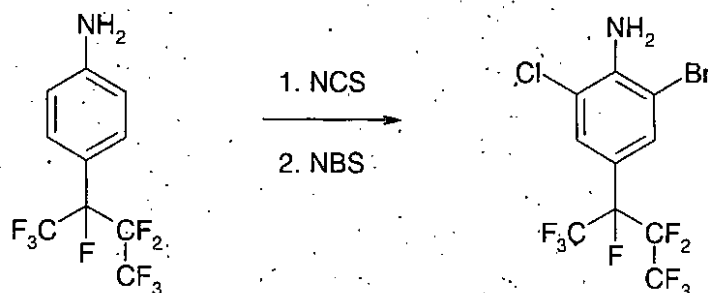
3-Amino-N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-fenil]-2-metoxibenzamida

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7,73 (bs, 1H), 7,61 (s, 1H), 7,47 (dd, 1H), 6,98 (t, 1H), 6,88 (dd, 1H), 3,91 (s, 3H), 3,85 (bs, 2H) ppm.

3-Amino-N-[2,6-dicloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-fenil]-2-metoxibenzamida

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7,65 (s, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,10 (t, 1H), 6,98 (d, 1H), 3,98 (s, 3H), 3,93 (bs, 2H) ppm.

Ejemplo 16: 2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-fenilamina



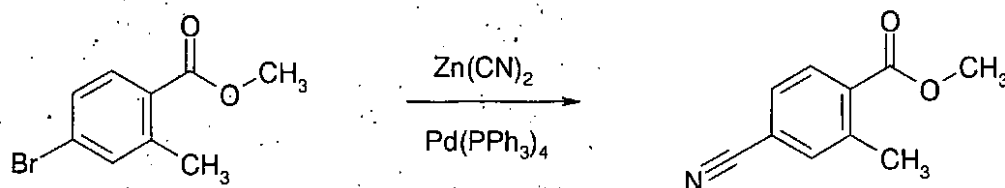
5

Se disolvió 4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetiletil)fenilamina (preparada de acuerdo con EP 1.006.102) (175,8 g, 565 mmol) en acetonitrilo (1000 ml) y se agregó *N*-cloro-succinimida ("NCS") (76,2 g, 570,7 mmol). La mezcla de reacción fue calentada a reflujo por espacio de 90 minutos. La mezcla de reacción fue concentrada al vacío, el residuo suspendido en éter dietílico y los sólidos separados por filtración. Se concentró el filtrado y el residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / diclorometano 9:1) para dar 2-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenilamina. Se repitió el mismo procedimiento empleando *N*-bromosuccinimide ("NBS") (100,5 g, 565 mmol) como reactivo. Esta vez, el residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / diclorometano 2:1) para dar 2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenilamina (143,3 g, 59,7% de rendimiento).

20

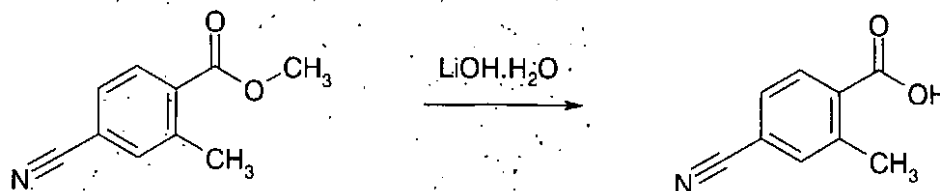
$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): 7,70 (s, 1H), 7,42 (s, 1H), 4,82 (s, 2H) ppm.

Ejemplo 17: Éster metílico del ácido 4-ciano-2-metilbenzoico



A una solución de ácido 4-bromo-2-metilbenzoico (108 g, 471 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (4 l) bajo atmósfera de nitrógeno se agregó cianuro de zinc (II) (88,5 g, 753,6 mmol) y tetrakis(trifenilfosfina)paladio (65 g, 56,60 mmol). Se agitó la mezcla de reacción a 100°C por espacio de 16 horas. La mezcla de reacción fue diluida con tolueno y se separaron las fases. Se extrajo la fase acuosa dos veces con tolueno. Se lavaron las fases orgánicas combinadas con solución salina e hidróxido de amonio acuoso saturado, se las secó sobre sulfato de sodio y concentró. El residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: acetato de etilo / ciclohexano 1:5) para dar el éster metílico del ácido 4-ciano-2-metilbenzoico (73 g, 89% de rendimiento). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7,78 (d, 1H), 7,52 (m, 2H), 3,92 (s, 3H), 2,62 (s, 3H) ppm.

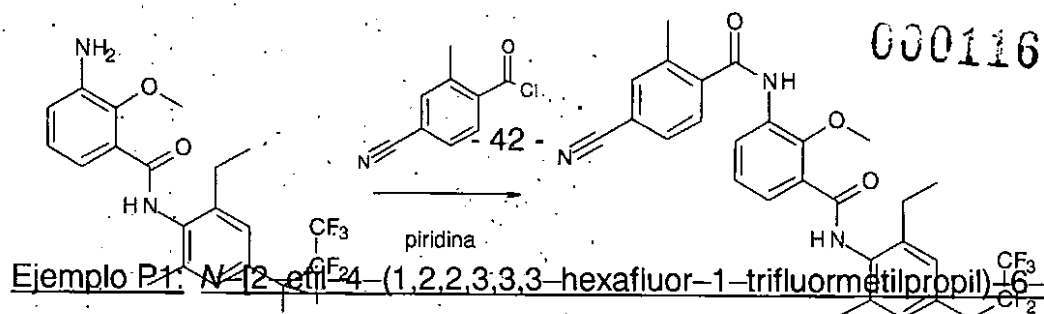
Ejemplo 18: Ácido 4-ciano-2-metilbenzoico



15

A una solución de ácido 4-ciano-2-metilbenzoico (Ejemplo 17) (61 g, 348 mmol) en una mezcla de agua (0,360 ml) y tetrahidrofurano (1,4 l) se agregó hidróxido de litio hidrato (31,4 g, 748,2 mmol). Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente por espacio de 3 horas. Se concentró la mezcla de reacción. Se acidificó el residuo mediante la adición de ácido clorhídrico acuoso (1N) y se la extrajo con una mezcla de metanol y cloroformo (5:95). Se secó la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se la concentró. Se cristalizó el residuo en una mezcla de acetato de etilo y ciclohexano para dar ácido 4-ciano-2-metilbenzoico (55,5 g, 99% de rendimiento). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 7,89 (d, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,72 (d, 1H), 2,51 (s, 3H) ppm.

25



5

A una solución de ácido 4-ciano-2-metilbenzoico acid (Ejemplo I8) (0,141 g, 0,8 mmol) y *N,N*-dimetilformamida (2 gotas) en diclorometano (5 ml) bajo atmósfera de nitrógeno se agregó cloruro de oxalilo (0,074 ml, 0,88 mmol). Se agitó la mezcla de reacción por espacio de una hora a temperatura ambiente y luego a 60 °C durante 1,5 hora. La mezcla de reacción fue concentrada y el residuo disuelto en tetrahidrofurano (10 ml). Se agregó la solución gota a gota a una solución de 3-amino-*N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetil-propil)-6-metilfenil]-2-metoxibenzamida (Ejemplo I5) (0,37 g, 0,73 mmol) y piridina (0,12 ml, 1,46 mmol) en tetrahidrofurano (10 ml). Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente por espacio de 16 horas. Se vertió la mezcla de reacción en hidrógeno carbonato de sodio acuoso (1M) y se extrajo la mezcla tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas fueron secadas sobre sulfato de sodio y concentradas. El residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: acetato de etilo / ciclohexano 1:3) para dar el Compuesto No. A5 de la Tabla A (0,240 g, 51% de rendimiento). P.f. 104–105 °C. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 8,68 (d, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,66 (m, 3H), 7,41 (m, 3H), 4,00 (s, 3H), 2,72 (q, 2H), 2,62 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 1,25 (t, 3H) ppm.

25

Por el mismo procedimiento se prepararon los siguientes compuestos:

N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-3-(4-flúor-2-clorobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A3 de la Tabla A)

5 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8,76 (m, 2H), 8,71 (d, 1H), 7,98 (m, 1H), 7,71 (dd, 1H), 7,39 (m, 3H), 7,27 (dd, 1H), 7,18 (m, 1H), 4,03 (s, 3H), 2,73 (q, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,25 (t, 3H) ppm.

N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-3-(4-flúor-2-clorobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. B2 de la Tabla B)

P.f. 178-179 °C. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9,12 (bs, 1H), 8,79 (bs, 1H), 8,73 (d, 1H), 7,79-7,72 (m, 2H), 7,84 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,38 (t, 1H), 7,25 (m, 1H), 7,17 (m, 1H), 4,07 (s, 3H) ppm.

N-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-3-(4-ciano-2-metilbenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. B1 de la Tabla B)

P.f. 109-110 °C. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9,04 (bs, 1H), 8,69 (d, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,93 (dd, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,63 (m, 3H), 7,40 (t, 1H), 4,04 (s, 3H), 2,61 (s, 3H) ppm.

N-[2,6-dicloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-3-(4-flúor-2-clorobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. C1 de la Tabla C)

25 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9,12 (bs, 1H), 8,79-8,72 (m, 2H), 7,97 (m, 1H), 7,91 (dd, 1H), 7,68 (s, 2H), 7,48 (t, 1H), 7,25 (m, 1H), 7,16 (m, 1H), 4,04 (s, 3H) ppm.

N-[2,6-dicloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)fenil]-3-(4-ciano-2-metilbenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. C2 de la Tabla C)

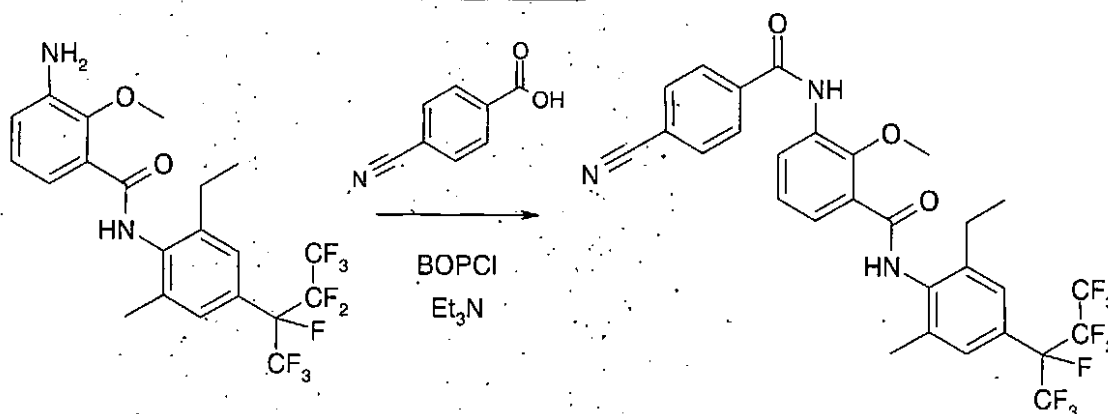
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8,99 (bs, 1H), 8,70 (d, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,92 (dd, 1H), 7,68 (s, 2H), 7,62 (s, 3H), 7,40 (t, 1H), 4,02 (s, 3H), 2,60 (s, 3H) ppm.

Se preparó el siguiente compuesto por el mismo procedimiento, excepto que se utilizó el cloruro de acilo directamente y se empleó trietilamina en lugar de piridina:

N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-3-(4-fluorbenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A1 de la Tabla A)

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8,68 (s, 1H), 8,57 (d, 1H), 8,30 (s, 1H), 7,89 (m, 2H), 7,80 (dd, 1H), 7,30 (m, 3H), 7,17 (m, 2H), 3,94 (s, 3H), 2,66 (q, 2H), 2,32 (s, 3H), 1,15 (t, 3H).

