



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. 05-24189

54. TITULO FORMULACIONES VETERINARIAS QUE CONTIENEN PRODUCTOS NO
ANIMALES

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL A01K9/28, A01K9/00,
A01K9/06

71. SOLICITANTE MERIAL LIMITED

DOMICILIO Duluth, Georgia, Estados Unidos de América.

74. APODERADO EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén,

22. BOGOTA, D.C., 1-10-2005



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

1



Patente de Invención



Patente de Modelo de Utilidad



Capítulo I



Capítulo II

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: **NOVARTIS AG**

Dirección: Lichtstrasse 35, CH -4056
Basilea, Suiza

Nacionalidad o Domicilio: Basilea, Suiza.
Lugar de Constitución : Suiza

Teléfono: 41613241111 Fax: 416 13227532
E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO
(74)

Nombre: JIMENA ESCOBAR URIBE

Dirección: Cra. 11A No. 94-76 (Of. 305)

Teléfono: 6 162051/61 Fax: 6 161889
E-mail: tm-patent@escobaruribe.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39.779.452T.P 68228

4

INVENTOR (ES)
(72)

Nombre: **VER ANEXO**

Dirección:

Nacionalidad o domicilio:

Edio 3

5 **PCT (86)**

Solicitud Internacional No. PCT/EP2003/006490 Fecha 18 de junio de 2003

Publicación Internacional No. WO 03/039544 A1 Fecha 31 de diciembre de 2003

WO 2004/000793 A3 Fecha 31 de diciembre de 2003

6 **TÍTULO (54)** DERIVADOS DE ACETONITRILO ADECUADOS PARA CONTROLAR PARASITOS. *(Ver folio 117) Publicación internacional*

A61P33/14; A61P33/10

7 **Clasificación Internacional (51)**

C07C 255/29

A61K31/277; 31/343; 31/36

8 **Prioridad**

(33) País de Origen
SUIZA

(32) Fecha
19 de junio de 2002

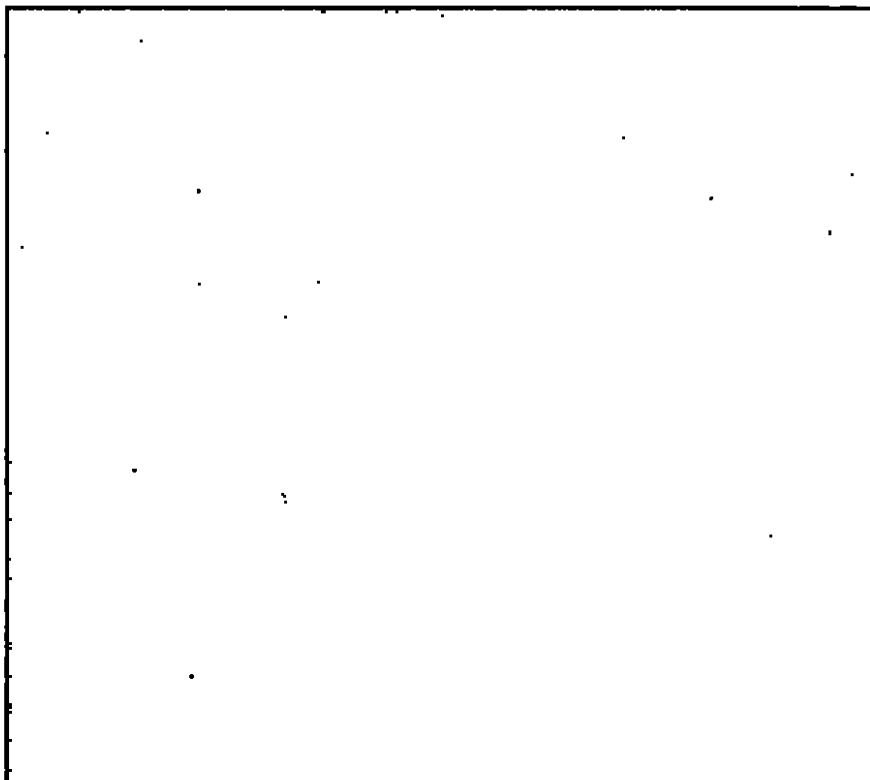
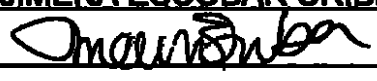
(31) Número de Solicitud
1047/02

SI ☒ NO ☐

9 **Comprobante de pago** N.º 05 - 491

Fecha Enero 4, 2005

- ☐ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona Prot. 17.398
- ☐ Poderes si fuere el caso Protocolo No. 17.398
- ☐ 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 de 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 12 X 12 .
- ☐ 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 " Opinión escrita "

11 FIGURA CARACTERÍSTICA**12 Solicito la concesión de la patente**NOMBRE: JIMENA ESCOBAR URIBEFIRMA: 

C.C. 39.779.452 DE Usaquén T.P. 68.228

As. 2769/PCT

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 05003903 00000000 Folios: 133
Fecha (HH): 2003-01-19 16:25:33
Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE INCI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 491
FECHA : ENERO 4 DE 2003

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	35848553	03/01/2003	9,441,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50003-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	443,000.00
	TOTAL :	\$ 443,000.

SOM: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ANEXOS**INVENTORES****1.)****DUCRAY, Pierre****(8, rue des alliés, F-68128 Village-Neuf, Francia);****2.)****GOEBEL, Thomas****(Lettenweg 28B, 79539 Lörrach, Alemania).**

4

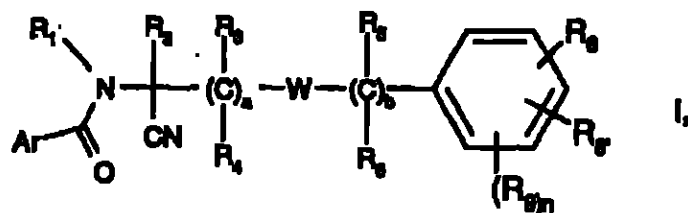
Solicito expresamente a nombre de la sociedad **NOVARTIS AG**, sociedad constituida de conformidad con las leyes de Suiza, domiciliada en Lichtstrasse 35, CH-4056 Basilea, Suiza, el otorgamiento de Patente para la invención titulada "**DERIVADOS DE ACETONITRILO ADECUADOS PARA CONTROLAR PARASITOS**".

Clase: C07C 255/29


JIMENA ESCOBAR URIBE
C.C. 39.779.452 de Usaquen.
T.P. 68.228

DERIVADOS DE ACETONITRILLO ADECUADOS PARA CONTR LAR
PARASITOS

La presente invención se refiere a nuevos compuestos de
5 acetonitrilo de la fórmula general



10 en donde:

Ar significa arilo o hetarilo, el cual es no sustituido o
sustituido una o muchas veces, por lo cual los substituyentes
pueden ser independientes uno del otro y se seleccionan del grupo
que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de
15 carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6
átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono,
alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6
átomos de carbono, alquinilo 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo
de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de
20 carbono, cicloalquilamino de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiltio
de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono,
halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6
átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono,
alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfoniloxi de
25 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono,

halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonylo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonylo de 1 a 6 átomos de carbono, alquensultio de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquensultio de 2 a 6 átomos de carbono, alquensulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquensulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquensulfonylo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquensulfonylo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonylamino de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonylamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenilamino es cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonylo el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenilmetoximino el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces; fenilhidroximetilo el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenilclorometilo el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenilcianometilo el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenilo el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenoxi el cual está no sustituido o sustituido una o

muchas veces, fenilacetilenilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces y piridiloxi el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se
5 seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6
10 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono y di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o alcoximetilo de 1 a 6
15 átomos de carbono;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, son ya sea, independientemente uno del otro, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquenilo
20 de 2 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser
25 independientes uno del otro y se seleccionan del grupo que consiste

de halógeno, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, o di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono;

o R_2 y R_3 juntos significan alquileno de 2 a 6 átomos de carbono;

R_7 significa hidrógeno o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

cualquier R_8 significa fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxycarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, benciloxycarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenil-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi-alquilo

de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenil-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, hetariloxicarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquilcarboxi de 1 a 6 átomos de carbono; fenilcarboxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, bencilcarboxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarboxamido el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquilcarboxamido de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarboxamido de 1 a 6 átomos de carbono; feniloxicarboxamido el cual está substituido o no substituido una o muchas veces, fenilaminocarboxi el cual está substituido o no substituido una o muchas veces, feniloxicarboxi el cual está substituido o no una o muchas veces, fenilaminocarboxamido el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono-alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono, hidroxí-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, (alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)₂aminocarbonilo; fenilaminocarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, feniltio-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilmetoxiimino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,

fenilhidroximetilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilclorometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o
5 fenilcianometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R₆; y R₆ significa hidrógeno;

o R₆ y R₆ juntos significan alquileo de 1 a 4 átomos de
10 carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces a través de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, siempre que uno o dos átomos de carbono pueden ser reemplazados por oxígeno;

R₆ significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6
15 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alqueno de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueno de 2 a 6 átomos de carbono, alquino de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilamino de 3 a 6 átomos de carbono,
20 cicloalquiltio de 3 a 6 átomos de carbono, alquenoiloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenoiloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6
25 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono,

alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenilamino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilmetoxilimino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces; fenilhidroximetilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilclorometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcianometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, feniltio el cual está substituido o no substituido una vez o muchas

veces, fenilacetilenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces o piridiloxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo
5 que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-
10 alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, y halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono;

W significa O, S, S(O)₂ o N(R₇);

a significa 1, 2, 3, o 4;

15 b significa 0, 1, 2, 3, o 4; y

n es 0, 1, 2, o 3;

su preparación y uso en el control de endo- y ectoparásitos, especialmente helmintos, en y sobre ganado productivo de sangre caliente y animales y plantas domésticas, y además pesticidas que
20 contienen por lo menos uno de estos compuestos.

Los compuestos de aminoacetonitrilo substituidos que tienen actividad pesticida se describen por ejemplo en EP-0,965,565 A2. Sin embargo, los ingredientes activos específicamente descritos ahí no siempre pueden cumplir con los requerimientos respecto al
25 espectro de potencia y de actividad. Por lo tanto existe una

necesidad de ingredientes activos con propiedades pesticidas mejoradas. Ahora se ha encontrado que los compuestos de aminoacetonitrilo de la fórmula I tienen excelentes propiedades pesticidas, especialmente contra endo- y ectoparásitos en y sobre
5 ganado productivo y animales y plantas domésticas.

Arilo es fenilo o naftilo.