Ejemplo P2: *N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metil-fenil]-3-(4-cianobenzoilamino)-2-metoxibenzamida
(Compuesto No. A4 de la Tabla A)



A una solución de 3-amino-*N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetil-propil)-6-metilfenil]-2-metoxibenzamida (Ejemplo 15) (30 mg, 0,06 mmol) en tetrahidrofurano (1,2 ml) se agregó trietilamina (25 μl , 0,18 mmol). Se agregó ácido 4-cianobenzoico (17,6 mg, 0,12 mmol) y cloruro del ácido bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfónico ("BOP-Cl") (30,4 mg, 0,12 mmol). La mezcla de reacción fue calentada a reflujo por espacio de 6 horas. La mezcla de reacción fue enfriada a temperatura ambiente y concentrada. El residuo fue disuelto en diclorometano y lavado con ácido clorhídrico acuoso (1N) y con hidrógeno carbonato de sodio acuoso (saturado). El extracto orgánico fue secado sobre

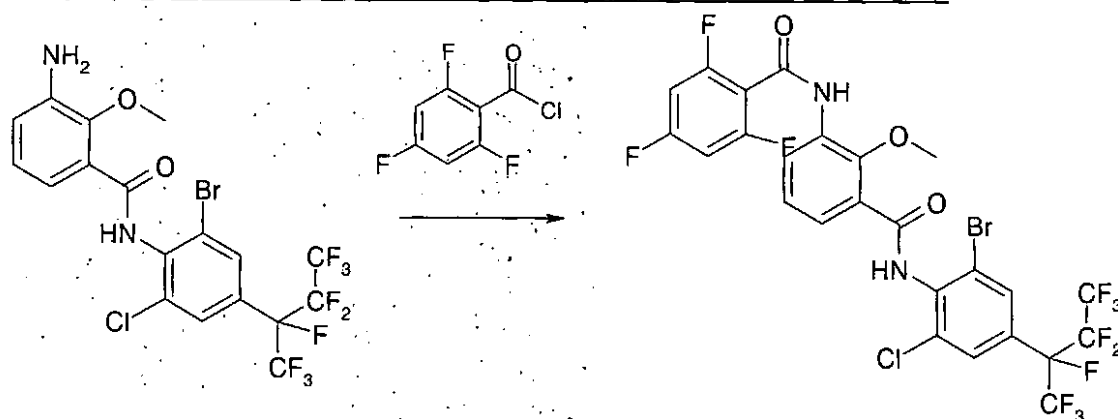
sulfato de sodio y concentrado. El residuo fue purificado por cromatografía en columna en gel de sílice (eluyente: ciclohexano / acetato de etilo 5:3) para dar el Compuesto No. A4 de la Tabla A (35 mg, 93% de rendimiento). ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8,56 (m, 2H), 8,48 (bs, 1H), 7,97 (m, 2H), 7,82 (d, 1H), 7,78 (d, 2H), 7,30 (m, 3H), 3,94 (s, 3H), 2,65 (q, 2H), 2,30 (s, 3H), 1,13 (t, 3H) ppm.

Por el mismo procedimiento se preparó el siguiente compuesto:

N-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-3-(2-metil-3-nitrobenzoilamino)-2-metoxibenzamida (Compuesto No. A2 de la Tabla A)

^1H -NMR (400 MHz, CDCl_3): 8,62 (d, 1H), 8,53 (s, 1H), 7,91 (m, 2H), 7,86 (d, 1H), 7,67 (d, 1H), 7,42 (t, 1H), 7,30 (m, 3H), 3,91 (s, 3H), 2,64 (q, 2H), 2,59 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 1,14 (t, 3H) ppm.

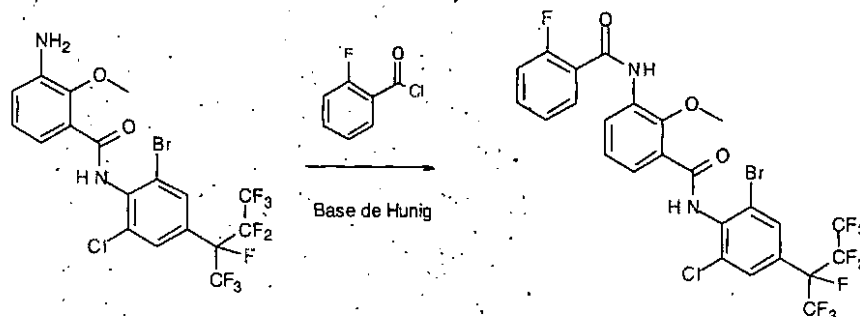
Ejemplo P3: N-[3-[2-Bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-fenilcarbamoyl]-2-metoxifenil]-2,4,6-trifluorbenzamida



A una solución de ácido 2,4,6-trifluorbenzoico (8,114 g, 46,08 mmol) y *N,N*-dimetilformamida (pocas gotas) en diclorometano (50 ml) bajo atmósfera de nitrógeno se agregó cloruro de oxalilo (4,55 ml, 53,76 mmol). Se agitó la mezcla de reacción por espacio de una hora a temperatura ambiente y luego a 60 °C durante 1 hora y media. La mezcla de reacción fue concentrada y el residuo disuelto en tetrahidrofurano (200 ml). Se agregó la solución, gota a gota, a una

solución de 3-amino-*N*-[2-bromo-6-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluorometilpropil)fenil]-2-metoxibenzamida (Ejemplo I5) (22,03 g, 38,40 mmol) y piridina (6,18 ml, 76,80 mmol) en tetrahidrofurano (200 ml). Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente por espacio de 2 horas. Se vertió la mezcla de reacción en hidrógeno carbonato de sodio acuoso (1M) y se extrajo la mezcla tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas fueron secadas sobre sulfato de sodio y concentradas. El residuo fue purificado por filtración en gel de sílice para dar el Compuesto No. B189 de la Tabla B (28,0 g, 99% de rendimiento). P.f. 179 °C. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): 9,14 (s, 1H), 8,72 (d, 1H), 8,28 (s, 1H), 7,97 (q, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,74(s, 1H), 7,41 (t, 1H), 6,88 (t, 1H), 4,08 (s, 3H) ppm.

Ejemplo P4: Preparación de benzamidas a partir de cloruros de ácido que se presten a síntesis paralela

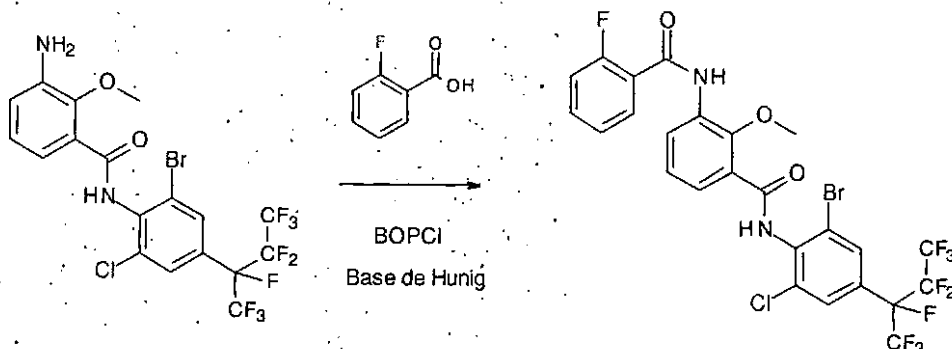


Se preparó la Solución A disolviendo el derivado amino (0,78 mmol), por ejemplo 3-amino-*N*-[2-cloro-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluorometilpropil)-6-bromofenil]-2-metoxibenzamida (Ejemplo I5) en el caso del Compuesto No. B3 de la Tabla B, en tolueno (15,6 ml). Se preparó la Solución B disolviendo el cloruro de ácido (45 μmol), por ejemplo cloruro de 2-fluorbenzoilo en el caso del Compuesto No. B3 de la Tabla B, en tolueno (0,36 ml). Se colocó la Solución A (0,6 ml, 30 μmol) en un pocillo y se agregó sucesivamente la Solución B (0,36 ml, 45 μmol) y diisopropiletilamina ("Base de Hunig") (30 μl, 150 μmol) al pocillo. Se agitó la

mezcla de reacción a 80 °C por espacio de 16 horas. Se evaporó el solvente y se diluyó la mezcla con una mezcla de acetonitrilo (0,6 ml) y *N,N*-dimetilacetamida (0,2 ml) y luego se la purificó por HPLC para dar el compuesto buscado.

Se utilizó este método para preparar un número de compuestos en paralelo.

5 Ejemplo P5: Preparación de benzamidas a partir de ácidos carboxílicos que se presten a la síntesis paralela



Se preparó la Solución A disolviendo el derivado amino (0,65 mmol), por ejemplo 3-amino-*N*-[2-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluor-1-trifluormetilpropil)-6-metilfenil]-2-metoxibenzamida (Ejemplo I5) en el caso del Compuesto No. A9 de la Tabla A, en *N,N*-dimetilacetamida ("DMA") (9,6 ml). Se preparó la Solución B disolviendo el ácido carboxílico (37,5 µmol), por ejemplo ácido 2-clorobenzoico en el caso del Compuesto No. A9 de la Tabla A, en *N,N*-dimetilacetamida ("DMA") (0,38 ml). Se preparó la Solución C disolviendo cloruro bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfínico ("BOP-Cl") (1,95 mmol) en *N,N*-dimetilacetamida ("DMA") (7,8 ml). Se introdujo la Solución A (0,4 ml, 0,025 mmol) en un pocillo y se agregó la Solución B (0,38 ml, 37,5 µmol), la Solución C (0,2 ml, 50 µmol) y diisopropiletilamina ("Base de Hunig") (40 µl, 200 µmol) sucesivamente al pocillo. Se agitó la mezcla de reacción a 100 °C por espacio de 16 horas. Se evaporó el solvente y se diluyó la mezcla con una mezcla de acetonitrilo (0,6 ml) y *N,N*-dimetilacetamida (0,2 ml) y luego se la purificó por HPLC para dar el compuesto buscado.

Se utilizó este método para preparar un número de compuestos en paralelo.

Se utilizó el siguiente método de HPLC-MS para el análisis de los compuestos de las Tablas A a L:

Método 1:

5

MS	Espectrómetro de Masas ZQ de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único), método de ionización: electroatomización, polaridad: ionización positiva, capilar (kV) 3,00; cono (V) 30,00, extractor (V) 3,00, temperatura de origen (°C) 100, temperatura de desolvatación (°C) 200, caudal de gas cono (L/h) 200, caudal de gas de desolvatación (L/h) 250, rango de masas: 150 a 800 Da.																				
LC	HPLC Serie 1100er de Agilent: bomba cuaternaria, compartimiento de columna caliente y detector de matriz de diodo. Columna: Waters Atlantis dc18, longitud 20 mm, diámetro interno 3 mm, tamaño de partícula: 3 µm, temperatura (°C) 40, rango de longitudes de onda DAD (nm): 200 a 500, gradientes de solvente: A = 0,1% de ácido fórmico en agua y B = 0,1% de ácido fórmico en acetonitrilo. <table><tr><th>Tiempo (min)</th><th>% de A</th><th>% de B</th><th>Caudal (ml/min)</th></tr><tr><td>0,0</td><td>80</td><td>20</td><td>1,7</td></tr><tr><td>2,5</td><td>0,0</td><td>100</td><td>1,7</td></tr><tr><td>2,8</td><td>0,0</td><td>100</td><td>1,7</td></tr><tr><td>2,9</td><td>80</td><td>20</td><td>1,7</td></tr></table>	Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)	0,0	80	20	1,7	2,5	0,0	100	1,7	2,8	0,0	100	1,7	2,9	80	20	1,7
Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)																		
0,0	80	20	1,7																		
2,5	0,0	100	1,7																		
2,8	0,0	100	1,7																		
2,9	80	20	1,7																		

Método 2:

MS	Espectrómetro de Masas ZQ de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único), método de ionización: electroatomización, polaridad: ionización positiva, capilar (kV) 3,00, cono (V) 30,00, extractor (V) 3,00, temperatura de origen (°C) 100, temperatura de desolvatación (°C) 200, caudal de gas cono (L/h) 200, caudal de gas de desolvatación (L/h) 250, rango de masas: 150 a 800 Da.																				
LC	HPLC Serie 1100er de Agilent: bomba cuaternaria, compartimiento de columna caliente y detector de matriz de diodo. Columna: Waters Atlantis dc18, longitud 20 mm, diámetro interno 3 mm, tamaño de partícula: 3 µm, temperatura (°C) 40, rango de longitudes de onda DAD (nm): 200 a 500, gradientes de solvente: A = 0,1% de ácido fórmico en agua y B = 0,1% de ácido fórmico en acetonitrilo. <table><tr><th>Tiempo (min)</th><th>% de A</th><th>% de B</th><th>Caudal (ml/min)</th></tr><tr><td>0,0</td><td>90</td><td>10</td><td>1,7</td></tr><tr><td>5,5</td><td>0,0</td><td>100</td><td>1,7</td></tr><tr><td>5,8</td><td>0,0</td><td>100</td><td>1,7</td></tr><tr><td>5,9</td><td>90</td><td>10</td><td>1,7</td></tr></table>	Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)	0,0	90	10	1,7	5,5	0,0	100	1,7	5,8	0,0	100	1,7	5,9	90	10	1,7
Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)																		
0,0	90	10	1,7																		
5,5	0,0	100	1,7																		
5,8	0,0	100	1,7																		
5,9	90	10	1,7																		

10

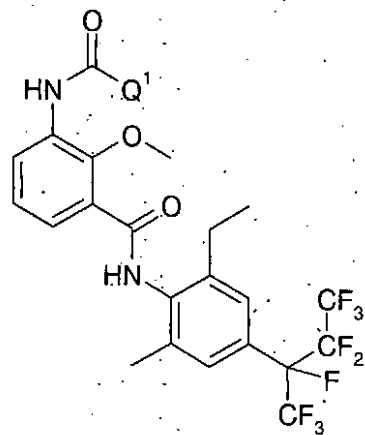
Método 3:

MS	Espectrómetro de Masas ZQ de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único). Parámetro del instrumento: método de ionización: electroatomización, polaridad: iones negativos, capilar (kV) 3,00, cono (V) 30,00, extractor (V) 2,00, temperatura de origen (°C) 100, temperatura de desolvatación (°C) 250, caudal de gas cono (L/h) 50, caudal de gas de desolvatación (L/h) 400, rango de masas: 150 a 1000 Da.																										
LC	HP 1100 HPLC de Agilent: desgasificador de solvente, bomba cuaternaria (ZCQ)/ bomba binaria (ZDQ) compartimiento de columna caliente y detector de matriz de diodo. Columna: Phenomenex Gemini C18, tamaño de partícula 3 µm, 110 Angström, 30 x 3 mm, Temperatura 60 °C, rango de longitudes de onda DAD (nm): 200 a 500, gradientes de solvente: A = agua + 0,05% de HCOOH, B= acetonitrilo/metanol (4:1, v:v) + 0,04 % de HCOOH <table> <tr> <th>Tiempo (min)</th><th>% de A</th><th>% de B</th><th>Caudal (ml/min)</th></tr> <tr> <td>0,00</td><td>95,0</td><td>5,0</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>2,00</td><td>0,00</td><td>100,00</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>2,80</td><td>0,00</td><td>100,00</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>2,90</td><td>95,0</td><td>5,0</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>3,00</td><td>95,0</td><td>5,0</td><td>1,7</td></tr> </table>			Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)	0,00	95,0	5,0	1,7	2,00	0,00	100,00	1,7	2,80	0,00	100,00	1,7	2,90	95,0	5,0	1,7	3,00	95,0	5,0	1,7
Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)																								
0,00	95,0	5,0	1,7																								
2,00	0,00	100,00	1,7																								
2,80	0,00	100,00	1,7																								
2,90	95,0	5,0	1,7																								
3,00	95,0	5,0	1,7																								

Método 4:

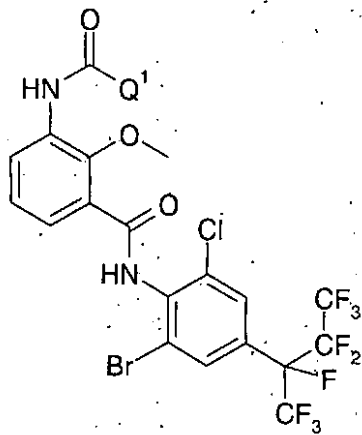
MS	Espectrómetro de Masas ZQ de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único), Parámetro del instrumento: método de ionización: electroatomización, polaridad: iones negativos, capilar (kV) 3,00, cono (V) 30,00, extractor (V) 2,00, temperatura de origen (°C) 100, temperatura de desolvatación (°C) 250, caudal de gas cono (L/h) 50, caudal de gas de desolvatación (L/h) 400. Rango de masas: 150 a 1000 Da.																										
LC	HP1100 HPLC de Agilent: desgasificador de solvente, bomba cuaternaria (ZCQ)/ bomba binaria (ZDQ) compartimiento de columna caliente y detector de matriz de diodo. Columna: Phenomenex Gemini C18, tamaño de partícula 3 µm, 110 Angström, 30 x 3 mm, temperatura 60 °C, rango de longitudes de onda DAD (nm): 200 a 500, gradientes de solvente: A = agua + 0,05% de HCOOH, B= acetonitrilo/metanol (4:1, v:v) + 0,04 % de HCOOH <table> <tr> <th>Tiempo (min)</th><th>% de A</th><th>% de B</th><th>Caudal (ml/min)</th></tr> <tr> <td>0,00</td><td>95,0</td><td>5,0</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>2,00</td><td>0,00</td><td>100,00</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>2,80</td><td>0,00</td><td>100,00</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>2,90</td><td>95,0</td><td>5,0</td><td>1,7</td></tr> <tr> <td>3,00</td><td>95,0</td><td>5,0</td><td>1,7</td></tr> </table>			Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)	0,00	95,0	5,0	1,7	2,00	0,00	100,00	1,7	2,80	0,00	100,00	1,7	2,90	95,0	5,0	1,7	3,00	95,0	5,0	1,7
Tiempo (min)	% de A	% de B	Caudal (ml/min)																								
0,00	95,0	5,0	1,7																								
2,00	0,00	100,00	1,7																								
2,80	0,00	100,00	1,7																								
2,90	95,0	5,0	1,7																								
3,00	95,0	5,0	1,7																								

Tabla A:



Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
A1	4-fluorfenilo	3,87	624,8		2
A2	2-metil-3-nitrofenilo	—	—		
A3	2-cloro-4-fluorfenilo	—	—		
A4	4-cianofenilo	3,77	631,9		2
A5	4-ciano-2-metilfenilo	—	—	104	
A6	2-cloropirid-3-ilo	3,65	641,8		2
A7	2-fluorpirid-3-ilo	3,79	625,8		2
A8	3-clorofenilo	4,04	640,8		2
A9	2-clorofenilo	3,94	640,8		2
A10	2-cloropirid-4-ilo	3,76	641,8		2
A11	5-bromopirid-3-ilo	3,75	687,7		2
A12	5-bromofuran-2-ilo	3,98	676,7		2
A13	2-bromofenilo	3,94	686,7		2
A14	3-cloro-5-trifluormetilpirid-2-ilo	4,3	709,8		2
A15	2-flúor-3-trifluormetilfenilo	4,24	692,8		2
A16	2,5-diclorofenilo	4,13	674,8		2
A17	6-cloropirid-3-ilo	3,67	641,8		2
A18	4-nitrofenilo	3,86	651,8		2
A19	fenilo	3,84	606,8		2
A20	2,3-difluorfenilo	4,07	642,8		2
A21	5-clorotiofen-2-ilo	4,07	646,8		2
A22	2-metil-4-nitrofenilo			175	

Tabla B:



(Ib)

Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
B1	4-ciano-2-metilfenilo	—	—		
B2	2-cloro-4-fluorfenilo	2,2	730,7		1
B3	2-fluorfenilo	2,23	696,6		1
B4	2-metilfenilo	2,17	692,7		1
B5	2-clorofenilo	2,18	712,7		1
B6	4-cianofenilo	2,07	703,7		1
B7	4-nitrofenilo	2,06	722,0		1
B8	4-metilfenilo	2,21	692,7		1
B9	4-flúor-2-metilfenilo	2,18	710,7		1
B10	5-cloro-2-fluorfenilo	2,34	730,6		1
B11	2-cloro-4-nitrofenilo	2,19	757,7		1
B12	furan-2-ilo	2,06	668,7		1
B13	4-trifluormetoxifenilo	2,29	762,7		1
B14	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	2,27	764,7		1
B15	4-trifluormetilfenilo	2,05	746,7		1
B16	2-trifluormetoxifenilo	2,26	762,7		1
B17	2-metoxifenilo	2,28	708,7		1
B18	fenilo	2,12	678,6		1
B19	4-fluorfenilo	2,13	696,7		1
B20	2-trifluormetilfenilo	2,17	746,7		1
B21	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-il	2,05	700,6		1
B22	2,3-difluorfenilo	2,25	714,7		1
B23	2,4-difluorfenilo	2,26	714,7		1
B24	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	2,34	764,7		1
B25	4-isopropilfenilo	4,55	719,07		2
B26	4-metilsulfanylfenilo	4,27	722,99		2
B27	2,5-diclorofenilo	4,44	744,97		2
B28	4-metoxifenilo	4,1	707		2
B29	2,4,5-trifluor-3-clorofenilo	4,59	764,98		2
B30	4-(pirròl-1-il)fenilo	4,35	742,06		2

Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
B31	4-(1,2,3-tiadiazol-4-il)fenilo	4,18	761,02		2
B32	(3,4-dihidro-2H-benzo[b][1,4]dioxepina)-7-il	4,16	749,06		2
B33	4-bifenilo	4,54	753,08		2
B34	3-metilpiridin-2-il	4,55	692		2
B35	2-fluor-3-trifluormetilfenilo	4,49	763		2
B36	2-bromofenilo	4,18	754,94		2
B37	piridin-3-ilo	3,57	677,98		2
B38	4-metoxitiofen-3-il	4,41	712,99		2
B39	1,2,3-tiadiazol-4-il	4,07	684,96		2
B41	5-feniloxazol-4-il	4,76	744,05		2
B42	2,5-dimetil-2H-pirazol-3-ilo	3,91	695,04		2
B43	4-metil-2-fenilopirimidin-5-il	4,41	769,07		2
B44	tiofen-2-il	4,07	682,96		2
B45	2-metilsulfanylpiridin-3-ilo	4,1	723,99		2
B46	5-metil-3-feniloisoxazol-4-ilo	4,39	758,06		2
B47	4-metil-2-fenilotiazol-5-ilo	4,6	774,06		2
B48	5-piridin-2-iltiofen-2-il	4,22	760,02		2
B49	5-fenilofuran-2-ilo	4,54	743,02		2
B50	5-metil-1-fenilo-1H-pirazol-4-ilo	4,17	757,06		2
B51	6-morfolin-4-il-pirazin-2-ilo	4,03	763,92		2
B52	5-bromofuran-2-ilo	4,26	744,84		2
B53	piridin-2-ilo	4,46	677,9		2
B54	piridin-4-ilo	3,57	677,9		2
B55	N-oxopiridin-3-il	3,23	693,91		2
B56	pirazin-2-il	4,03	678,91		2
B57	3-bromotiofen-2-ilo	4,84	760,8		2
B58	2,5-dimetilfuran-3-ilo	4,29	694,91		2
B61	5-nitrofuran-2-ilo	4,03	711,88		2
B62	2-cloro-5-nitrofenilo	4,29	755,9		2
B63	2,5-dimetilfuran-3-ilo	4,36	775,84		2
B64	2-nitro-4-clorofenilo	4,26	755,91		2
B65	3-metil-4-bromofenilo	4,54	768,9		2
B66	3-cloropiridin-4-ilo	3,87	711,91		2
B67	5-clorotiofen-2-ilo	4,36	716,85		2
B68	3-cloro-5-iodofenilo	4,55	836,84		2
B69	2-metil-3-nitrofenilo	4,11	735,96		2
B70	3-cloro-5-trifluormetilfenilo	4,42	778,92		2
B71	pirimidin-2-ilo	3,76	678,91		2
B72	2-cloro-5-metilfenilo	4,39	724,9		2
B73	2-cloro-4,5-difluorfenilo	4,33	746,88		2
B74	2-nitro-5-metilfenilo	4,13	735,94		2
B75	2,6-dicloro-5-fluorpiridin-3-il	4,37	763,86		2