Hetarilo - es piridilo, pirimidilo, s-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, tienilo, furanilo, pirrilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, triazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, benzotienilo, benzofuranilo,
10 benzotiazolilo, indolilo o indazolilo, preferiblemente piridilo, pirimidilo, s-triazinilo o 1,2,4-triazinilo, especialmente piridilo o pirimidilo.

Alquilo - es un grupo *per se* y como elemento estructural de otros grupos y compuestos, por ejemplo halógeno-alquilo, alcoxi, y
15 alquiltio es, en cada caso con debida consideración del número específico de átomos de carbono en el grupo o compuesto en cuestión, cualquiera de cadena recta, es decir, metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo o hexilo, o ramificado, por ejemplo isopropilo, isobutilo, sec-butilo, ter-butilo, isopentilo, neopentilo o isohexilo.

20 Alquenilo - es un grupo *per se* y como elemento estructural de otros grupos y compuestos, por ejemplo haloalquenilo, alqueniloxi, o alqueniltio - es, en cada caso con debida consideración del número específico de átomos de carbono en el grupo o compuesto en cuestión y de los enlaces dobles conjugados o aislados- cualquier
25 agente de cadena recta, por ejemplo, alilo, 2-butenilo, 3-pentenilo,

1-hexenilo, o 1,3-hexadienilo, o ramificados, por ejemplo, isopropenilo, isobutenilo, isopropenilo, ter-pentenilo o isohexenilo.

Alquinilo – como un grupo *per se* y como elemento estructural de otros grupos y compuestos – es, en cada caso con debida
5 consideración del número específico de átomos de carbono en el grupo o compuesto en cuestión y de los enlaces dobles conjugados o aislados, ya sea de cadena recta, por ejemplo, propargilo, 2-butinilo, 3-pentinilo, 1-hexinilo, 1-heptinilo o 3-hexen-1-inilo, o ramificado por ejemplo, 3-metilbut-1-inilo, 4-etilpent-1-inilo o 4-metilhex-2-inilo.

10 Cicloalquilo - como un grupo *per se* y como elemento estructural de otros grupos y compuestos tales como cicloalcoxi, cicloalquilamino, o cicloalquiltio, -es en cada caso con debida consideración del número específico de átomos de carbono en el grupo o compuesto en cuestión ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo
15 o ciclohexilo.

Halógeno - como un grupo *per se* y como elemento estructural de otros grupos y compuestos tales como haloalquilo, haloalcoxi, y haloalquiltio, es flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente flúor, cloro o bromo, en particular flúor o cloro.

20 Grupos y compuestos que contienen carbono substituido por halógeno, tales como haloalquilo, haloalcoxi, y haloalquiltio, puede ser parcialmente halogenado o perhalogenado, siempre que en el caso de halogenación múltiple, los substituyentes del halógeno puedan ser idénticos o diferentes. Ejemplos de halógeno-alquilo –
25 como un grupo *per se* y como elemento estructural de otros grupos y

compuestos tales como haloalcoxi y haloalquiltio, -son metilo el cual es mono- a trisustituido por flúor, cloro y/o bromo, tal como CHF_2 o CF_3 ; etilo el cual es mono- a pentasustituido por flúor, cloro y/o bromo, tales como CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 ,
5 CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF o CClFCHClF ; propilo o isopropilo, mono- a heptasustituido por flúor, cloro y/o bromo, tales como $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{CF}_3$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ o $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; butilo o uno de sus isómeros, mono- a nonasustituido por flúor, cloro y/o bromo, tales como $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCH}_2\text{CF}_3$ o $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$; pentilo o uno de
10 sus isómeros sustituido de una a once veces por flúor, cloro y/o bromo, tales como $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ o $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$; y hexilo o pentilo o uno de sus isómeros sustituido de una a trece veces por flúor, cloro y/o bromo, tales como $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ o $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$.

15 Los grupos alcoxi tienen una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Alcoxi es por ejemplo metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi y ter-butoxi, así como los isómeros de pentiloxi y hexiloxi; preferiblemente metoxi y etoxi. Los grupos Haloalcoxi preferiblemente tienen una longitud de cadena de
20 1 a 6 átomos de carbono. Haloalcoxi es por ejemplo fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2,2-difluoroetoxi y 2,2,2-tricloroetoxi; preferiblemente difluorometoxi, 2-cloroetoxi y trifluorometoxi.

25 Los grupos alquiltio preferiblemente tienen una longitud de

cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Alquiltio es por ejemplo, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio o ter-butiltio, preferiblemente metiltio y etiltio.

Las modalidades preferidas dentro del alcance de la invención
5 son:

(1) Un compuesto de la fórmula I, en donde Ar significa arilo o
hetarilo los cuales están substituidos o no substituidos una vez o
muchas veces, en donde lo substituyentes, independientes uno del
otro, se seleccionan del grupo que consiste de halógeno, nitro,
10 ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6
átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi
de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono,
halo-alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo 2 a 6 átomos de
carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3
15 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono,
halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6
átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono,
alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilamino el cual está
substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarbonilo
20 el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas
veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o
muchas veces, y piridiloxi el cual está substituido o no substituido
una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser
25 independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste

de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-
alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de
carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono;

Especialmente arilo el cual está substituido o no substituido
5 una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser
independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-
alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de
carbono, halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a
10 5 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono,
alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1
a 4 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono;
fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o
muchas veces y fenoxi el cual está substituido o no substituido una
15 vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser
independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-
alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de
carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

20 En particular, fenilo que está ya sea substituido o no
substituido una o muchas veces, siempre que los substituyentes
puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo
que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-
alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de
25 carbono, halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; y fenilcarbonilo el

cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

(2) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_1 es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, especialmente hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

más particularmente hidrógeno;

(3) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , y R_6 , son, independientemente uno del otro, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser

independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

- 5 especialmente, independientemente uno del otro, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
- 10 de halógeno, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
- 15 de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

particularmente, independientemente uno del otro, hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces siempre que los substituyentes

20 puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

(4) Un compuesto de la fórmula I, en donde R₇ significa hidrógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

- 25 especialmente hidrógeno;

(5) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_1 significa alquilcarboxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi-aquilo de 1 a 6 átomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenil-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_1 , y R_2 signifiquen hidrógeno;

o R_1 y R_2 juntos significan alquilenos de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces por alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, siempre que uno o dos átomos de carbono puedan ser reemplazados por oxígeno;

especialmente, cualquier R_1 significa alquilcarboxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; fenil-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_1 ; y R_2 significa hidrógeno;

puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono;

- 5 especialmente halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, o alcóxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

- más particularmente halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono o halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

- 15 (7) Un compuesto de la fórmula I, en donde W es O o S; especialmente O;
- (8) Un compuesto de la fórmula I, en donde a es 1, 2, o 3; especialmente 1 o 2;
- 20 particularmente 1;
- (9) Un compuesto de la fórmula I, en donde b es 0, 1, 2, o 3; especialmente 0, 1, o 2; particularmente 0;
- (10) Un compuesto de la fórmula I, en donde n es 0 o 1;
- 25 especialmente 0;

(11) Un compuesto de la fórmula I, en donde Ar significa arilo o hetarilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilamino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, y piridiloxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, independientemente uno del otro significan

hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono el cual está
sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, alcoxi de 1 a 4
átomos de carbono, siempre que los sustituyentes puedan ser
independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
5 de halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a
4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono el cual
está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, siempre
que los sustituyentes puedan ser independientes uno del otro y se
seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 4
10 átomos de carbono; o fenilo el cual está sustituido o no sustituido
una vez o muchas veces, siempre que los sustituyentes puedan ser
independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-
alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de
15 carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

R₇ significa hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

cualquier R₈ significa alquilcarboxi de 1 a 6 átomos de carbono,
alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono-alquiloxi de 1 a 6 átomos de
carbono, hidroxialquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a
20 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de
1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenil-
alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, el cual está sustituido o no
sustituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 6 átomos
de carbono el cual está sustituido o no sustituido una vez o
25 muchas veces, siempre que los sustituyentes puedan ser

31
26

independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_6 ; y R_6 significa hidrógeno;

o R_6 y R_6 juntos significan alquileo de 1 a 4 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces por alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, siempre que uno o dos átomos de carbono puedan ser reemplazados por oxígeno;

R_6 significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilamino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono.

W es O o S;

a significa 1, 2, o 3;

b significa 0, 1, 2, o 3; y

25 n es 0 o 1;

(12) Un compuesto de la fórmula I, en donde Ar significa arilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono; fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, y fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, independientemente uno del otro significan hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; o

fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

R_7 significa hidrógeno;

cualquier R_8 significa alquilcarboxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; fenil-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces R_9 ; y R_{10} significa hidrógeno;

o R_8 y R_{10} juntos significan alquilleno de 1 a 3 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces por metilo, siempre que uno o dos átomos de carbono puedan ser reemplazados por oxígeno;

R_9 significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono o alcóxicarbonilo de

1 a 4 átomos de carbono;

W significa O;

a significa 1 o 2;

b significa 0, 1, o 2; y

5 n significa 0;

(13) Un compuesto de la fórmula I, en donde Ar significa fenilo que está ya sea no sustituido o sustituido una o más veces, siempre que los sustituyentes sean independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 2
10 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; fenilcarbonilo el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, siempre que los sustituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
15 de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, independientemente uno del otro significan
20 hidrógeno, o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, siempre que los sustituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

25 R₇ significa hidrógeno;

R₁ significa alquiloxi de 1 a 2 átomos de carbono-alquiloxi de 1 a 2 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 2 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; fenil-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o
5 fenil-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R₁;

R₂ significa hidrógeno;

10 **R₃** significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono o halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

W significa O;

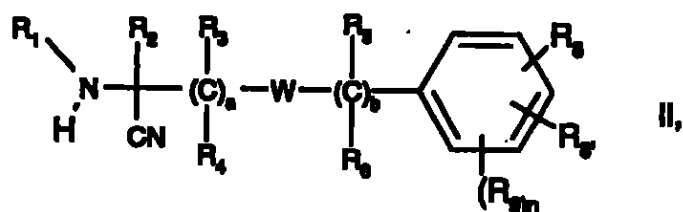
a significa 1;

15 **b** significa 0; y

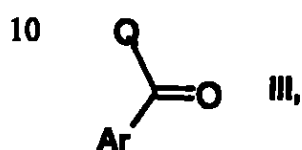
n es 0.

Dentro del contexto de la invención, se da preferencia particular a los compuestos de la fórmula I listados en el Cuadro 1, y más particularmente a aquellos nombrados en los ejemplos de
20 síntesis.