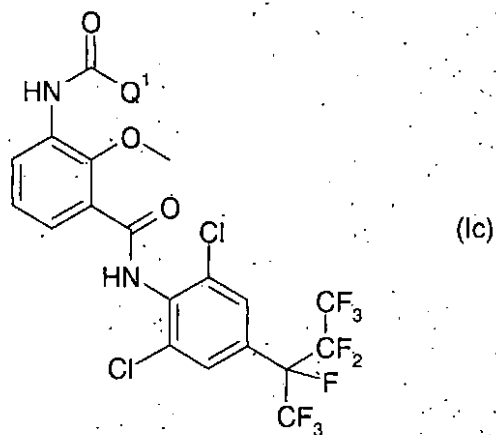
Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
B76	4-bromo-2-etil-5-metil-2H-pirazol-3-ilo	4,59	786,91		2
B77	4-flúor-3-nitrofenilo	4,13	739,92		2
B78	2-piridin-3-iltiazol-4-il	4,26	760,91		2
B80	2-nitrofenilo	4,04	721,9		2
B81	2-trifluormetilpiridin-3-il	3,97	745,92		2
B82	3-metilpiridin-4-il	3,45	691,94		2
B83	5-bromo-2-clorofenilo	4,52	788,81		2
B84	3-bromo-4-metilfenilo	4,52	768,87		2
B85	2-bromo-3-nitrofenilo	4,13	799,85		2
B86	2-metil-3,5-dinitrofenilo	4,24	780,97		2
B87	3-metil-2-nitrofenilo	4,11	735,9		2
B88	3-metiltiofen-2-ilo	4,31	696,87		2
B89	3-metoxiisoxazol-5-ilo	4,04	697,88		2
B90	6-cloro-1-oxipiridin-2-ilo	4,12	727,89		2
B91	2-hidroxi-3,5-triclorofenilo	4,2	760,84		2
B92	1-metil-5-trifluormetil-1H-pirazol-3-ilo	4,46	748,9		2
B93	3-cloro-2-metilpiridin-4-ilo	3,98	725,88		2
B94	4-metiloxazol-5-ilo	3,85	681,88		2
B95	2-metoximetil-4-metiltiazol-5-ilo	4,02	741,93		2
B96	2,4-dimetiltiazol-5-ilo	3,96	711,91		2
B97	2,6-dicloropiridin-4-ilo	4,4	745,84		2
B98	3-metilisotiazol-4-ilo	3,88	697,88		2
B99	Ester metílico de 4-metilsulfanilfenilo del ácido 2-metil-3-carboxílico	4,28	794,94		2
B100	1,5-dimetil-1H-pirazol-3-ilo	4,15	694,9		2
B101	2-cloro-6-nitrofenilo	4,16	755,86		2
B102	4-cloro-2-flúor-5-nitrofenilo	4,33	773,92		2
B103	4-cloro-5-difluormetoxi-1-metil-1H-pirazol-3-ilo	4,4	780,87		2
B104	4-metil-2-trifluormetiltiazol-5-ilo	4,42	765,87		2
B105	2-cloro-4-metiltiazol-5-ilo	4,36	731,83		2
B106	2,3-dicloro-4-(2-metoxi-etoxi)fenilo	4,38	818,88		2
B107	5-ciano-6-metilpiridin-2-ilo	4,45	716,9		2
B108	2-metansulfonil-4-trifluormetilfenilo	4,13	822,89		2
B109	2,4-dicloro-3-metoxifenilo	4,46	774,84		2
B110	3-cianometilfenilo	3,95	715,89		2
B111	pirimidin-5-ilo	3,55	678,85		2
B112	5-terc-butil-2-metil-2H-pirazol-3-ilo	4,41	736,95		2

Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
B113	2-metil-5-trifluormetil-2H-pirazol-3-ilo	4,29	748,9		2
B114	2-cloro-4-metansulfonil-3-metoxifenilo	4,03	818,87		2
B115	3-cloro-2-trifluormetil-piridin-4-ilo	4,3	779,85		2
B116	4-metilsulfanyl-2-nitrofenilo	4,2	767,85		2
B117	3-ciano-1-metil-1H-pirazol-4-ilo	3,82	705,98		2
B118	2-(2-clorofenilo)-4-trifluormetil-tiazol-5-ilo	4,85	861,85		2
B119	4-metansulfonil-3-metoximetil-2-metilfenilo	3,91	812,93		2
B120	3-[dietoxifosfinil]oxilFenilo	4,09	828,93		2
B121	2-isopropilsulfanylpiridin-3-ilo	4,44	751,93		2
B122	2-(3-etoxipropil)-6-trifluormetil-piridin-3-ilo	4,48	831,96		2
B123	4'-cloro-4-metilbifenilo-3-ilo	4,81	800,91		2
B124	tiofen-3-ilo	4,02	682,83		2
B125	2-metilsulfanyl-4-trifluormetilfenilo	4,48	790,86		2
B126	4-trifluormetilpiridin-5-ilo	3,96	745,86		2
B127	2-metil-6-trifluormetilpiridin-3-ilo	4,19	759,89		2
B128	2,6-dicloronicotin-3-ilo	4,31	745,8		2
B129	6-metoxi-3-bromo-2-metilfenilo	4,49	798,83		2
B130	2-cloro-4-flúor-5-nitrofenilo	4,31	773,84		2
B131	3-difluormetil-1-metil-1H-pirazol-4-ilo	3,9	730,88		2
B132	2-metoxipiridin-3-ilo	4,47	707,87		2
B133	4-cloro-2-metil-5-trifluormetil-2H-pirazol-3-ilo	4,64	782,84		2
B134	2-metil-4-trifluormetiltiazol-5-ilo	4,19	765,83		2
B135	2-cloro-4-bromofenilo	4,55	788,8		2
B136	4-cloro-1-metil-5-trifluormetil-1H-pirazol-3-ilo	4,56	782,84		2
B137	5-metiltiofen-2-ilo	4,2	696,82		2
B138	4-bromo-2-metilfenilo	4,44	768,8		2
B139	4-bromo-3-metoxi-2-metilfenilo	4,42	798,83		2
B140	5-terc-butil-2-metoxifenilo	4,92	762,94		2
B141	3-cloro-5-trifluormetilpiridin-2-ilo	4,57	779,82		2
B142	5-cloro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-ilo	4,14	728,85		2
B143	4,5-dicloroisotiazol-3-ilo	4,63	751,75		2
B144	5-metil-2-trifluormetilfuran-3-ilo	4,36	748,83		2
B145	3-clorotiofen-2-ilo	4,61	716,78		2
B146	2-cloro-6-metoxipiridin-4-ilo	4,32	741,83		2
B147	5-cloro-4-metoxitiofen-3-ilo	4,62	746,8		2

Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
B148	2-fluor-5-nitrofenilo	4,34	739,85		2
B149	3-cloro-2-fluor-6-trifluormetilfenilo	4,48	796,81		2
B150	6-difluormetil-2-metoximetilpiridin-3-ilo	4,09	771,9		2
B151	2-fluorpiridin-4-ilo	3,88	695,84		2
B152	1-metil-3-trifluormetil-1H-pirazol-4-ilo	4,02	748,85		2
B153	2,5-difluorfenilo	4,1	712,93		2
B154	2-cloro-5-fluorfenilo	4,19	728,91		2
B155	2,4-diclorofenilo	4,39	744,89		2
B156	2-metil-3-clorofenilo	4,39	724,89		2
B157	3,5-dimetil-isoxazol-4-ilo	3,96	695,86		2
B158	2,6-diclorofenilo			116	
B159	2-cloro-4-bromo-6-metilfenilo			114	
B160	2-hidroxil-3,5-diclorofenilo			200	
B161	2-iodo-3-metil-4-nitrofenilo			175	
B162	2-bromo-3-metil-4-nitrofenilo			172	
B163	2-cloro-3-metil-4-nitrofenilo			127	
B164	2,6-dimetoxifenilo			105	
B165	3,5-dimetil-4-nitrofenilo			218	
B166	2-metoxi-6-fluorfenilo			112	
B167	2-fluor-4-trifluormetilfenilo			183	
B168	3,5-difluorfenilo			83	
B169	2,5-difluorfenilo			154	
B170	3-cloro-4-nitrofenilo			95	
B171	3-acetate-4-nitrofenilo			100	
B172	2,6-difluorfenilo			177	
B173	3-etoxi-4-nitrofenilo			238	
B174	3-amino-4-nitrofenilo			205	
B175	3-(N,N-dimetilamino)-4-nitrofenilo			181	
B176	2,6-difluor-4-cianofenilo			214	
B177	2-metoxi-4-nitrofenilo			190	
B178	2-trifluormetil-4-nitrofenilo			140	
B179	3-trifluormetil-4-nitrofenilo			142	
B180	2,4-dinitrofenilo			246	
B181	3-hidroxil-4-nitrofenilo			185	
B182	2-cloro-4-metilfenilo			172	
B183	2-cloro-3-nitrofenilo			123	
B184	2,3-diclorofenilo			136	
B185	3,5-dicloropiridin-2-ilo			181	
B186	2,5-diclorotiofen-3-ilo			188	
B187	5-bromopirimidin-2-ilo			204	

Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
B188	3-trifluormetilpiridin-2-ilo			175	
B189	2,4,6-trifluorfenilo			179	
B190	3-metil-4-nitrofenilo			107	
B191	2-flúor-4-nitrofenilo			212	
B192	3-flúor-4-nitrofenilo			104	
B193	3-nitrofenilo			98	
B194	2-flúor-piridin-3-ilo			167	
B195	3,4-dinitrofenilo			114	
B196	2-metil-4-nitrofenilo			104	
B197	2-flúor-4-nitrofenilo			199	
B198	2-cloro-4-cianofenilo			211	
B202	2-cloro-piridin-3-ilo	2,05	710		4
B203	2-metoxi-4-ciano-6-hidroxifenilo	2,1	599		4
B204	4-ciano-piridin-3-ilo	2,04	701		4
B205	3-flúor-4-cianofenilo	2,19	826		3
B206	3-bromo-4-cianofenilo	2,18	778		3
B207	3-metoxi-4-nitrofenilo	2,12	750		4
B208				208	
	5-cianopiridin-2-ilo			210	
B209	4-bromo-2,6-diclorofenilo			250	
B210				114	
	2,4-dicloropirimidin-5-ilo			115	
B211				113	
	2,4-dicloro-6-metilfenilo			118	
B212	2-metil-4-flúor-5-nitrofenilo			83-84	
B213				158	
	2-metil-4-ciano-5-nitrofenilo			161	

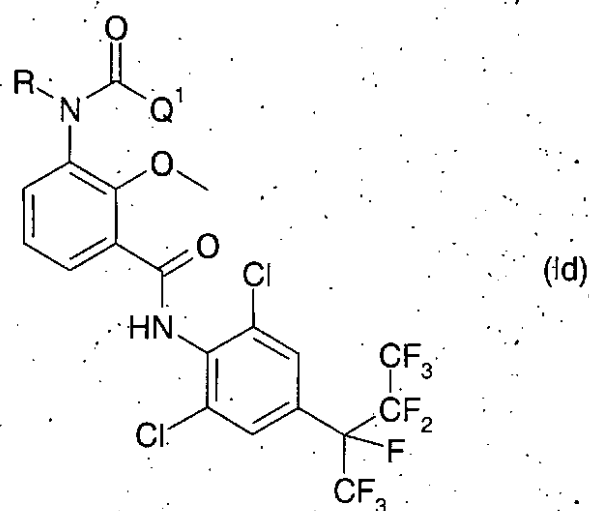
Tabla C:



Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	Método de LC-MS
C1	2-cloro-4-fluorfenilo	2,19	686,7	1
C2	4-ciano-2-metilfenilo	—	—	
C3	2-fluorfenilo	2,24	650,8	1
C4	2-metilfenilo	2,16	646,8	1
C5	2-clorofenilo	2,17	666,7	1
C6	4-cianofenilo	2,05	657,8	1
C7	4-nitrofenilo	2,05	677,9	1
C8	4-metilfenilo	2,2	646,8	1
C9	4-flúor-2-metilfenilo	2,18	664,8	1
C10	5-cloro-2-fluorfenilo	2,34	686,7	1
C11	2-cloro-4-nitrofenilo	2,16	713,7	1
C12	furan-2-ilo	2,05	622,8	1
C13	4-trifluormetoxifenilo	2,28	716,8	1
C14	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	2,27	718,8	1
C15	4-trifluormetilfenilo	2,05	700,8	1
C16	2-trifluormetoxifenilo	2,26	716,8	1
C17	2-metoxifenilo	2,27	662,8	1
C18	fenilo	2,12	634,7	1
C19	4-fluorfenilo	2,13	650,8	1
C20	2-trifluormetilfenilo	2,17	700,7	1
C21	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	2,04	654,7	1
C22	2,3-difluorfenilo	2,24	668,7	1
C23	2,4-difluorfenilo	2,25	668,7	1
C24	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	2,34	718,7	1
C25	2-metil-4-nitrofenilo	2,15	690	3
C26	2,4-diclorofenilo	2,22	699	3
C27	2,3-diclorofenilo	2,2	699	3
C28	3-nitrofenilo	2,13	676	3
C29	2-cloropiridine-3-il	2,07	666	3
C30	3,5-dimetilisoxazol-4-il	2,09	650	3
C31	2-flúor-4-cianofenilo	2,14	674	3
C32	2-metil-3-clorofenilo	2,21	679	3
C33	2,4,6-trifluorfenilo	2,15	685	3

Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	Método de LC-MS
C34	2-fluorpiridin-3-il	2,12	650	3
C35	3-metil-4-nitrofenilo	2,17	690	3
C36	2-flúor-4-nitrofenilo	2,17	694	3
C37	3-flúor-4-nitrofenilo	2,14	694	3
C38	3,4-dinitrofenilo	2,14	721	3
C39	3-hidroxi-4-nitrofenilo	2,11	692	3
C40	2-cloro-4-cianofenilo	2,13	690	3
C41	3-flúor-4-cianofenilo	2,12	674	3
C42	4-flúor-3-cianofenilo	2,11	674	3
C43	2-cloro-4-metilfenilo	2,21	679	3
C44	2-cloro-3-nitrofenilo	2,14	710	3

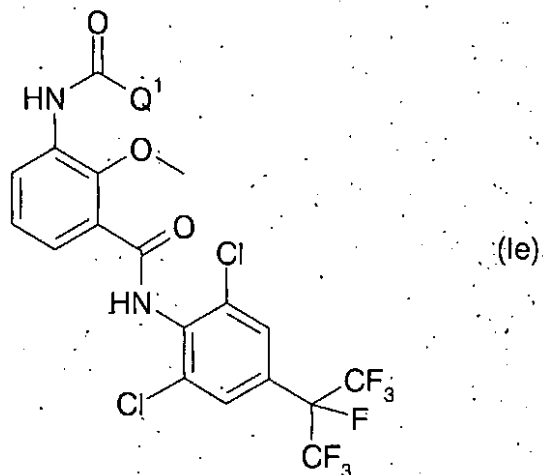
Tabla D:



Comp. No.	Q ¹	R ¹	TR (min)	MH ⁺	Método de LC-MS
D1	fenilo	Me	3,92	646,98	2
D2	fenilo	Et	4,07	660,95	2
D3	4-cianofenilo	Me	3,8	671,94	2
D4	4-cianofenilo	Et	3,96	685,97	2
D5	4-flúor-2clorofenilo	Me	4,1	698,9	2
D6	4-flúor-2clorofenilo	Et	4,23	712,87	2
D7	2-fluorfenilo	Me	3,94	664,88	2
D8	2-metilfenilo	Me	4,02	660,96	2
D9	2-clorofenilo	Me	4,05	682,92	2
D10	4-metilfenilo	Me	4,06	660,97	2
D11	4-flúor-2-metilfenilo	Me	4,04	678,96	2
D12	5-cloro-2-fluorfenilo	Me	4,13	698,93	2
D13	2-cloro-4-nitrofenilo	Me	4,08	725,94	2
D14	furán-2-ilo	Me	3,75	636,92	2
D15	4-trifluormetoxifenilo	Me	4,26	730,94	2

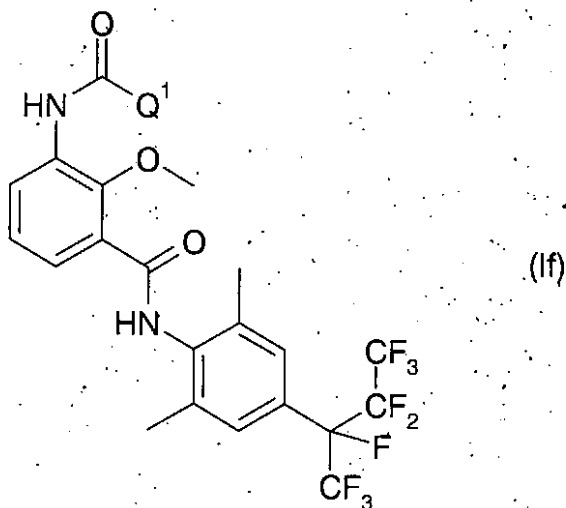
Comp. No.	Q ¹	R ¹	TR (min)	MH ⁺	Método de LC-MS
D16	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	Me	4,23	732,95	2
D17	4-trifluormetilfenilo	Me	4,19	714,95	2
D18	2-trifluormetoxifenilo	Me	4,21	730,94	2
D19	2-metoxifenilo	Me	3,9	676,97	2
D2	4-fluorfenilo	Me	3,95	664,96	2
D21	2-trifluormetilfenilo	Me	4,15	714,95	2
D22	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	Me	3,79	668,94	2
D23	2,3-difluorfenilo	Me	3,97	682,94	2
D24	2,4-difluorfenilo	Me	4,01	682,96	2
D25	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	Me	4,22	732,95	2
D26	2-fluorfenilo	Et	4,1	678,97	2
D27	2-metilfenilo	Et	4,17	674,99	2
D28	2-clorofenilo	Et	4,18	694,94	2
D29	4-metilfenilo	Et	4,2	674,99	2
D30	4-flúor-2-metilfenilo	Et	4,19	692,99	2
D31	5-cloro-2-fluorfenilo	Et	4,29	712,94	2
D32	2-cloro-4-nitrofenilo	Et	4,22	739,84	2
D33	furan-2-ilo	Et	3,93	650,95	2
D34	4-trifluor-metoxifenilo	Et	4,4	744,96	2
D35	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	Et	4,34	746,92	2
D36	4-trifluormetilfenilo	Et	4,34	728,93	2
D37	2-trifluormetoxifenilo	Et	4,34	744,91	2
D38	2-metoxifenilo	Et	4,05	690,93	2
D39	4-fluorfenilo	Et	4,11	678,95	2
D40	2-trifluormetilfenilo	Et	4,26	728,92	2
D41	2,3-difluorfenilo	Et	4,14	696,89	2
D42	2,4-difluorfenilo	Et	4,14	696,89	2
D43	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	Et	4,34	746,92	2
D44	2-cloro-4-cianofenilo	Me	2,11	704	4
D45	2-cloro-4-cianofenilo	Et	2,13	718	4
D46	4-nitrofenilo	Me	2,1	690	4
D47	4-nitrofenilo	Et	2,15	704	4
D48	2,6-difluorfenilo	Me	2,12	681	4
D49	2,6-difluorfenilo	Et	2,17	696	4

Tabla E:



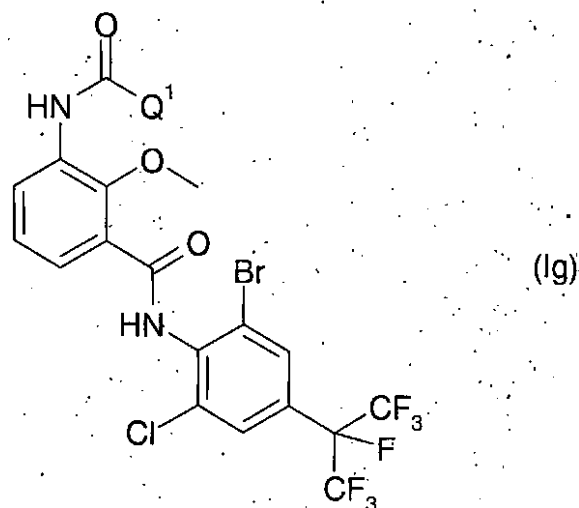
Comp. No.	Q¹	TR (min)	MH⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
E1	2-fluorfenilo	4,27	600,78		2
E2	2-metilfenilo	4,13	596,83		2
E3	2-clorofenilo	4,11	616,78		2
E4	4-cianofenilo	3,87	607,81		2
E5	4-nitrofenilo	4,06	627,82		2
E6	4-metilfenilo	4,17	596,86		2
E7	4-flúor-2-metilfenilo	4,12	614,83		2
E8	5-cloro-2-fluorfenilo	4,46	634,78		2
E9	2-cloro-4-nitrofenilo	4,19	661,78		2
E10	furan-2-ilo	3,87	572,85		2
E11	4-trifluormetoxifenilo	4,35	666,82		2
E12	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	4,31	668,82		2
E13	4-trifluormetilfenilo	4,3	650,85		2
E14	2-trifluormetoxifenilo	4,3	666,87		2
E15	2-metoxifenilo	4,29	612,87		2
E16	fenilo	4	582,87		2
E17	4-fluorfenilo	4,04	600,85		2
E18	2-trifluormetilfenilo	4,13	650,88		2
E19	2-cloro-4-fluorfenilo	4,16	634,82		2
E20	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	3,81	604,82		2
E21	2,3-difluorfenilo	4,24	618,85		2
E22	2,4-difluorfenilo	4,31	618,85		2
E23	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	4,48	668,86		2
E24	2,5-difluor-4-cianofenilo			192	
E25	2-metil-4-cianofenilo	2,08	620		4
E26	3-metil-4-nitrofenilo	2,13	640		4
E27	2-metil-4-nitrofenilo	2,11	640		4
E28	2,4,6-trifluorfenilo	2,11	635		4
E29	2,6-difluorfenilo	2,09	617		4

Tabla F:



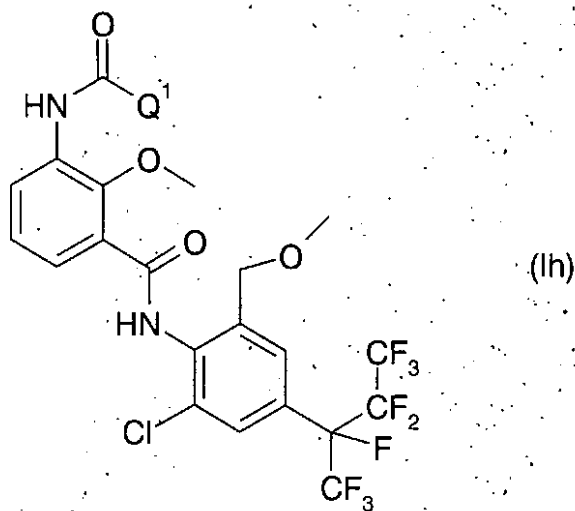
Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
F1	2-fluorfenilo	4,2	610,92		2
F2	2-metilfenilo	4,05	606,96		2
F3	2-clorofenilo	4,07	626,9		2
F4	furan-2-ilo	3,85	582,98		2
F5	4-trifluormetoxifenilo	4,3	676,94		2
F6	3-trifluormetil-4-fluorfenilo	4,28	678,96		2
F7	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	3,8	614,95		2
F8	2,3-difluorfenilo	4,2	628,96		2
F9	2,4-difluorfenilo	4,23	628,97		2
F10	2,4,6-trimetilfenilo	4,29	635,03		2
F11	2,3-dimetilfenilo	4,17	621,05		2
F12	2-flúor-5-clorofenilo	4,42	644,97		2
F13	2-flúor-4-clorofenilo	4,42	644,97		2
F14	2-flúor-4-trifluormetilfenilo	4,43	679		2
F15	2,4-diclorofenilo	4,29	660,95		2
F16	2-cloro-4-metansulfonilfenilo	3,78	704,95		2
F17	3,4-diclorofenilo	4,38	660,91		2
F18	4-metansulfonilfenilo	3,64	670,96		2
F19	4-clorofenilo	4,19	626,97		2
F20	3-fluorfenilo	4,05	611		2
F21	3-cianofenilo	3,9	618		2
F22	3-metoxifenilo	4,03	623		2
F23	3-metil-4-nitrofenilo			179	
F24	2-metil-4-nitrofenilo			203	
F25	2,4,6-trifluorfenilo			194	
F26	4-trifluormetilfenilo			163	
F27	2-metil-4-fluorfenilo			178	
F28	2-cloro-4-nitrofenilo			207	
F29	4-nitrofenilo			105	
F30	2-cloro-4-fluorfenilo			164	

Tabla G:



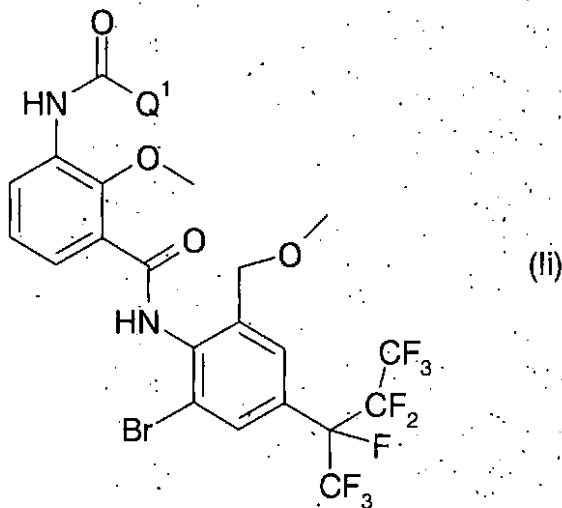
Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
G1	2-metil-4-cianofenilo			190	
G2	2-cloro-4-cianofenilo			211	
G3	2,4,6-trifluorfenilo			181	
G4	2,6-difluor-4-cianofenilo			118	
G5	2-cloro-4-fluorfenilo	4,23	679,1	183	2
G6	2-fluorfenilo	4,3	645,15		2
G7	2-metilfenilo	4,15	641,19		2
G8	2-clorofenilo	4,17	661,13		2
G9	4-cianofenilo	3,93	652,17		2
G10	4-nitrofenilo	4,08	672,14		2
G11	4-metilfenilo	4,23	641,19		2
G12	4-flúor-2-metilfenilo	4,19	659,17		2
G13	5-cloro-2-fluorfenilo	4,52	679,12		2
G14	2-cloro-4-nitrofenilo	4,2	706,1		2
G15	furan-2-ilo	3,94	617,14		2
G16	4-trifluormetoxifenilo	4,41	711,11		2
G17	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	4,4	713,12		2
G18	4-trifluormetilfenilo	4,36	695,12		2
G19	2-trifluormetoxifenilo	4,37	711,11		2
G20	2-metoxifenilo	4,43	657,17		2
G21	fenilo	4,07	627,15		2
G22	4-fluorfenilo	4,09	645,15		2
G23	2-trifluormetilfenilo	4,18	695,12		2
G24	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	3,88	649,12		2
G25	2,3-difluorfenilo	4,3	663,15		2
G26	2,4-difluorfenilo	4,34	663,15		2
G27	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	4,54	713,12		2