Un objeto adicional de la invención es el procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I, respectivamente en forma libre o en la forma de sal, por ejemplo caracterizado en que un compuesto de la fórmula I



5 el cual es conocido o puede ser producido analógicamente a los compuestos correspondientes conocidos, y en donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} , R_{12} , R_{13} , R_{14} , R_{15} , R_{16} , R_{17} , R_{18} , R_{19} , R_{20} , R_{21} , R_{22} , R_{23} , R_{24} , R_{25} , R_{26} , R_{27} , R_{28} , R_{29} , R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} , R_{34} , R_{35} , R_{36} , R_{37} , R_{38} , R_{39} , R_{40} , R_{41} , R_{42} , R_{43} , R_{44} , R_{45} , R_{46} , R_{47} , R_{48} , R_{49} , R_{50} , R_{51} , R_{52} , R_{53} , R_{54} , R_{55} , R_{56} , R_{57} , R_{58} , R_{59} , R_{60} , R_{61} , R_{62} , R_{63} , R_{64} , R_{65} , R_{66} , R_{67} , R_{68} , R_{69} , R_{70} , R_{71} , R_{72} , R_{73} , R_{74} , R_{75} , R_{76} , R_{77} , R_{78} , R_{79} , R_{80} , R_{81} , R_{82} , R_{83} , R_{84} , R_{85} , R_{86} , R_{87} , R_{88} , R_{89} , R_{90} , R_{91} , R_{92} , R_{93} , R_{94} , R_{95} , R_{96} , R_{97} , R_{98} , R_{99} , R_{100} , W , a , b , y n se definen como se dan para la fórmula I, se hacen reaccionar con un compuesto de la fórmula correspondiente



el cual es conocido o puede ser preparado analógicamente a lo compuestos conocidos correspondientes, y en donde Ar se define como se da para la fórmula I y Q es un grupo saliente, opcionalmente en presencia de un catalizador básico y si se desea, un compuesto de la fórmula I que se puede obtener de acuerdo con el método y en otra forma, respectivamente en forma libre o forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula I, una mezcla de isómeros que se pueden obtener de acuerdo con el método se separan y el isómero deseado aislado y/o un compuesto libre de la fórmula I que se obtiene de acuerdo con el método se convierte en una sal o una sal de un compuesto de la fórmula I que se obtiene de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula I o en otra sal.

15

20

25

Lo que se ha declarado anteriormente para sales de los compuestos I también se aplica analógicamente a sales de materiales de partida listados aquí anteriormente y a continuación.

Los patrones de reacción pueden hacerse reaccionar uno con el otro como están, es decir, sin la adición de un solvente o diluyente, por ejemplo, en la fusión en la mayoría de los casos, sin embargo, la adición de un solvente o diluyente inerte, o una mezcla de los mismos, es ventajoso. Ejemplos de dichos solventes o diluyentes son: hidrocarburos aromáticos, alifáticos y alicíclicos e hidrocarburos halogenados, tales como benceno, tolueno, xileno, mesitileno, tetralina, clorobenceno, diclorobenceno, bromobenceno, éter de petróleo, hexana, ciclohexana, diclorometano, triclorometano, tetraclorometano, dicloroetano, tricloroetano, tetracloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter dipropílico, éter diisopropílico, éter dibutílico, éter metil tert-butílico, éter etileno glicol monometílico, éter etileno glicol monoetilico, éter etileno glicol dimetílico, éter dimetoxidietílico, tetrahidrofurano o dioxano; cetonas tales como acetona, metil etil cetona o metil isobutil cetona; amidas tales como N, N-dimetilformamida, N,N-dietil-formamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona o triamida de ácido hexametilfosfórico; nitrilos tales como acetonitrilo o propionitrilo; y sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo.

Los grupos salientes preferidos son los halógenos, especialmente cloro.

Las bases adecuadas para facilitar la reacción son por ejemplo,

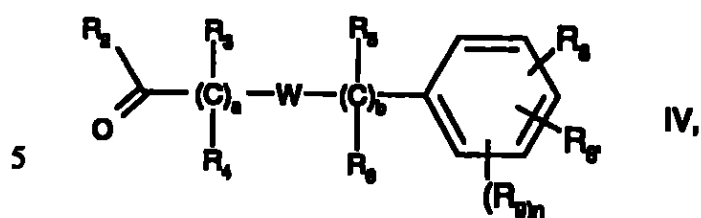
hidróxidos, hidruros, amidas, alcanolatos, acetatos, carbonatos, dialquilamidas o alquilsililamidas de metal alcalino o de metales térreos alcalinos; alquilaminas, alquilenodiaminas, opcionalmente N-alquiladas, opcionalmente insaturadas, cicloalquilaminas, 5 heterociclos básicos, hidróxidos de amonio, así como aminas carbocíclicas. Aquellas que pueden ser mencionadas a manera de ejemplo son hidróxido, hidruro, amida, metanolato, acetato, carbonato de sodio, ter-butanolato, hidróxido, carbonato, hidruro de potasio, diisopropilamida de litio, bis(trimetiletilsilil)-amida de 10 potasio, hidruro de calcio, trietilamina, diisopropiletilamina, trietilenodiamina, N-ciclohexil-N,N-dimetil-amina, N-N-dietilanilina, piridina, 4-(N,N-dimetilamino)piridina, quinuclidina, N-Metil-morfolina, Hidróxido de benciltrimetilamonio, así como 1,5-diazabicyclo[5.4.0]undec-5-ene (DBU). Se da preferencia a 15 diisopropiletilamina y 4-(N,N-dimetilamino)piridina.

La reacción ventajosamente toma lugar en un rango de temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 100°C, preferiblemente de aproximadamente 10°C a aproximadamente 40°C.

En un procedimiento preferido, un compuesto de la fórmula II 20 se hace reaccionar a temperatura ambiente en un hidrocarburo halogenado, preferiblemente diclorometano, con un compuesto de la fórmula III en presencia de una base, preferiblemente una mezcla de diisopropiletilamina y 4-(N,N-dimetilamino)piridina.

Un objeto adicional de la invención es el procedimiento para la 25 preparación de los compuestos de la fórmula II, respectivamente en

forma libre o en forma de sal, por ejemplo caracterizados en que un compuesto de la fórmula



el cual es conocido o puede ser producido analógicamente a los compuestos correspondientes conocidos, y en donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , W , a , b , y n se definen como en la fórmula I, se hacen reaccionar con un cianuro inorgánico u orgánico y con un compuesto de la fórmula R_9-NH_2 el cual es conocido o puede ser producido analógicamente a compuestos conocidos correspondientes y en donde R_9 se define como para la fórmula I, y si se desea, un compuesto de la fórmula II que se puede obtener de acuerdo con el método o en otra forma, respectivamente en forma libre o en la forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula II, una mezcla de isómeros que se obtienen de acuerdo con el método se separan y el isómero deseado se aísla y/o una forma libre del compuesto de la fórmula II se obtiene de acuerdo con el método se convierte en una sal o una sal de un compuesto de la fórmula II que se obtiene de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula II o en otra sal.

Los cianuros adecuados son cianuro de sodio, cianuro de potasio, cianuro de trimetilsililo y cianohidrina de acetona.

El método general para hacer reaccionar los compuestos

carbonilo, por ejemplo, de la fórmula IV, con cianuros y aminas, por ejemplo, de la fórmula R_6-NH_2 , es una reacción Strecker, por ejemplo como en Organic Synthesis Coll. Vol. 3. 88 (1973).

Las sales de los compuestos I pueden ser producidas en una forma conocida. Las sales de adición de ácido de los compuestos I, por ejemplo, se obtienen a través del tratamiento con un ácido adecuado o reactivo de intercambio de ión adecuado, y las sales con bases se obtienen a través del tratamiento con una base adecuada o un reactivo de intercambio de ión adecuado.

Las sales de los compuestos I pueden ser convertidas en compuestos libres I a través de medios usuales, sales de adición de ácido, por ejemplo, a través del tratamiento con una composición básica adecuada o con un reactivo de intercambio de ión adecuado, y sales con bases, por ejemplo, tratándolas con un ácido adecuado o un reactivo de intercambio de ión adecuado.

Las sales de los compuestos I pueden ser convertidas en otras sales de los compuestos I en una forma conocida; las sales de adición de ácido pueden ser convertidas por ejemplo en otras sales de adición de ácido, por ejemplo, a través del tratamiento de una sal de un ácido inorgánico, tal como un clorhidrato, con una sal de metal adecuada, tal como una sal de sodio, de bario o de plata, de un ácido, por ejemplo, con acetato de plata, en un solvente adecuado, en el cual una sal inorgánica resultante, por ejemplo, cloruro de plata, es insoluble y de esta forma se precipita de la mezcla de reacción.

Dependiendo del método y/o condiciones de reacción, los compuestos I con características formadoras de sal pueden ser obtenidos en forma libre o en la forma de sales.

Los compuestos I también pueden ser obtenidos en la forma de sus hidratos y/o también pueden incluir otros solventes, utilizados por ejemplo en donde sean necesarios para la cristalización de compuestos presentes en forma sólida.

Los compuestos I pueden estar opcionalmente presentes como isómeros ópticos y/o geométricos o como una mezcla de los mismos.

10 La invención se refiere a ambos, los isómeros puros y todas las mezclas isoméricas posibles y se entiende como se mencionó anteriormente y se menciona a continuación que hacen eso, aún si los detalles estereoquímicos no se mencionan específicamente en cada caso.

15 Las mezclas diaestereoisoméricas de los compuestos I, las cuales se obtienen a través del procedimiento o en otra forma pueden ser separadas en una forma conocida, o en la bases de diferencias físico-químicas de sus componentes, en diaestereoisómeros puros, por ejemplo, a través de cristalización

20 fraccional, destilación y/o cromatografía.

La división las mezclas de enantiómeros, que se obtienen por consiguiente, en los isómeros puros, puede lograrse a través de métodos conocidos, por ejemplo, a través de la recrystalización de un solvente ópticamente activo, a través de cromatografía en

25 adsorbentes quirales, por ejemplo, cromatografía de líquidos a alta

presión (HPLC) en acetil celulosa, con la asistencia del microorganismo apropiado, a través de división con enzimas inmovilizadas específicas, a través de la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo, utilizando éteres de corona quirales, siempre
5 que solamente un enantiómero sea formado en complejo.