Tabla H:



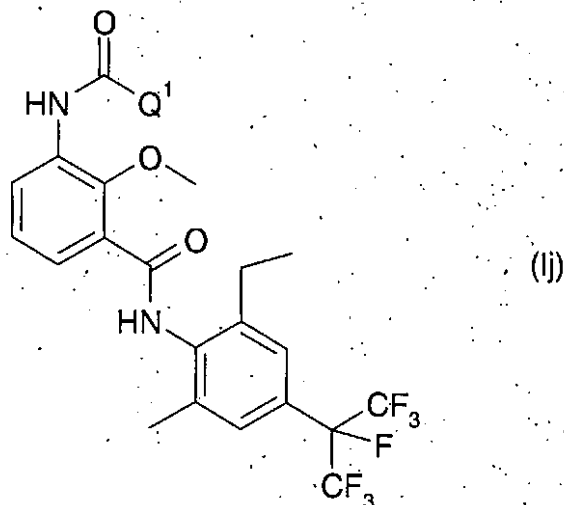
Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
H1	2-metil-4-cianofenilo			110	
H2	2,4,6-trifluorfenilo			138	
H3	2-fluorfenilo	4,44	661,33		2
H4	2-metilfenilo	4,32	657,37		2
H5	2-clorofenilo	4,33	677,32		2
H6	4-cianofenilo	4,12	668,35		2
H7	4-nitrofenilo	4,22	688,35		2
H8	4-metilfenilo	4,38	657,24		2
H9	4-flúor-2-metilfenilo	4,35	675,36		2
H10	5-cloro-2-fluorfenilo	4,68	695,29		2
H11	2-cloro-4-nitrofenilo	4,34	722,28		2
H12	furan-2-ilo	4,13	633,33		2
H13	4-trifluormetoxifenilo	4,55	727,29		2
H14	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	4,51	729,3		2
H15	4-trifluormetilfenilo	4,5	711,3		2
H16	2-trifluormetoxifenilo	4,53	727,32		2
H17	2-metoxifenilo	4,52	673,35		2
H18	fenilo	4,2	643,27		2
H19	4-fluorfenilo	4,24	661,27		2
H20	2-trifluormetilfenilo	4,34	711,3		2
H21	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	4,04	665,3		2
H22	2,3-difluorfenilo	4,48	679,32		2
H23	2,4-difluorfenilo	4,48	679,29		2
H24	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	4,66	729,3		2
H25	2-cloro-4-fluorfenilo	4,39	695,26	98	2

Tabla I:



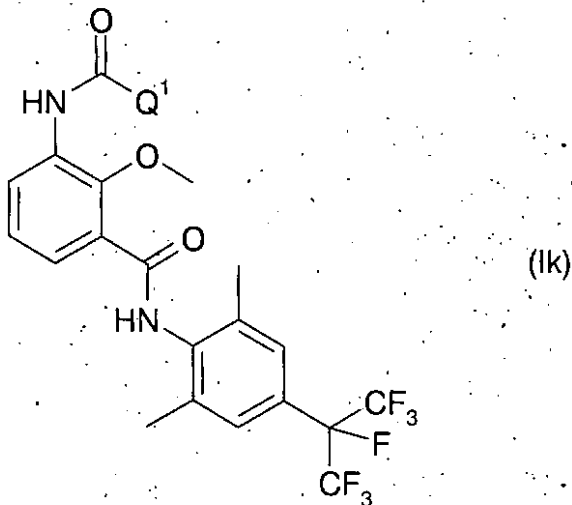
Comp. No.	Q¹	TR (min)	MH⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
I1	2-metil-4-cianofenilo			130	—
I2	2,4,6-trifluorfenilo			190	—
I3	2-fluorfenilo	4,47	705,3		2
I4	2-metilfenilo	4,3	701,3		2
I5	2-clorofenilo	4,33	721,2		2
I6	4-cianofenilo	4,18	712,3		2
I7	4-nitrofenilo	4,22	732,3		2
I8	4-metilfenilo	4,39	701,29		2
I9	4-flúor-2-metilfenilo	4,39	719,29		2
I10	5-cloro-2-fluorfenilo	4,66	739,24		2
I11	2-cloro-4-nitrofenilo	4,5	766,26		2
I12	furan-2-ilo	4,12	677,26		2
I13	4-trifluormetoxifenilo	4,55	771,28		2
I14	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	4,51	773,29		2
I15	4-trifluormetilfenilo	4,5	755,29		2
I16	2-trifluormetoxifenilo	4,54	771,28		2
I17	2-metoxifenilo	4,52	717,34		2
I18	fenilo	4,23	687,32		2
I19	4-fluorfenilo	4,24	705,32		2
I20	2-trifluormetilfenilo	4,34	755,29		2
I21	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	4,05	709,29		2
I22	2,3-difluorfenilo	4,45	723,27		2
I23	2,4-difluorfenilo	4,5	723,31		2
I24	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	4,68	773,29		2
I25	2-cloro-4-fluorfenilo	4,4	739,26	113	2

Tabla J:



Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	PF (°C)	Método de LC-MS
J1	2-cloro-4-cianofenilo			110	
J2	2,6-difluor-4-cianofenilo			113	
J3	2,4,6-trifluorfenilo			96	
J4	2-metil-4-cianofenilo			102	
J5	2-fluorfenilo	4,34	575,36		2
J6	2-metilfenilo	4,16	571,33		2
J7	2-clorofenilo	4,15	591,35		2
J8	4-cianofenilo	3,99	582,38		2
J9	4-nitrofenilo	4,07	602,36		2
J10	4-metilfenilo	4,22	571,4		2
J11	4-flúor-2-metilfenilo	4,19	589,4		2
J12	5-cloro-2-fluorfenilo	4,52	609,32		2
J13	2-cloro-4-nitrofenilo	4,23	636,31		2
J14	furan-2-ilo	3,95	547,36		2
J15	4-trifluormetoxifenilo	4,41	641,32		2
J16	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	4,4	643,33		2
J17	4-trifluormetilfenilo	4,37	625,33		2
J18	2-trifluormetoxifenilo	4,38	641,32		2
J19	2-metoxifenilo	4,37	587,38		2
J20	fenilo	4,08	557,36		2
J21	4-fluorfenilo	4,08	575,36		2
J22	2-trifluormetilfenilo	4,19	625,33		2
J23	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	3,87	579,33		2
J24	2,3-difluorfenilo	4,33	593,36		2
J25	2,4-difluorfenilo	4,34	593,36		2
J26	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	4,54	643,33		2
J27	2-cloro-4-fluorfenilo	4,23	609,29	88	2

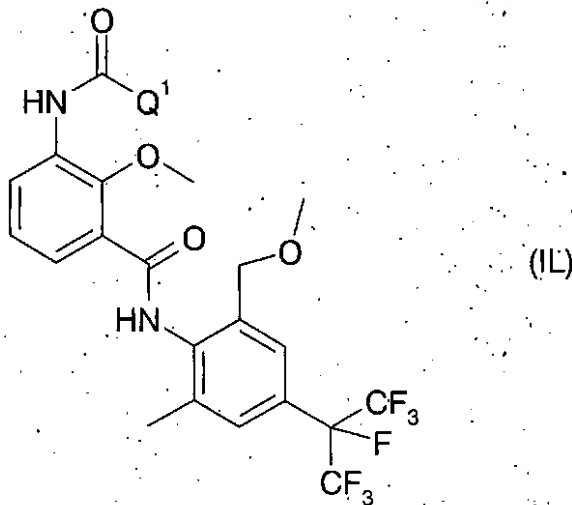
Tabla K:



Comp. No.	Q ¹	PF (°C)
K1	2,4,6-trifluorfenilo	173
K2	4-nitrofenilo	190
K3	2-cloro-4-cianofenilo	133
K4	2-metil-4-cianofenilo	152

5

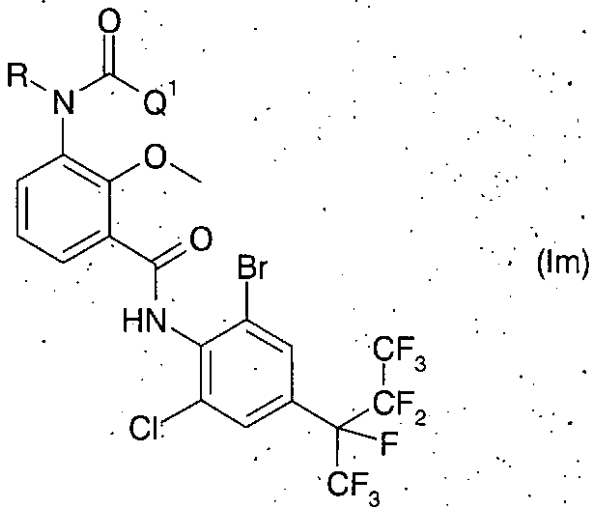
Tabla L:



Comp. No.	Q ¹	TR (min)	MH ⁺	Método de LC-MS
L1	2-fluorfenilo	4,34	639,5	2
L2	2-metilfenilo	4,2	635,53	2
L3	2-clorofenilo	4,21	655,45	2
L4	4-cianofenilo	4,01	646,52	2

L5	4-nitrofenilo	4,11	666,48	2
L6	4-metilfenilo	4,26	635,52	2
L7	4-flúor-2-metilfenilo	4,23	653,23	2
L8	5-cloro-2-fluorfenilo	4,53	673,43	2
L9	2-cloro-4-nitrofenilo	4,22	700,45	2
L10	furan-2-ilo	3,98	611,52	2
L11	4-trifluormetoxifenilo	4,43	705,51	2
L12	4-flúor-3-trifluormetilfenilo	4,4	707,51	2
L13	4-trifluormetilfenilo	4,38	689,52	2
L14	2-trifluormetoxifenilo	4,4	705,29	2
L15	2-metoxifenilo	4,41	651,52	2
L16	fenilo	4,1	621,4	2
L17	4-fluorfenilo	4,13	639,5	2
L18	2-trifluormetilfenilo	4,22	689,51	2
L19	2-cloro-4-fluorfenilo	4,25	673,48	2
L20	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo	3,93	643,46	2
L21	2,3-difluorfenilo	4,33	657,02	2
L22	2,4-difluorfenilo	4,36	657,51	2
L23	2-flúor-5-trifluormetilfenilo	4,55	707,51	2

Tabla M:



5

Comp. No.	Q ¹	R	TR (min)	MH ⁺	Método de LC-MS
M1	2-metil-4-cianofenil	Et	2,14	742	4
M2	3-metil-4-nitrofenil	Et	2,17	762	4

Ejemplos Biológicos

Estos Ejemplos ilustran las propiedades pesticidas/ insecticidas de los compuestos de la fórmula (I). Se realizaron las siguientes pruebas:

Spodoptera littoralis (gusano de las hojas del algodón egipcio):

Se colocaron discos foliares de algodón en agar en una placa microtituladora de 24 pocillos y se los roció con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm. Una vez secos, se infestaron los discos foliares con 5 larvas L1. Se controlaron las muestras para determinar la mortalidad, el comportamiento de alimentación y la regulación del crecimiento 3 días después del tratamiento (DAT).

Los siguientes compuestos produjeron un control de por lo menos 80% de *Spodoptera littoralis*: A1 a A22, B202 a B207, B188, B187, B186, B185, B159, B158, B152, B151, B150, B166, B148, B147, B146, B144, B142, B141, B139, B138, B137, B135, B134, B131, B130, B128, B127, B126, B124, B120, B117, B116, B115, B114, B113, B112, B111, B110, B109, B105, B104, B102, B101, B100, B99, B98, B97, B96, B95, B94, B93, B92, B89, B88, B87, B86, B85, B84, B82, B81, B83, B80, B77, B74, B73, B72, B71, B70, B69, B68, B67, B66, B65, B64, B62, B61, B58, B56, B55, B54, B52, B48, B45, B44, B42, B39, B37, B36, B32, B31, B30, B28, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B170, B169, B168, B167, B154, B172, B153, B180, B179, B178, B182, B184, B183, B156, B195, B194, B193, B155, B192, B191, B190, B189, B157, B198, B197, B196, B24, B23, B22, B21, B20, B19, B18, B17, B16, B15, B14, B13, B12, B11, B10, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B3, B2, B1, C1 a C15, C18 a C23, C25 a C36, D1 a D13, D15, D17, D20, D23, D22, D26 a D30, D32 a D36, D39 a D42, D44 a D49, E1 a E22, E24, E25 a E29, F1 a F9, F12, F13, F15 a F30, G1 a G5, K1 a K4, M1, M2.