De acuerdo con la invención, aparte de la separación de las mezclas de isómeros correspondientes, los métodos generalmente conocidos de síntesis diaestereoselectiva o enantioselectiva también se pueden aplicar para obtener diaestereoisómeros o enantiómeros
10 puros, por ejemplo, llevando a cabo el método de la invención utilizando resultados con la stereoquímica adecuada correspondientemente.

Es ventajoso aislar o sintetizar el isómero biológicamente más activo, por ejemplo, el enantiómero, siempre que los componentes
15 individuales tengan una eficacia biológica diferente.

En el método de la presente invención, los materiales de partida y los intermediarios utilizados son preferiblemente aquellos que dirigen a los compuestos I descritos en el inicio como siendo especialmente útiles.

20 La invención se refiere especialmente al método para la preparación descrita en el ejemplo. Los materiales de partida y los intermediarios, los cuales son nuevos y se utilizan de acuerdo con la invención para la preparación de compuestos I, así como su uso y procedimiento para la preparación de los mismos, similarmente forma
25 un objeto de la invención.

Los compuestos I de acuerdo con la invención son notables por su particularmente amplio espectro de actividad y son ingredientes activos valiosos para uso en control de plagas, incluyendo en particular endo- y ectoparásitos en animales, mientras que son bien tolerados por animales de sangre caliente, peces y plantas.

En el contexto de la presente invención, se entiende como ectoparásito como siendo insectos, ácaros y garrapatas en particular. Estos incluyen insectos en el orden de: *Lepidóptera*, *Coleóptera*, *Homóptera*, *Heteróptera*, *Díptera*, *Thisanóptera*, *Ortóptera*, *Anoplura*, *Sifonáptera*, *Malófaga*, *Tisanura*, *Isóptera*, *Psocóptera* y *Himenóptera*. Sin embargo, los ectoparásitos que pueden ser mencionados en particular son aquellos que le dan problemas a los seres humanos o animales y llevan patógenos, por ejemplo moscas, tales como la *Musca doméstica*, *Musca vetustissima*, *Musca autumnalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcófaga carnaria*, *Lucilia cuprina*, *Hipoderma bovis*, *Hipoderma lineatum*, *Crisomia cloropiga*, *Dermatobia hominis*, *Cochliomyia hominivorax*, *Gasterófilus intestinalis*, *Oestrus ovis*, *Stomoxys calcitrans*, *Haematobia irritans* y mosquitos pequeños (Nematóceras), tales como *Culicidae*, *Simuliidae*, *Psicodidae*, pero también parásitos chupadores de sangre, por ejemplo pulgas, tales como *Ctenocephalides felis* y *Ctenocephalides canis* (pulgas de gato y perro), *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Dermatophilus penetrans*, piojos, tales como *Damalina ovis*, *Pediculus humans*, moscas mordedoras y moscas de caballo (*Tabanidae*), *Haematopota spp.* Tales como

Haematopota pluvialis, *Tabanidea* spp. Tales como *Tabanus nigrovittatus*, *Chrysopsinae* spp. Tales como *Chrysopscaecutiens*, moscas tse-tsé, tales como las especies de *Glossinia*, insectos mordedores, particularmente cucarachas, tales como *Blatella*
5 *germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, ácaros, tales como *Dermanyssus gallinae*, *Sarcoptes scabiei*, *Psoroptes ovis* y *Psorergates* spp. y por último pero no menos importante garrapatas. El último mencionado pertenece al orden de la *Acarina*. Los representantes conocidos de las garrapatas con, por ejemplo,
10 *Boophilus*, *Amblyomma*, *Anocentor*, *Dermacentor*, *Haemaphysalis*, *Hyalomma*, *Ixodes*, *Rhipicentor*, *Margaropus*, *Rhipicephalus*, *Argas*, *Otobius* y *Ornithodoros* y similares, los cuales preferiblemente infestan animales de sangre caliente incluyendo animales de granja, tales como ganado, cerdos, y cabras, aves tales como pollos, gallos,
15 y gansos, animales con piel tales como visón, zorros, chinchillas, conejos y similares, así como animales domésticos tales como gatos y perros, pero también seres humanos.

Los compuestos I también pueden ser utilizados contra pestes de higiene, especialmente del orden de los *Dípteros* de las familias,
20 *Sarcophagidae*, *Anophilidae* y *Culicidae*; los órdenes de *Ortóptera*, *Dictióptera* (por ejemplo, la familia *Blattidae*) e *Himenóptera* (por ejemplo, la familia *Formicidae*).

Los compuestos I también tienen una eficacia adecuada en ácaros parásitos e insectos de plantas. En el caso de ácaros de
25 araña del orden de la *Acarina*, son efectivos contra huevos, ninfas, y

adultos de *Tetranychidae* (*Tetranychus spp.* y *Panonychus spp.*).

Estos tienen una actividad fuerte contra insectos succionadores del orden *Homóptera*, especialmente contra pestes de las familias, *Aphididae*, *Delphacidae*, *Cicadellidae*, *Psyllidae*, *Loccidae*,
5 *Diaspididae* y *Eriophyidae* (por ejemplo, ácaro de corrosión o frutas de cítricos); los órdenes de *Hemiptera*, *Heteóptera* y *Thysanóptera* y en los insectos comedores de plantas de los órdenes *Lepidóptera*, *Coleóptera*, *Diptera* y *Ortóptera*.

Son similarmente adecuados como un insecticida sólido contra
10 pestes en el suelo.

Los compuesto de la fórmula I son por lo tanto efectivos contra todas las etapas del desarrollo de insectos succionadores e insectos consumidores en cosechas tales como cereales, algodón, arroz, maíz, soya, papas, vegetales, fruta, tabaco, cítricos, aguacates y
15 otras cosechas.

Los compuestos de la fórmula I también son efectivos contra nematodos de planta de las especies *Meloidogyne*, *Heterodera*, *Pratylenchus*, *Ditylenchus*, *Radopholus*, *Rizoglyphus*, etc.

En particular, los compuestos son efectivos contra helmintos,
20 en los cuales los nematodos endoparasíticos y trematodos pueden ser la causa de serias enfermedades de mamíferos y aves, por ejemplo, ovejas, cerdos, cabras, ganado, caballos, burros, perros, gatos, conejillos de india y pájaros exóticos. Los nematodos típicos de esta indicación son: *Haemonchus*, *Trichostrongylus*, *Ostertagia*,
25 *Nematodirus*, *Cooperia*, *Ascaris*, *Bunostonum*, *Oesophagostonum*,

Charbertia, *Trichuris*, *Strongylus*, *Trichonema*, *Dictyocaulus*, *Capillaria*, *Heterakis*, *Toxocara*, *Ascaridia*, *Oxyuris*, *Ancylostoma*, *Uncinaria*, *Toxascaris* y *Parascaris*. Los trematodos incluyen, en particular, la familia *Fasciolidae*, especialmente *Fasciola hepática*.

- 5 También se puede mostrar sorprendentemente e inesperadamente que los compuestos de la fórmula I tienen una eficacia excepcionalmente alta contra nematodos que son resistentes a muchas sustancias activas. Esto se puede demostrar *in vitro* a través de la prueba LDA e *in vivo* por ejemplo en gerbos de Mongolia
10 y ovejas. Esto demostró que las cantidades de la sustancia activa aniquilarán cepas sensibles de *Haemonchus contorts* o *Trichostrongylus colubriformis*, también son suficientemente efectivas en el control de cepas correspondientes que son resistentes a benciimidazoles, levamisol y lactosas macrocíclicas
15 (por ejemplo, ivermectina).

- Ciertas pestes de las especies *Nematodirus*, *Cooperia* y *Oesophagostomum* infestan el tracto intestinal del animal huésped, mientras que otras de las especies *Haemonchus* y *Ostertagia* son parasíticas en el estómago y aquellas de las especies *Dictyocaulus*
20 son parasíticas en el tejido del pulmón. Los parásitos de las familias *Filaridae* y *Setaridae* se pueden encontrar en el tejido de la célula interna y en los órganos, por ejemplo, el corazón, los vasos sanguíneos, los vasos linfáticos, y el tejido subcutáneo. Un parásito notablemente particular es el parásito del perro *Dirofilaria immitis*.
25 Los compuestos de la fórmula I son altamente efectivos contra estos

parásitos.

Además, los compuestos de la fórmula I son adecuados para el control de parásitos patogénicos humanos. De estos, los representantes típicos que aparecen en el tracto digestivo son aquellos de las especies *Ancylostoma*, *Necator*, *Ascaris*, *Strongyloides*, *Trichinella*, *Capillaria*, *Trichuris* y *Enterobius*. Los compuestos de la presente invención también son efectivos contra parásitos de las especies *Wuchereria*, *Brugia*, *Onchocerca* y *Loa* de la familia de *Filaridae*, la cual aparece en la sangre, en el tejido y en varios órganos, y también contra *Dracunculus* y parásitos de las especies *Strongyloides* y *Trichinella*, los cuales infectan el tracto gastrointestinal en particular.

La buena actividad pesticida de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención corresponde a una tasa de mortalidad de por lo menos 50-60% de las plagas mencionadas. En particular, los compuestos de la fórmula I son notables para la duración excepcionalmente larga de eficacia.

Los compuestos de la fórmula I se emplean preferiblemente en una forma no modificada o preferiblemente junto con los auxiliares convencionalmente utilizados en la técnica de la formulación y pueden por lo tanto ser procesados en una forma conocida por dar, por ejemplo, concentrados emulsificables, soluciones directamente diluibles, emulsiones diluidas, polvos solubles, gránulos o microencapsulaciones en sustancias poliméricas. Como con las composiciones, los métodos de aplicación se seleccionan de acuerdo

con los objetivos que se pretenden y las circunstancias que prevalecen.

La formulación, es decir los agentes o composiciones que contienen el ingrediente activo de la fórmula I, o combinaciones de estos ingredientes activos con otros ingredientes activos, y 5 opcionalmente un auxiliar líquido o sólido, se producen en una forma conocida *per se*, por ejemplo mezclando íntimamente y/o triturando los ingredientes activos con composiciones distribuidas, por ejemplo, con solventes, portadores sólidos, y opcionalmente compuestos 10 activos de superficie (agentes tensioactivos).

Los solventes en cuestión pueden ser: alcoholes, tales como etanol, propanol y butanol, y glicoles y sus éteres y ésteres, tales como glicol propilénico, glicol dipropilénico, glicol etilénico, éter monometílico o etílico de alcohol glicol etilénico, cetonas, tales como 15 ciclohexano, isorofona, o alcohol diacetanol, solventes polares fuertes, tales como N-metil-2-pirrolidona, sulfóxido de dimetilo o dimetilformamida, o agua, aceites vegetales, tales como colza, aceite de ricino, coco, o frijol de soya, y también, si es apropiado aceites de silicona.

20 Las formas de aplicación preferidas para uso en animales de sangre caliente en el control de helmintos incluyen soluciones, emulsiones, suspensiones (enjuagues), aditivos de alimentos, polvos, tabletas incluyendo tabletas efervescentes, bala, cápsulas, microcápsulas, y formulaciones que se vierten, siempre que la 25 compatibilidad fisiológica de los excipientes de la formulación deban

ser tomados en consideración.

Los aglutinantes para tabletas y baga, pueden ser sustancias naturales químicamente modificadas que son solubles en agua o en alcohol, tales como derivados de almidón, celulosa o proteína (por ejemplo, metil celulosa, carboximetil celulosa, etilhidroxietil celulosa, proteínas tales como zeína, gelatina y similares), así como polímeros sintéticos, tales como alcohol polivinílico, pirrolidona, etc. Las tabletas también contienen llenadores (por ejemplo, almidón, celulosa microcristalina, azúcar, lactosa, etc.), deslizantes y desintegrantes.

Si los antihelmínticos están presentes en la forma de concentrados de alimentos, entonces los portadores utilizados son por ejemplo, rendimiento de comida, granos de alimentos, o concentrados de proteínas. Dichos concentrados de alimentos o composiciones pueden contener, aparte de los ingredientes activos, también aditivos, vitaminas, antibióticos, quimioterapéuticos, u otros pesticidas, principalmente bacterioestatos, fungiestatos, coccidiostatos, o aún preparaciones de hormona, sustancias que tienen acción anabólica o sustancias que promueven el crecimiento, lo cual afecta la calidad de la carne de los animales para matanza o la cual es benéfica para el organismo en otra forma. Si las composiciones o los ingredientes activos de la fórmula I contenidas ahí se agregan directamente a la comida o a las bandejas de agua, entonces la comida formulada o agua contienen los ingredientes activos preferiblemente en una concentración de aproximadamente

0.0005 a 0.02% en peso (5-200 ppm).

Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención pueden ser utilizados solos o en combinación con otros biocidas. Estos pueden combinarse con pesticidas que tienen la misma esfera de actividad, por ejemplo, para incrementar la actividad, o con sustancias que tienen otra esfera de actividad, por ejemplo, para ampliar el rango de actividad. También puede sensible agregar los así llamados repelentes. Si el rango de actividad va a ser extendido a endoparásitos, por ejemplo, gusanos, los compuestos de la fórmula I son adecuadamente combinados con sustancias que tienen propiedades endoparasíticas. Por supuesto, también se pueden usar en combinación con composiciones antibacterianas. Ya que los compuestos de la fórmula I son adulticidas, es decir, ya que son efectivos en particular contra las etapas adultas de los parásitos objetivo, la adición de pesticidas que en su lugar atacan las etapas juveniles de los parásitos pueden ser muy ventajosos. En esta forma, la mayor parte de esos parásitos que producen un daño económico grande serán cubiertos. Además, esta acción contribuirá substancialmente en evitar la formación de resistencia. Muchas combinaciones también pueden conducir a efectos sinérgicos, es decir, la cantidad total del ingrediente activo puede ser reducida, lo cual es deseable a partir de un punto de vista ecológico. Los grupos de patrones de combinación preferidos y patrones de combinación especialmente preferidos son nombrados a continuación, siempre que las combinaciones puedan contener uno o más de estos patrones

además de un compuesto de la fórmula I.

Dichos patrones en la mezcla pueden ser biocidas, por ejemplo, los insecticidas y acaricidas con un mecanismo variable de actividad, los cuales son nombrados a continuación y son conocidos para aquellos con experiencia en la técnica durante largo tiempo, por ejemplo, inhibidores de síntesis de quitina, reguladores de crecimiento; ingredientes activos que son activos como hormonas juveniles; ingredientes activos que actúan como adulticidas; insecticidas de banda amplia, acaricidas de banda amplia, y nematocidas; y también los antihelmínticos bien conocidos y sustancias de disuaden insectos y/o acáridos, dichos repelentes o desunificadores.

Los ejemplos no limitantes de insecticidas y acaricidas adecuados son:

15

20

25

5

10

15

20

25

1. Abamectin
2. AC 303 630
3. Acephate
4. Acrinathrin
5. Alanycarb
6. Aldicarb
7. α -Cypermethrin
8. Alphamethrin
9. Amitraz
10. Avermectin B ₁
11. AZ 60541
12. Azinphos E
13. Azinphos-methyl
14. Azocyclotin
15. Bacillus subtil. toxin
16. Bendiocarb
17. Benfuracarb
18. Bensultap
19. β -Cyfluthrin
20. Bifenthrin
21. BPMC
22. Brofenprox

23. Bromophos E
24. Bufencarb
25. Buprofezin
26. Butocarboxim
27. Butylpyridaben
28. Cadusafos
29. Carbaryl
30. Carbofuran
31. Carbophenothion
32. Cartap
33. Cloethocarb
34. Chlorethoxyfos
35. Chlorfenapyr
36. Chlorfluazuron
37. Chlormephos
38. Chlorpyrifos
39. Cis-Resmethrin
40. Cloocythrin
41. Clofentazina
42. Cyanophos
43. Cycloprothrin
44. Cyfluthrin

45. Cyhexatin
46. D 2341
47. Deltamethrin
48. Demeton M
49. Demeton S
50. Demeton-S-metil
51. Dichlofenthion
52. Dicliphos
53. Diethion
54. Diflubenzuron
55. Dimetoato
56. Dimethylvinphos
57. Dioxathion
58. DPX-MP062
59. Edifenphos
60. Emamectin
61. Endosulfan
62. Esfenvalerato
63. Ethiofencarb
64. Ethion
65. Ethofenprox
66. Ethoprophos

5

10

15

20

25

67. Etrimpfos
68. Fenamiphos
69. Fenazaquin
70. oxido de Fenbutatín
71. Fenitrothion
72. Fenoxicarb
73. Fenothiocarb
74. Fenoxicarb
75. Fenpropathrin
76. Fenpirad
77. Fenpiroximato
78. Fenthion
79. Fenvalerato
80. Flpronil
81. Fluzazinam
82. Fluzuron
83. Flucycloxuron
84. Flucythrinate
85. Flufenoxuron
86. Flufenprox
87. Fonophos
88. Formothion
89. Fostiazat
90. Fubfenprox
91. HCH
92. Heptenophos
93. Hexaflumuron

99. Virus activos en insectos
100. Iprobenfos
101. Isofenphos
102. Isoprocarb
103. Isoxathion
104. Ivermectin
105. λ-Cyhalothrin
106. Lufenuron
107. Malathion
108. Mecarbam
109. Mesulfenphos
110. Metaldehído
111. Methamidophos
112. Methiocarb
113. Metomil
114. Metopreno
115. Metolcarb
116. Mevinphos
117. Milbemectin
118. Moxidectin
119. Naled
120. NC 184
121. NI-25, Acetamiprid
122. Nitenpyram
123. Ometosto

129. Permethrin
130. Fentoato
131. Forato
132. Fosalone
133. Fosmet
134. Phoxdm
135. Pirimicarb
136. Pirimiphos E
137. Pirimiphos M
138. Promecarb
139. Propafos
140. Propoxur
141. Prothofos
142. Protoato
143. Piraclophos
144. Piradaphenthion
145. Pyreamethrin
146. Pyrethrum
147. Pyridaben
148. Pirimidifen
149. Piriproxifen
150. RH-5992
151. RH-2485
152. Salithion
153. Sebufos
154. Silafluofen
155. Spinosad

5	94. Hexythiazox	124. Oxamyl	156. Sulfotap
	95. Hidropreno	125. Oxdemeton M	157. Sulprofos
	96. Imidacloprid	126. Oxdeprofos	158. Tebufenozida
	97. Hongo activo en insecto	127. Parathion	159. Tebufenpyrad
	98. Nemátodos activos en insectos	128. Parathion-metilo	160. Tebupirimphos
	161. Teflubenzuron	171. Thuringlensin	181. XMC (metilcarbarnato de 3,5-xdilio)
	162. Tefluthrin	172. Tralomethrin	182. Xillcarb
	163. Temephos	173. Triarteno	183. Y1 5301/5302
	164. Terbam	174. Triazarnato	184. z-Cipermethrin
	165. Terbufos	175. Triazofos	185. Zetamethrin
10	166. Tetraclovvinphos	176. Triazuron	
	168. Tiodicarb	178. Trifumuron	
	169. Tiofanox	179. Trimethacarb	
	170. Thionazin	180. Varnidothlon	
15			

Se mencionan a continuación ejemplos no limitativos de antihelmínticos adecuados, poseyendo algunos representantes además de la actividad antihelmíntica inclusive también una actividad insecticida y acaricida y que en parte ya están contenidos en el listado anterior:

- (A1) Praziauantel = 2-ciclohexilcarbonil-4-oxo-1,2,3,6,7,11b-hexahidro-4H-pirazino [2,1- α]isoquinolina;
- (A2) Closantel = 3,5-diyodo-N-[5-cloro-2-metil-4-(a-ciano-4-clorobencil)fenil] salicilamida;
- 25 (A3) Triclabendazol = 5-cloro-6-(2,3-diclorofenoxi)-2-metiltio-1H-

bencimidazol;

(A4) Levamisol = L-(-)-2,3,5,6-tetrahidro-6-fenilimidazo[2,1b]tiazol;

(A5) Mebendazol = éster metílico del ácido (5-benzoil-1H-bencimidazol-2-il) carbámico,

5 (A6) Omfalotina = un producto de fermentación macrocíclico del hongo *Omphalotus olearius* descrito en la WO 97/20857;

(A7) Abamectina = Avermectina B1;

(A8) Ivermectina = 22,23-dihidroavermectina B1;

(A9) Moxidectina = 5-O-desmetil-28-desoxi-25-(1,3-dimetil-1-butenil)-
10 6,28-epoxi-23(metoxiimino)-milbemicina B:

(A10) Doramectina = 25-ciclohexil-5-O-desmetil-25-des(1-metil-propil)-avermectina A1a;

(A11) Milbemectina = mezcla de milbemicina A3 y milbemicina A4;

(A12) Milbemicinoxima = 5-oxima de la milbemectina.

15 Ejemplos no limitativos de repelentes o desunidores son:

(R1) DEET = (N,N-dietil-m-toluamida);

(R2) KBR 3023 = N-butil-2-oxicarbonil-(2-hidroxi)-piperidina;

(R3) Cimiazole = N-2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-iliden-2,4-xilideno.