Heliothis virescens (Gusano de las yemas del tabaco):

Se colocaron los huevos (0-24 h de edad) en una placa microtituladora de 24 pocillos con una dieta artificial y se los trató con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en el pocillo 18 ppm) por medio de una pipeta. Después de la incubación durante un período de 4 días, se

controlaron las muestras para detectar la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la regulación de su crecimiento.

Los siguientes compuestos dieron un control de por lo menos 80% de *Heliothis virescens*: : A1, A4, A6 a A21, B202 a B207, B188, B185, B163, B162, B161, B159, B158, B152, B151, B150, B166, B148, B146, B144, B141, B139, B138, B137, B135, B134, B131, B130, B128, B127, B126, B125, B124, B120, B117, B116, B115, B114, B113, B112, B111, B110, B109, B104, B102, B101, B100, B99, B98, B97, B96, B95, B94, B93, B89, B88, B87, B86, B85, B84, B82, B81, B83, B80, B77, B74, B73, B72, B70, B69, B68, B67, B66, B65, B64, B62, B61, B58, B56, B55, B52, B48, B45, B44, B42, B39, B36, B32, B31, B30, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B171, B170, B169, B168, B167, B172, B153, B180, B179, B178, B182, B184, B183, B156, B195, B194, B193, B155, B192, B191, B190, B189, B157, B198, B197, B23, B22, B21, B20, B19, B18, B17, B15, B13, B12, B11, B10, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B3, B2, B1, C1 a C23, C25 a C29, C31 a C35, D1 a D7, D10 a D13, D15, D16, D20, D22 a D24, D26, D28 a D30, D32, D35, D36, D39 a D42, D44 a D49, E1 a E24, E25 a E29, F1 a F9, F12, F13, F15 a F30, G1 a G5, H1, H2, H25, I1, I2, I25, J2 a J4, J27, K1 a K4, M1, M2.

Plutella xylostella (Polilla diamondback):

Se trató una placa microtituladora de 24 pocillos (MTP) que contenía una dieta artificial con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en el pocillo 18 ppm) por medio de una pipeta. Después del secado, se infestaron las MTP con larvas L2 (7-12 por pocillo). Después de un período de incubación de 6 días, se controlaron las muestras para detectar la mortalidad de las larvas y la regulación de su crecimiento.

Los siguientes compuestos dieron un control de por lo menos 80% de *Plutella xylostella*: A1, A2, A4 a A22, B202 a B207, B187, B185, B164, B163, B162, B161, B160, B159, B158, B152, B151, B150, B166, B148, B146, B144, B141, B139, B138, B137, B135, B134, B131, B130, B128, B127, B126, B125,

B124, B120, B117, B116, B115, B114, B113, B112, B111, B110, B109, B105,
 B104, B102, B101, B100, B99, B98, B97, B96, B95, B94, B93, B89, B88, B87,
 B86, B85, B84, B82, B81, B83, B80, B77, B74, B73, B72, B71, B69, B67, B66,
 B65, B64, B62, B61, B58, B57, B56, B55, B54, B52, B48, B45, B44, B42, B39,
 5 B37, B36, B32, B31, B28, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B171, B170, B169,
 B168, B154, B172, B153, B180, B179, B178, B182, B184, B183, B156, B195,
 B194, B193, B155, B192, B191, B190, B189, B198, B197, B196, B23, B22, B21,
 B20, B19, B18, B16, B15, B14, B13, B12, B11, B10, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B3,
 B2, B1, C1 a C9, C11 a C13, C15, C18 a C23, C25 a C29, C31 a C35, D1 a D13,
 10 D15, D16, D20, D22 a D24, D26 a D30, D32, D36, D39 a D42, D44 a D49, E4 a
 E22, E24, E25 a E29, F1 a F9, F11, F15 a F27, F29, F30, G1 a G5, H1, H2, H25,
 I1, I2, I25, J1 a J4, J27, K1 a K4, M1, M2.

Diabrotica balteata (Gusano de las raíces del maíz):

Se trató una placa microtituladora de 24 pocillos (MTP) que contenía una
 15 dieta artificial con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm
 (concentración en el pocillo 18 ppm) por medio de una pipeta. Después del
 secado, se infestaron las MTP con larvas L2 (6-10 por pocillo). Después de un
 período de incubación de 5 días, se controlaron las muestras para detectar la
 mortalidad de las larvas y la regulación de su crecimiento.

20 Los siguientes compuestos dieron un control de por lo menos 80% de
Diabrotica balteata: A1, A3 a A13, A15 a A20, A22, B202 a B206, B187, B185,
 B163, B162, B161, B159, B158, B151, B150, B166, B146, B144, B137, B135,
 B134, B131, B130, B128, B127, B126, B125, B120, B117, B116, B115, B113,
 B112, B111, B110, B109, B101, B100, B98, B97, B96, B93, B92, B89, B87, B86,
 25 B85, B84, B82, B81, B83, B80, B74, B73, B72, B69, B67, B66, B64, B62, B61,
 B58, B56, B55, B54, B52, B45, B44, B42, B37, B36, B32, B30, B28, B27, B26,
 B25, B174, B170, B169, B168, B167, B154, B153, B180, B179, B178, B181, B184,
 B183, B156, B194, B155, B192, B22, B21, B20, B18, B9, B5, B4, B3, C1 a C13,

D15, C19 a C23, C25 a C29, C31 a C36, D1 a D13, D15 a D17, D20 a D23, D26 a D30, D32, D36, D39, D42, D41, D44 a D49, E1 a E7, E8, E9, E11, E13, E16 a E22, E24, E25 a E29, F1, F3, F7 a F9, F12, F15 a F23, F24 a F30, G1 a G5, H2, H25, I1, I2, I25, J1 a J4, J27, K1 a K4, M2.

5 *Thrips tabaci* (Trips de la cebolla):

Se colocaron discos foliares de girasol en una placa microtituladora de 24 pocillos y se los roció con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de secarse, se infestaron los discos foliares con una población de áfidos de edades mixtas. Tras un período de incubación de 7 días, se controlaron las muestras para verificar la mortalidad.

Los siguientes compuestos otorgaron por lo menos 80% de control de *Thrips tabaci*: A2 a A13, A17 a A20, A22, B202, B204, B163, B162, B161, B151, B150, B146, B137, B135, B134, B127, B124, B115, B113, B112, B111, B110, B109, B101, B97, B93, B92, B89, B87, B82, B81, B80, B74, B73, B67, B66, B65, B64, B58, B55, B54, B52, B49, B46, B45, B44, B42, B37, B36, B28, B27, B26, B25, B175, B174, B176, B169, B168, B167, B154, B172, B153, B180, B178, B184, B183, B156, B155, B192, B191, B190, B21, B20, B9, B4, B1, C1 a C9, C11, C13, C15, C18, C19, C20 a C23, C25, C26, C29, C31, C33, D1 a D5, D9, D12, D15, D17, D20, D22, D23, D26 a D30, D32 a D36, D44 a D49, E1 a E7, E9, E11, E12, E13, E16 a E22, E25, E27 a E29, F3, F7, F8, F20, F21, F29, F30, H25, I2, I25, J27, K1, K2, M1.

Tetranychus urticae (arañuela roja común):

Se rociaron discos foliares de habas en agar en placas microtituladoras de 24 pocillos con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de secarlos, se infestaron los discos foliares con poblaciones de ácaros de edades varias. 8 días más tarde, se controlaron los discos para verificar la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la mortalidad de los adultos.

Los siguientes compuestos produjeron un control de por lo menos 80% de *Tetranychus urticae*: A2 a A7, A10, A11, A16 a A18, A22, B202, B204, B159, B158, B151, B150, B139, B138, B135, B134, B128, B127, B113, B111, B110, B109, B106, B104, B101, B98, B97, B96, B93, B82, B81, B80, B74, B73, B69, 5 B67, B66, B65, B64, B61, B55, B54, B42, B36, B28, B26, B174, B176, B171, B170, B169, B168, B154, B172, B153, B180, B179, B178, B184, B183, B156, B195, B194, B193, B155, B192, B191, B190, B189, B198, B197, B196, B23, B21, B19, B15, B13, B11, B9, B8, B7, B6, B5, B4, B2, B1, C2, C4 a C9, C11, C12, C13, C15, C19 a C23, C25, C26, C29, C33, D2 a D6, D8, D11, D13, D20, D22, D32, 10 D39, D44 a D49, E4, E5, E7, E9, E12, E13, E17, E19, E20, E24, E25, E27 a E29, F21, F18, F15, F7, F5, F1, F28, F27, F25, F24, F29, F30, G1 a G5, J2, J27, K1 a K4, M1.

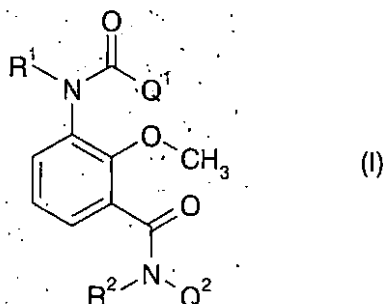
Myzus persicae (áfido verde del duraznero):

Se colocaron discos foliares de girasol en una placa microtituladora de 24 15 pocillos y se los roció con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de secarse, se infestaron los discos foliares con una población de áfidos de edades mixtas. Tras un período de incubación de 6 DAT, se controlaron las muestras para verificar la mortalidad.

Los siguientes compuestos produjeron un control de por lo menos 80% de 20 *Myzus persicae*: A3, A4, A10, A11, A13, A17, A18, A22, B204, B151, B150, B137, B124, B111, B106, B98, B93, B89, B82, B80, B66, B55, B54, B45, B44, B42, B37, B36, B28, B26, B174, B168, B153, B156, B155, B189, B19, B18, B15, B8, B7, B6, B5, B4, B2, C1, C4 a C6, C8, C18, C19, D1 a D4, D20, D21, D39, D45, D48, D49, E1, E2, E4 a E6, E9, E11, E12, E13, E16, E17, E21, E25, E27 a E29, F7, F30, G3, 25 G4, G5, H1, H25, I2, I25, J27, K2, K27.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I)



5 en la cual

Q^1 es arilo o heterociclilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R^3 , que pueden ser iguales o diferentes;

Q^2 se selecciona entre

- 2-etil-6-metil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
 10 2-bromo-6-cloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
 2,6-dicloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
 2,6-dimetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
 2-cloro-6-metoximetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo, y
 2-bromo-6-metoximetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo.

15 R^1 se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquilcarbonilo C_1-C_8 , alcoxycarbonilo C_1-C_8 y alquil $C_1-C_4-C(O)NH_2$;

R^2 se selecciona entre hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquilcarbonilo C_1-C_8 , alcoxycarbonilo C_1-C_8 y alquil $C_1-C_4-C(O)NH_2$; y

20 R^3 se selecciona entre ciano, nitro, halógeno, hidroxilo, acetoxi, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alcoxi C_1-C_4 , CN-alquilo C_1-C_4 , alquil C_1-C_4 - $C(O)O$, alquil $C_1-C_4-S(O)_2$, NH_2 , alquil C_1-C_4NH , (alquil C_1-C_4) $_2N$, (alquil C_1-C_4O) $_2P(O)O$, fenilo y un heterociclo monocíclico de cinco a seis miembros que

contiene de 1 a 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre;

o una sal agroquímicamente aceptable o los N-óxidos del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el cual Q¹ se
5 selecciona entre fenilo, bifenilo y un grupo heteroarilo monocíclico de cinco a seis miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R³, que pueden ser iguales o diferentes.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en el cual Q¹ se
10 selecciona entre fenilo, bifenilo, furanilo, piridilo, tienilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo y pirimidinilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R³, que pueden ser iguales o diferentes.

4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a
15 3, en el cual R³ se selecciona entre ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxilo, acetoxi, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoxi, etoxi, difluormetoxi, trifluormetoxi, metiltio, isopropiltio, 3-etoxi-n-propilo, metoximetilo, 2-metoxietoxi, CH₂CN, C(O)OCH₃, S(O)₂CH₃, NH₂, N(CH₃)₂, OP(O)(CH₂CH₃)₂, fenilo, N-pirroilo, tiadiazolilo y piridilo.

20 5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en el cual R³ se selecciona entre ciano, nitro, bromo, cloro, flúor, metilo, etilo, trifluormetilo, metoxi y trifluormetoxi.

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el cual tanto R¹ como R² son hidrógeno.