20 Los partícipes de mezcla mencionados son muy bien conocidos por el mundo especializado. La mayoría se describe en las distintas ediciones del Manual de los Pesticidas, The British Crop Protection Council, Londres; otros en las diferentes ediciones del Índice Merck, Merck & Co., Inc., Rahway, New Jersey, Estados Unidos de
25 Norteamérica, o en la literatura de patentes. Por consiguiente el

siguiente listado se limita a algunas referencias bibliográficas a título de ejemplo.

- (I) O-metilcarbamoiloxima de 2-metil-2-(metiltio)propionaldehído (Aldicarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 26;
- (II) S-(3,4-dihidro-4-oxobenzo[d]-[1,2,3]-triazin-3-ilmetil) O,O-dimetilfosforoditioato (Azinfos-metilo), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres,; página 67;
- 10 (III) Etil-N-[2,3-dihidro-2,2-dimetilbenzofuran-7-iloxicarbonil-(metil)aminotio]-N-isopropil-R-alaninato (Benfuracarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 96;
- (IV) 2-metilbifenil-3-ilmetil-(Z)-(1RS)-cis-3-(2-cloro-3,3,3-trifluorprop-1-enil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato (Bifentrin), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres; página 118;
- 15 (V) 2-terc-butilimino-3-isopropil-5-fenil-1,3,5-tiadiazian-4-ona (Buprofezin), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 157;
- (VI) 2,3-dihidro-2,2-dimetilbenzofuran-7-il-metilcarbamato (Carbofuran), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 186;
- (VII) 2,3-dihidro-2,2-dimetilbenzofuran-7-il-(dibutilaminotio)metilcarbamato (Carbosulfan), del Manual de los Pesticidas, 11ª
- 25

edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 188;

(VIII) S,S=(2-dimetilaminotrimetilen)-bis(tiocarbamato)(Cartap), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop
5 Protection Council, Londres, página 193;

(IX) 1-[3,5-dicloro-4-(3-cloro-5-trifluormetil-2-piridiloxi)fenil]-3-(2,6-diclorobenzoil)urea (Clorfluazuron), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 213;

10 (X) O,O-dietyl-O-3,5,6-tricloro-2-piridil-fosforotioato (Clorpirifos), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 235;

(XI) (RS)-α-ciano-4-fluor-3-fenoxibencil-(1RS,3RS; 1RS,3RS)-3-(2,2-diclorovinil)2,2-dimetilciclopropancarboxilato (ciflutrin), del Manual
15 de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 293;

(XII) mezcla de (S)α-ciano-3-fenoxibencil-(Z)-(1R,3R)-3-(2-cloro-3,3,3-trifluor-propenil)2,2-dimetilciclopropancarboxilato y (R)-α-ciano-3-fenoxibencil-(Z)-(1R,3R)-3-(2-cloro-3,3,3-trifluor-propenil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato (lambda-cihalotrin), del Manual de los
20 Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 300;

(XIII) racemato consistente en (S)-α-ciano-3-fenoxibencil-(1R,3R)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato y (R)-α-ciano-3-fenoxibencil-(1S,3S)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropan-
25

carboxilato (alfa-cipermetrin), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 308;

(XIV) una mezcla de los estereoisómeros de (S)- α -ciano-3-fenoxibencil-(1RS,3RS; 1RS,3RS)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato (zeta-cipermetrin), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 314;

(XV) (S)- α -ciano-3-fenoxibencil-(1R,3R)-3-(2,2-dibromovinil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato (deltametrin), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 344;

(XVI) (4-clorofenil)-3-(2,6-difluorbenzoi)urea (diflubenzuron), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 395;

(XVII) (1,4,5,6,7,7-hexacloro-8,9,10-trinorbom-5-en-2,3-ilenbismetilen-sulfito (endosulfan), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 459;

(XVIII) α -etiltio-o-tolil-metilcarbamato (etiofencarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 479;

(XIX) O,O-dimetil-O-4-nitro-m-tolil-fosforotioato (fenitrothion), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 514;

(XX) 2-sec-butilfenil-metilcarbamato (fenobucarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 516;

(XXI) (RS)- α -ciano-3-fenoxibencil-(RS)-2-(4-clorofenil)-3-metilbutirato (fenvalerato), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 539;

(XXII) S-[formil(metil)carbamoilmetil]-O,O-dimetil-fosforoditioato (formation), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council; Londres, página 625;

10 (XXIII) 4-metiltio-3,6-xilil-metilcarbanto (metiocarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 813;

(XXIV) 7-clorobiciclo[3.2.0]hepta-2,6-dien-6-il-dimetilfosfato (heptenofos), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 670;

(XXV) 1-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-nitroimidazolidin-2-ilidenamina (imidacloprid), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 706;

(XXVI) 2-isopropilfenil-metilcarbamato (isoprocarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 729;

(XXVII) O,S-dimetil-fosforamidotioato (metamidofos), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 808;

25 (XXVIII) S-metil-N-(metilcarbamoiloxi)tioacetimidato (metomil), del

Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 815;

(XXIX) metil-3-(dimetoxifosfinoiloxi)but-2-enoato (mevinfos), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 844;

(XXX) O,O-dietil-O-4-nitrofenil-fosforotioato (paration), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 926;

(XXXI) O,O-dimetil-O-4-nitrofenil-fosforotioato (paration-metilo), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 928;

(XXXII) S-6-cloro-2,3-dihidro-2-oxo-1,3-benzoxazol-3-ilmetil-O,O-dietilfosforoditioato (fosalone), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 963;

(XXXIII) 2-dimetilamino-5,6-dimetilpirimidin-4-il-dimetilcarbamato (pirimicarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 985;

(XXXIV) 2-isopropoxifenil-metilcarbamato (propoxur), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1036;

(XXXV) 1-(3,5-dicloro-2,4-difluorfenil)-3-(2,6-difluorbenzoi)urea (teflubenzuron), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1158;

(XXXVI) S-terc-butiltiometil-O,O-dimetil-fosforoditioato (terbufos), del

Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1165;

(XXXVII) **etil-(3-terc-butil-1-dimetilcarbamoil-1H-1,2,4-triazol-5-il-tio)acetato (triazamato), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición**
5 (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1224;

(XXXVIII) **abamectina, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición**
(1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 3;

(XXXIX) **2-sec-butilfenil-metilcarbamato (fenobucarb), del Manual de**
los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection
10 Council, Londres, página 516;

(XL) **N-terc-butil-N-(4-etilbenzoil)-3,5-dimetilbenzohidrazida**
(tefubenzozide), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The
British Crop Protection Council, Londres, página 1147;

(XLI) **(±)-5-amino-1-(2,6-dicloro-α,α,α-trifluor-p-tolil)-4-trifluormetil-**
15 sulfinilpirazol-3carbonitrilo (fipronil), del Manual de los Pesticidas,
11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres,
página 545;

(XLII) **(RS)-α-ciano-4-fluor-3-fenoxibencil-(1RS,3RS; 1RS,3RS)-3-**
(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciciopropancoarboxilato (beta-ciflutrin),
20 del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop
Protection Council, Londres, página 295;

(XLIII) **(4-etoxifenil)-[3-(4-fluor-3-fenoxifenil)propil]dimetilsilano**
(silafuofen), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The
British Crop Protection Council, Londres, página 1105;

(XLIV) **(E)-α-(1,3-dimetil-5-fenoxipirazol-4-il-metilenamino-oxi)-p-**
25

toluato de tercbutilo (fenpiroximato), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 530;

(XLV) 2-terc-butil-5,(4-terc-butilbenciltio)-4-cloropiridazln-3(2H)-ona
5 (piridaben), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1161;

(XLVI) 4-[[4-(1,1-dimetilfenil)fenil]etoxi]-quinazolina (fenazaquin), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 507;

10 (XLVII) éter 4-fenoxifenil-(RS)-2-(piridiloxi)propílico (piriproxifen), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1073;

(XLVIII) 5-cloro-N-[[2-[4-(2-etoxietil)-2,3-dimetilfenoxi]etil]-6-etilpirimidin-4-amina (pirimidifen), del Manual de los Pesticidas, 11ª
15 edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1070;

(XLIX) (E)-N-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-etil-N-metil-2-nitroviniliden-diamina (nitenpiram), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 880;

20 (L) (E)-N'-[(6-cloro-3-piridil)metil]-N²-ciano-N¹-metilacetamidina (NI-25, acetamiprid), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 9;

(LI) avermectina B₁, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 3;

25 (LII) un extracto activo contra los insectos de una planta, en

particular (2R,6aS,12aS)-1,2,6,6a,12,12a-hexahidro-2-isopropenil-8,9-dimetoxi-cromeno[3,4-b]furo[2,3-h]cromen-6-ona (rotenona), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1097; y un extracto de
5 Azadirachta indica, en particular azadiractina, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 59;

(LIII) un preparado, que contiene nematodos activos contra insectos, preferentemente *Heterorhabditis bacteriosphora* y *Heterorhabditis*
10 *megidis*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 671; *Steinernema feltiae*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1115; y *Steinernema scapterisci*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The
15 British Crop Protection Council, Londres, página 1116;

(LIV) un preparado, obtenible de *Bacillus subtilis*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 72; o de una cepa de *Bacillus thuringiensis* con excepción de compuestos aislados de GC91 o de NCTC11821; del
20 Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 73;

(LV) un preparado, que contiene hongos activos contra insectos, de preferencia *Verticillium lecanii*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página
25 1266; *Beauveria brogniartii*, del Manual de los Pesticidas, 11ª

- edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 85; y *Beauveria bassiana*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 83;
- (LVI) un preparados, que contiene virus activos contra insectos, de preferencia *Neodipridon Sertifer NPV*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1342; *Mamestra brassicae NPV*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 759; y virus de *Cidra pomonella granulosis*, del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 291;
- (CLXXXI) 7-cloro-2,3,4a,5-tetrahidro-2-[metoxicarbonil-(4-trifluorometoxifenil)-carbamoil]indo[1,2e]oxazolin-4a-carboxilato (DPX-MP062, indoxicarb), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 453;
- (CLXXXII) N-terc-butil-N-(3,5-dimetilbenzoil)-3-metoxi-2-metilbenzohidrazida (RH-2485, metoxifenozone), del Manual de los Pesticidas, 11ª edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1094;
- (CLXXXIII) éster isopropílico del ácido (N'-[4-metoxi-bifenil-3-il]hidrazincarboxílico (D 2341), de la Brighton Crop Protection Conference, 1996, 487-493; y
- (R2), libro de resúmenes, 212mo. encuentro nacional de la ACS, Orlando, FL, 2529 de agosto (1996), AGRO-020. Publicista: American Chemical Society, Washington, DC, CONEN; 63BFAF.

En conformidad con las menciones anteriores otro aspecto esencial de la presente invención concierne a preparados de combinación para combatir parásitos en animales de sangre caliente, caracterizado porque éstos contienen aparte de un compuesto de la
5 Fórmula I por lo menos otra sustancia activa de la misma u otra modalidad de acción y por lo menos un vehículo fisiológicamente compatible. La presente invención no se limita a combinaciones de dos componentes.

Los agentes antihelmínticos de acuerdo con la invención
10 contienen por lo general de 0,1 a 99 % en peso, en particular de 0,1 a 95 % en peso, de sustancia activa de la Fórmula I, la o mezclas de las mismas; de 99,9 a 1 % en peso, en particular de 99,8 a 5 % en peso, de un aditivo sólido o líquido, entre ellos de 0 a 25 % en peso, en especial de 0,1 a 25 % en peso, de un agente tensioactivo.

15 La aplicación de los agentes de acuerdo con la invención al animal que se va a tratar puede realizarse de forma tópica, peroral, parenteral o subcutánea estando presentes los agentes en forma de soluciones, emulsiones, suspensiones (baños), polvos, tabletas, bolos, cápsulas y como formulaciones de vaciado ("pour-on").

20 Los métodos de vaciado ("pour-on") o bien de rociado ("spot-on") consisten en aplicar el compuesto de la Fórmula I sobre una porción de epidermis o de piel localmente definida, de manera ventajosa sobre la cerviz o el espinazo del animal. Esto se lleva a cabo, por ejemplo, mediante la aplicación por medio de una torunda
25 o salpicadura de la formulación de vaciado o bien rociado sobre una

superficie relativamente pequeña de la piel, a partir de la cual se distribuye la sustancia activa de forma casi autónoma sobre una amplia zona a causa de los componentes de extensión de la formulación y con la ayuda de los movimientos del animal.

5 Las formulaciones de vaciado o bien rociado contienen convenientemente vehículos, que propician la rápida distribución sobre la superficie de la epidermis o bien de la piel del animal huésped y se designan en general aceites de extensión. Adecuados son por ejemplo soluciones oleosas; soluciones alcohólicas e
10 isopropanólicas, como, por ejemplo, soluciones de 2-octildodecanol o alcohol oleílico; soluciones en ésteres de ácidos monocarboxílicos, como miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, éster oxálico de ácido láurico, éster oleílico de ácido oleico, éster decílico de ácido oleico, laurato de hexilo, oleato de oleilo, oleato de decilo,
15 ésteres de ácido cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena de C_{12} . C_{18} ; soluciones de ésteres de ácidos dicarboxílicos, como ftalato de dibutilo, isoftalato de diisopropilo, éster diisopropílico del ácido adípico, adipato de di-n-butilo o también soluciones de ésteres de ácidos alifáticos, por ejemplo,
20 glicoleno. Puede resultar ventajoso, que esté adicionalmente presente un agente de dispersión conocido a partir de la industria farmacéutica o cosmética. Ejemplos son 2-pirrolidona, 2-(N-alquil) pirrolidona, acetona, polietilenglicol y sus éteres y ésteres, propilenglicol o triglicéridos sintéticos.

25 Las soluciones oleosas comprenden, por ejemplo, aceites

vegetales, como aceite de oliva, aceite de maní, aceite de sésamo, aceite de pino, aceite de lino o aceite de ricino. Los aceites vegetales pueden estar presentes en forma epoxidada. Se pueden emplear también parafina y aceites de silicón.

5 En general una formulación de vaciado o bien rociado contiene de 1 a 20 % en peso de un compuesto de la Fórmula I, de 0,1 a 50 % en peso de agente de dispersión y de 45 a 98,9 % en peso de solvente.

10 Los métodos vaciado o bien rociado se pueden emplear de manera particularmente ventajosa en animales gregarios, como vacunos, equinos, ovejas o cerdos, en el caso de los cuales resulta difícil o trabajoso, tratar todos los animales por vía oral o por medio de inyección. En virtud de su simpleza pueden emplearse estos métodos naturalmente también en el caso de todos los otros
15 animales, incluso animales domésticos o falderos individuales y goza de gran preferencia en el caso de los propietarios de animales, ya que a menudo pueden ser puestos en práctica sin la asistencia especializada del veterinario.

20 Si bien son más preferidos como producto comercial agentes concentrados, el usuario final utiliza por lo general agentes diluidos.

Tales agentes pueden contener además otros aditivos, como estabilizadores, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes, adhesivos así como otras sustancias activas para el logro de efectos especiales.

25 Los agentes antihelmínticos de este tipo utilizados por el

usuario final son asimismo parte integrante de la presente invención.

En cada uno de los procedimientos de acuerdo con la invención para el control de organismos perjudiciales o bien de los agentes para el control de organismos perjudiciales de acuerdo con la
5 invención pueden emplearse las sustancias activas de la Fórmula I en todas las configuraciones espaciales o sus mezclas.

La invención incluye también un procedimiento para la protección profiláctica de animales de sangre caliente, en particular de animales útiles, domésticos o falderos contra helmintos parásitos,
10 que se caracteriza porque se aplican a los animales las sustancias activas de la Fórmula o bien las formulaciones de sustancia activa preparadas a partir de las mismas como agregado al alimento o a la bebida o también en forma sólida o líquida por vía oral, mediante inyección o parenteralmente. La invención incluye también los
15 compuestos de acuerdo con la invención de la Fórmula I para utilización en uno de los procedimientos mencionados.

Los siguientes Ejemplos cumplen la función simplemente de ilustrar la invención, sin limitarla, significando el concepto sustancia activa en calidad de sustituto una de las sustancias
20 enumeradas en el Cuadro 1.

Las formulaciones preferidas tienen en particular las siguientes composiciones:

(% = porcentaje en peso)

69
64

Ejemplos de formulación

1. Granulado

	a)	b)
Substancia activa	5 %	10 %
Caolín	94%	-
5 Acido silícico altamente disperso	1 %	-
Atapulgita	-	90 %

La substancia activa se disuelve en cloruro de metileno, se rocía sobre el soporte y a continuación se evapora en solvente al vacío. Tales granulados pueden mezclarse con el pienso de los
10 animales.

2. Granulado

Substancia activa	3 %
Polietilenglicol (PM 200)	3 %
15 Caolín	94 %
(PM) = peso molecular	-

La substancio activa finamente molida se aplica en un mezclador de modo uniforme sobre el caolín humedecido con polietilenglicol. De esta manera se obtiene un granulado de
20 recubrimiento exento de polvo.

3. Tabletas o bien bolos

I	Substancia activa	33,00 %
	Metilcelulosa	0,80 %
25	Acido silícico altamente disperso	0,80 %

	Almidón de maíz	8,40 %
II	Lactosa cristalina	22,50 %
	Almidón de maíz	17,00 %
	Celulosa microcristalina	16,50 %
5	Estearato de magnesio	1,00 %
I	La metilcelulosa se agita en agua. Después de que el material e ha hinchado, se agita el ácido silícico y se suspende homogéneamente la mezcla. Se mezclan la sustancia activa y el almidón de maíz. En esta mezcla se incorpora la suspensión acuosa y se amasa hasta formar una pasta. La masa así obtenida se granula a través de un tamiz 12 M y se seca.	
10		
II	Se mezclan bien todos los 4 adyuvantes.	
III	Las pre-mezclas obtenidas de acuerdo con I y II se mezclan y se comprimen para formar tabletas o bolos.	

15

4. Preparados inyectables

A. Vehículo oleoso (liberación lenta)

	1. Substancia activa	0,1-1,0 g
	Aceite de maní	hasta completar 100 ml
20	2. Substancia activa	0,1-1,0 g
	Aceite de sésamo	hasta completar 100 ml
	Preparación: La sustancia activa se disuelve en una parte del aceite con agitación y eventualmente con un ligero calentamiento, después de enfriamiento se lleva hasta el volumen teórico y se esteriliza por	
25	filtrado a través de un filtro de membrana adecuado con 0,22 mm.	

B Vehículo miscible con agua (velocidad de liberación media)

	Substancia activa	0,1-1,0 g
	4-hidroximetil-1,3-dioxolano (glicerol formal)	40 g
	1,2-propandiol	hasta completar 100 ml.
5	Substancia activa	0,1-1,0 g
	Glicerindimetilcetal	40 g
	1,2-propandiol	hasta completar 100 ml

Preparación: La substancia activa se disuelve en una parte del solvente con agitación, se lleva hasta el volumen teórico y se esteriliza por filtrado a través de un filtro de membrana adecuado con 0,22 mm.

C. Producto solubilizado en agua (liberación rápida)

	1. Substancia activa	0,1-1,0 g
15	Aceite de ricino polietoxilado (40 unidades de óxido de etileno)	10 g
	1,2-propanodiol	20 g
	Alcohol bencílico	1 g
	Agua para inyecciones	hasta completar 100 ml
20	2. Substancia activa	0,1-1,0 g
	Monooleato de sorbitán polietoxilado (20 unidades de óxido de etileno)	8 g
	4-hidroximetil-1,3-dioxolano (glicerol formal)	20 g
	Alcohol bencílico	1 g
25	Agua para inyecciones	hasta completar 100 ml

Preparación: la sustancia activa se disuelve en el solvente y el agente tensioactivo y se lleva con agua al volumen teórico. Se esteriliza a través de un filtro de membrana adecuado con 0,22 mm de diámetro de poros.

5

5. Vaciado

A.

Substancia activa	5 g
Miristato de isopropilo	10 g
10 Isopropanol	hasta completar 100 ml

B.

Substancia activa	2 g
Laurato de hexilo	5 g
15 Triglicéridos de cadena media	15g
Etanol	hasta completar 100 ml

C.

Substancia activa	2 g
20 Oleato de oleilo	5 g
N-metil-pirrolidona	40 g
Isopropanol	hasta completar 100 ml

Los sistemas acuosos pueden emplearse de modo más preferido también para la aplicación Oral y/o intramuscular.

25 Los agentes pueden también contener otros aditivos como

estabilizadores, por ejemplo, aceites vegetales eventualmente epoxidados (aceite de coco, aceite de colza o aceite de soya epoxidados); antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona; agentes conservadores; reguladores de la viscosidad; aglutinantes, adhesivos así como fertilizantes u otras sustancias activas para el logro de efectos especiales.