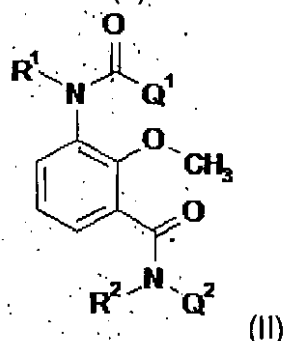
25 7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el cual Q² se selecciona entre

2-etil-6-metil-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo,

2-bromo-6-cloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo, y

2,6-dicloro-4-(nonafluor-but-2-il)fenilo.

8. Un compuesto de la fórmula (II)



en la cual.

- 5 Q¹ es como se lo define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3;
R¹ y R² son como se los define en la reivindicación 1 o la reivindicación 6;
R³ es como se lo define en cualquiera de las reivindicaciones 1, 4 o 5; y
Q² se selecciona entre los siguientes:
2-etil-6-metil-4-(perfluorisopropil)fenilo,
10 2-bromo-6-cloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dicloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dimetil-4-(perfluorisopropil)fenilo, y
2-metil-6-metoximetil-4-(perfluorisopropil)fenilo;
o una sal agroquímicamente aceptable o los N-óxidos del mismo.

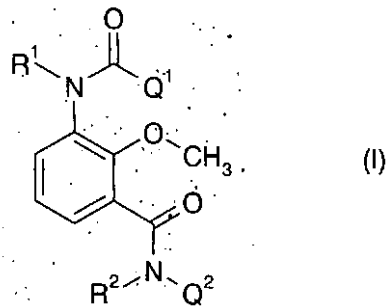
9. Un método para controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos, que comprende aplicar a una plaga, a un locus de una plaga o a una planta susceptible al ataque por una plaga, una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con lo definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8.

10. Una composición insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida, que comprende una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con lo definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 junto con un vehículo o diluyente agroquímicamente aceptable,

11. Una composición de acuerdo con la reivindicación 10, que además comprende uno o más compuestos insecticidas, acaricidas, nematocidas o molusquicidas adicionales.

RESUMEN

La presente invención se relaciona con derivados de bis-amida de la fórmula (I), con procesos e intermediarios para su preparación, con métodos para utilizarlos a fin de controlar plagas de insectos, ácaros, nematodos y moluscos y con composiciones insecticidas, acaricidas, nematicidas o molusquicidas que los comprenden.

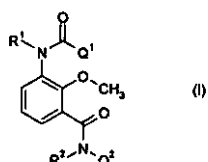


 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS			
PATENTE DE INVENCION ____ PCT <u>X</u> MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____					
(21) N° de solicitud:		(22) Fecha de solicitud:			
(51) Clasificación Internacional :					
(71) Solicitante(s) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG					
(72) Inventor(es) PETER MAIENFISCH, CHRISTOPHER RICHARD AYLES GODFREY, PIERRE JOSEPH MARCEL JUNG, OTTMAR FRANZ HUETER, PETER RENOLD					
(74) Apoderado: DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO					
(30) Prioridad	(31)	No. Prioridad	32)	Fecha	(33) País
		0907824.7		06/05/2009	GB
		10150814.1		15/01/2010	EP
(85) Fecha inicio fase nacional:				(87) Publicación internacional	
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT				Fecha: 11/11/2010	
Fecha de presentación de la solicitud: 14/04/2010				N° publicación: WO 2010/127928 A1	
No. de solicitud PCT/EP2010/054864					
(54) Título: COMPUESTOS INSECTICIDAS					

(21) N° de solicitud:					(51) Int. Cl.:	
22) Fecha de solicitud:					(71) Solicitante(s) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG	
(30) Prioridad	(31) N° Prioridad	32) Fecha	(33) Pais	(72) Inventor(es) PETER MAIENFISCH CHRISTOPHER RICHARD AYLES GODFREY PIERRE JOSEPH MARCEL JUNG Y OTROS		
	0907824.7	06/05/2009	GB	(74) Apoderado: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO		
	10150814.1	15/01/2010	EP			
(85) Fecha limite inicio fase nacional:					(87) Publicación internacional	
(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT					Fecha: 11/11/2010	
Fecha de presentación de la solicitud: 14/04/2010					N° publicación: WO 2010/127928 A1	
N° de solicitud PCT/EP2010/054864						
(54) Titulo: COMPUESTOS INSECTICIDAS						

Reivindicación(es):

1. Un compuesto de la fórmula (I)



en la cual

Q¹ es arilo o heterociclilo, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R³, que pueden ser iguales o diferentes;

Q² se selecciona entre

2-etil-6-metil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
2-bromo-6-cloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
2,6-dicloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
2,6-dimetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo,
2-cloro-6-metoximetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo, y
2-bromo-6-metoximetil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo.

R¹ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alquilcarbonilo C₁-C₈, alcoxicarbonilo C₁-C₈ y alquil C₁-C₄-C(O)NH₂;

R² se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alquilcarbonilo C₁-C₈, alcoxicarbonilo C₁-C₈ y alquil C₁-C₄-C(O)NH₂; y

R³ se selecciona entre ciano, nitro, halógeno, hidroxilo, acetoxi, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄, CN-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-C(O)O, alquil C₁-C₄-S(O)₂, NH₂, alquil C₁-C₄NH, (alquil C₁-C₄)₂N, (alquil C₁-C₄O)₂P(O)O, fenilo y un heterociclo monocíclico de cinco a seis miembros que contiene de 1 a 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre;

o una sal agroquímicamente aceptable o los N-óxidos del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el cual Q¹ se selecciona entre fenilo, bifenilo y un grupo heteroarilo monocíclico de cinco a seis miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes R³, que pueden ser iguales o diferentes.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en el cual Q¹ se selecciona entre fenilo, bifenilo, furanilo, piridilo,

tienilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, pirazolilo y pirimidinilo; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes R³, que pueden ser iguales o diferentes.

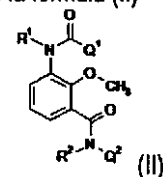
4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el cual R³ se selecciona entre ciano, nitro, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxilo, acetoxi, metilo, etilo, isopropilo, tero-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, metoxi, etoxi, difluormetoxi, trifluormetoxi, metiltio, isopropiltio, 3-etoxi-n-propilo, metoximetilo, 2-metoxietoxi, CH₂CN, C(O)OCH₃, S(O)₂CH₃, NH₂, N(CH₃)₂, OP(O)(CH₂CH₃)₂, fenilo, N-pirrolilo, tiadiazolilo y piridilo.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, en el cual R³ se selecciona entre ciano, nitro, bromo, cloro, flúor, metilo, etilo, trifluormetilo, metoxi y trifluormetoxi.

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el cual tanto R¹ como R² son hidrógeno.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el cual Q² se selecciona entre 2-etil-6-metil-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo, 2-bromo-6-cloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo, y 2,6-dicloro-4-(nonafluorbut-2-il)fenilo.

8. Un compuesto de la fórmula (II)



en la cual

Q¹ es como se lo define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3;

R¹ y R² son como se los define en la reivindicación 1 o la reivindicación 6;

R³ es como se lo define en cualquiera de las reivindicaciones 1, 4 o 5; y

Q² se selecciona entre los siguientes:

2-etil-6-metil-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2-bromo-6-cloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dicloro-4-(perfluorisopropil)fenilo,
2,6-dimetil-4-(perfluorisopropil)fenilo, y
2-metil-6-metoximetil-4-(perfluorisopropil)fenilo;

o una sal agroquímicamente aceptable o los N-óxidos del mismo. ...

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 fábrica, 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)

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
ABOGADOS COLOMBIA
NOTARIO VENTISES

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@lmpsat.net.co

XC/cm

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*

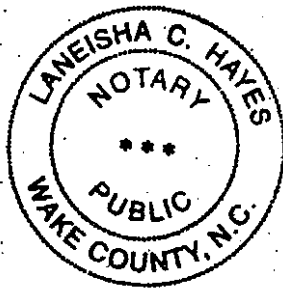
(Ciudad) REsearch Triangle Park

(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.

**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@impsal.net.co

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)

*Documents must be identified with date and origin

3/24/04 - Research Triangle
 Park, North Carolina
 27709 -
 Syngenta Biotech, Inc.

Como Notario Veintiséis del Circulo de
 Bogotá, hago constar que esta copia
 coincide con original que se ha presentado
 Bogotá D.C. Colombia.

13 NOV 2011

GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
 NOTARIO VEINTISEIS



Wake County Register of Deeds
Post Office Box 1897
Raleigh, North Carolina 27602-1897

Laura M. Riddick
Register Of Deeds

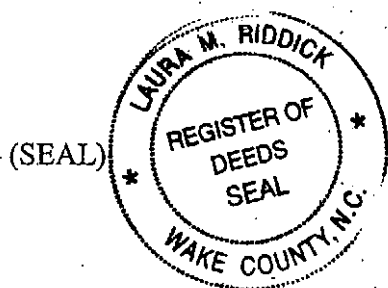
STATE OF NORTH CAROLINA

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.



REGISTER OF DEEDS

DEPUTY / ASSISTANT

Cómo Notario Veintiseis del Circulo de Bogotá, hago constar que esta copia coincide con el original que se ha presentado Bogotá D.C. Colombia.

8 NOV 2011

GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

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



Rodriguez. Medelot

Cemo/Notario Veintiseis del Circulo de
Bogotá, hago constar que esta copia
coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. - Colombia.

3 NOV 2011

GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

-----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) ilegible.

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

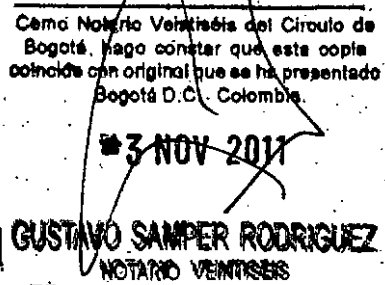
CONDADO DE WAKE

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 dars 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



DORA RUQUE DE BERNAL
 TRADUCTORA E INTÉRPRETE OFICIAL
 RES. 2755/68 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

[Handwritten signature]

Cemo Notario Venticuatro del Circulo de
Bogotá, hago constar que esta copia
coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. Colombia.

3 NOV 2011

GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VENTISEIS

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/97 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

EN BLANCO
NOTARIA VEINTISEIS

TELEXO 2:42

[Handwritten signature]

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

210997
Dora Duque
Escriba del EL
GOBIERNO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES DE ABOGADO

Come Notario Veintiseis del Circulo de
Bogotá, hago constar que esta copia
coincide con original que se ha presentado
Bogotá D.C. Colombia.

3 NOV 2011

GUSTAVO SAMPER RODRIGUEZ
NOTARIO VEINTISEIS

EN BLANCO
NOTARIA VEINTISEIS

EN BLANCO
NOTARIA VEINTISEIS

72047-WO-PCT

5/6

000160

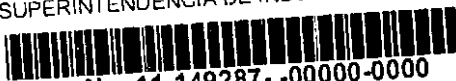
PCT REQUEST

Print Out (Original in Electronic Form)

VIII-2-1	Declaration: Entitlement to apply for and be granted a patent Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to apply for and be granted a patent (Rules 4.17(ii) and 51bis.1(a)(ii)), in a case where the declaration under Rule 4.17(iv) is not appropriate: Name (LAST, First)	In relation to this international application SYNGENTA PARTICIPATIONS AG is entitled to apply for and be granted a patent by virtue of the following:
VIII-2-1(i)		SYNGENTA PARTICIPATIONS AG is entitled as employer of the inventor, MAIENFISCH, Peter
VIII-2-1(i)		SYNGENTA PARTICIPATIONS AG is entitled as employer of the inventor, GODFREY, Christopher Richard Ayles
VIII-2-1(i)		SYNGENTA PARTICIPATIONS AG is entitled as employer of the inventor, JUNG, Pierre Joseph Marcel
VIII-2-1(i)		SYNGENTA PARTICIPATIONS AG is entitled as employer of the inventor, HUETER, Ottmar Franz
VIII-2-1(i)		SYNGENTA PARTICIPATIONS AG is entitled as employer of the inventor, RENOLD, Peter



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-149287-00000-0000

Fecha: 2011-11-03 15:22:58 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 160

CIONES

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

☒

MODELO DE UTILIDAD PCT

☐

Art. 33 Decisión 486/00
Circular Única

☒

Indicación que se solicita una PCT

☒

Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☒

Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)

☐

Dibujos de ser estos pertinentes

☒

Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)

Completa

☒

Incompleta

☐

DISEÑO INDUSTRIAL

☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐

Indicación que se solicita diseño industrial

☐

Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☐

Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño

☐

Comprobante de pago de las tasas establecidas

Completa

☐

Incompleta

☐

ESQUEMA DE TRAZADO

☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐

Indicación que se solicita un esquema de trazado

☐

Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud

☐

Representación gráfica de un esquema de trazado

☐

Comprobante de pago de las tasas establecidas

Completa

☐

Incompleta

☐