Pueden agregarse además otras sustancias o aditivos biológicamente activos, que se comportan de modo neutral respecto de los compuestos de la Fórmula I y no tienen ninguna influencia perjudicial sobre los animales huésped a tratar, así como sales minerales o vitaminas a las composiciones descritas.

Los siguientes Ejemplos cumplen la función de explicar la invención. Ellos no limitan la invención. El símbolo "h" significa hora.

15

EJEMPLOS DE PREPARACION

EJEMPLO 1

N-[1-cloro-1-metil-2-(2-bencil-4-clorofenoxi)-etil]-4-trifluorometoxibenzamida

20

a) Se disolvieron 5 g de 2-bencil-4-clorofenol, 2.6 ml de cloroacetona, 1.38 g de carbonato de potasio y 0.34 g de yoduro de potasio en 50 ml de acetona y se hirvieron bajo reflujo durante 20 horas. Después de enfriar, el precipitado se filtró, se concentró a través de evaporación, el residuo se disolvió en acetato de etilo, la solución se lavó tres veces con una solución de 1n de hidróxido de

25

sodio, después con solución de cloruro de sodio saturada, se secó con sulfato de magnesio y se concentró a través de evaporación bajo vacío. Después de la cristalización a partir de éter dietílico, se obtuvo 1-(2-bencil-4-clorofenoxi)-propan-2-ona como un polvo blanco con un punto de fusión de 65-6°C.

b) Se suspendieron 3.8 g de 1-(2-bencil-4-clorofenoxi)-propan-2-ona, 0.8 g de cianuro de sodio y 1.1 g de cloruro de amonio en 40 ml de solución de amoniaco al 25% y se agitaron a temperatura ambiente durante 48 horas. El producto crudo se extrajo subsiguientemente a partir de la mezcla de reacción con acetato de etilo, la fase orgánica se lavó con agua y solución de cloruro de sodio saturada, se secó con sulfato de magnesio y se concentró a través de evaporación bajo vacío, de esta forma se obtuvo 2-amino-3-(2-bencil-4-clorofenoxi)-2-metil-propionitrilo.

c) Una mezcla de 180 mg de diisopropilamina de etilo, 14.6 mg de 4-dimetilaminopiridina y 269 mg de cloruro de 4-(2-trifluorometoxi)-benzoilo se agregó gota a gota a una solución de 300 mg de 2-amino-3-(2-bencil-4-clorofenoxi)-2-metil-propionitrilo en 3 ml de cloruro de metileno y subsecuentemente se agitó a temperatura ambiente durante 20 horas. Posteriormente, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo, después se lavó con 1N de ácido clorhídrico acuoso, agua, y solución de bicarbonato de sodio saturada y finalmente con solución de cloruro de sodio saturada. Después de secarla fase orgánica con sulfato de magnesio y concentrar mediante evaporación bajo vacío, el residuo se

75
70

recristalizó en éter dietílico/hexano. El compuesto del título así se obtuvo como un polvo blanco con un punto de fusión de 103-4°C.

Las sustancias nombradas en el siguiente cuadro también pueden ser preparadas analógicamente al método anteriormente descrito. Los valores de los puntos de fusión se indican en °C. Bd significa un enlace directo.

10

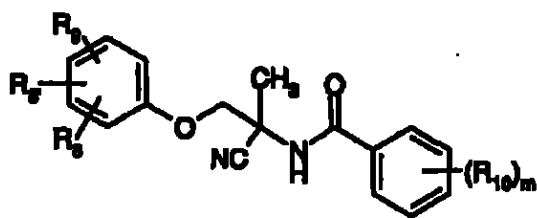
15

20

25

76
71

Table 1



5					
	No.	R ₅	R ₉	R ₁₀	datos fis.
	1.1	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	2-CF ₃
	1.2	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	3-CF ₃
	1.3	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	4-CF ₃
	1.4	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	2-OCF ₃
	1.5	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	3-OCF ₃
	1.6	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	4-OCF ₃
	1.7	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.8	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.9	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	H	4-C(O)C ₆ H ₅
10	1.10	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-CF ₃
	1.11	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-CF ₃
	1.12	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-CF ₃
	1.13	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-OCF ₃
	1.14	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-OCF ₃
	1.15	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-OCF ₃
	1.16	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.17	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.18	H	2-CH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅
15	1.19	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	2-CF ₃
	1.20	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	3-CF ₃
	1.21	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	4-CF ₃
	1.22	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	2-OCF ₃
	1.23	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	3-OCF ₃
	1.24	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	4-OCF ₃
	1.25	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.26	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.27	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	H	4-C(O)C ₆ H ₅
20	1.28	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-CF ₃
	1.29	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-CF ₃
	1.30	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-CF ₃
	1.31	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-OCF ₃
	1.32	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-OCF ₃
	1.33	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-OCF ₃
	1.34	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.35	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.36	H	2-OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅
25	1.37	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	2-CF ₃
	1.38	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	3-CF ₃
	1.39	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	4-CF ₃
	1.40	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	2-OCF ₃
	1.41	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	3-OCF ₃
	1.42	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	4-OCF ₃
	1.43	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	2-C(O)C ₆ H ₅

p.f. 103-4°

aceite amarillo

aceite

77
72

	1.44	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	3-C(O)C ₆ H ₅	
	1.45	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	H	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.46	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-CF ₃	
	1.47	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-CF ₃	
	1.48	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-CF ₃	
	1.49	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-OCF ₃	
	1.50	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-OCF ₃	
	1.51	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-OCF ₃	
5	1.52	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.53	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅	
	1.54	H	2-C(O)OCH ₂ C ₆ H ₅	4-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.55	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	2-CF ₃	
	1.56	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	3-CF ₃	
	1.57	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	4-CF ₃	
	1.58	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	2-OCF ₃	
	1.59	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	3-OCF ₃	
	1.60	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	4-OCF ₃	aceite
	1.61	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.62	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	3-C(O)C ₆ H ₅	
10	1.63	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	H	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.64	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	2-CF ₃	
	1.65	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	3-CF ₃	
	1.66	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	4-CF ₃	
	1.67	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	2-OCF ₃	
	1.68	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	3-OCF ₃	
	1.69	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	4-OCF ₃	
	1.70	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.71	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅	
	1.72	H	2-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	4-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.73	H	2-(SC ₆ H ₅ -2,4-Cl ₂)	4,5-F ₂	4-OCF ₃	cris. blanco
15	1.74		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	2-CF ₃	
	1.75		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	3-CF ₃	
	1.76		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	4-CF ₃	
	1.77		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	2-OCF ₃	
	1.78		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	3-OCF ₃	
	1.79		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	4-OCF ₃	p.f. 132-3°
	1.80		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.81		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	3-C(O)C ₆ H ₅	
	1.82		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	H	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.83		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	2-CF ₃	
	1.84		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	3-CF ₃	
20	1.85		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	4-CF ₃	
	1.86		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	2-OCF ₃	
	1.87		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	3-OCF ₃	
	1.88		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	4-OCF ₃	
	1.89		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.90		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅	
	1.91		2-(CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂)-3	4-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.92		2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	2-CF ₃	
	1.93		2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	3-CF ₃	
	1.94		2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	4-CF ₃	
	1.95		2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	2-OCF ₃	
25	1.96		2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	3-OCF ₃	
	1.97		2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	4-OCF ₃	p.f. 81-3°

75
73

5	1.98	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.99	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	3-C(O)C ₆ H ₅	
	1.100	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	H	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.101	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	2-CF ₃	
	1.102	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	3-CF ₃	
	1.103	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	4-CF ₃	
	1.104	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	2-OCF ₃	
	1.105	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	3-OCF ₃	
	1.106	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	4-OCF ₃	
	1.107	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅	
10	1.108	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅	
	1.109	2-(OC(CH ₃) ₂ CH ₂)-3	4-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.110	3-(OCH ₂ O)-4	H	2-CF ₃	
	1.111	3-(OCH ₂ O)-4	H	3-CF ₃	
	1.112	3-(OCH ₂ O)-4	H	4-CF ₃	
	1.113	3-(OCH ₂ O)-4	H	2-OCF ₃	
	1.114	3-(OCH ₂ O)-4	H	3-OCF ₃	
	1.115	3-(OCH ₂ O)-4	H	4-OCF ₃	p.f. 146-8°
	1.116	3-(OCH ₂ O)-4	H	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.117	3-(OCH ₂ O)-4	H	3-C(O)C ₆ H ₅	
25	1.118	3-(OCH ₂ O)-4	H	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.119	3-(OCH ₂ O)-4	Br	4-OCF ₃	p.f. 116-7°

EJEMPLOS BIOLOGICOS

15

1. Prueba in vivo en Trichostrongylus colubriformis y Haemonchus contorts en gerbos Mongoles (Meriones unaulculatus) utilizando aplicación bucal

Los gerbos de Mongolia de seis a ocho semanas de edad se infectaron mediante alimentación artificial con aproximadamente 2000 larvas del tercer tipo cada una de *T. colubriformis* y *H. contortus*. Seis días después de la infección, los gerbos se anestesiaron ligeramente con N2O y se trataron a través de aplicación bucal con los compuestos de prueba, se disolvieron en una mezcla de 2 partes de DMSO y 1 parte de glicol polietilénico

(PEG 300), en cantidades de 100, 32 y 10-0.1 mg/kg. En el día 9 (tres días después del tratamiento), cuando la mayor parte de *H. contortus* que aún está presente son las última larvas del cuarto tipo y la mayor parte de *T. colubriformis* son adultos inmaduros, los
5 gerbos se aniquilaron con el fin de contar los gusanos. La eficacia se calculó como el % de reducción del número de gusanos en cada gerbo, comparado con el promedio geométrico del número de gusanos de 8 gerbos no tratados e infectados.

En esta prueba, se logró una vasta reducción en infestación de
10 nematodos con compuestos de la fórmula I, especialmente de la Tabla 1.

Para examinar la actividad insecticida y/o acaricida de los compuestos de la fórmula I en animales y plantas, se pueden utilizar los siguientes métodos de prueba.

15

2. Actividad en larva L₁ de *Lucilia sericata*

Se mezcló 1 mg de una suspensión acuosa de la sustancia activa que va ha ser probada con 3 ml de un medio de crecimiento de larva especial a aproximadamente 50°C, por lo que se obtiene un
20 homogenato de ya sea 250 o 125 ppm del contenido del ingrediente activo. Aproximadamente 30 larvas *Lucilia* (L₁) se utilizan en cada muestra del tubo de ensayo. Después de 4 días, se determina la tasa de mortalidad.

25

3. Actividad del acaricida en *Boophilus microplus* (cepa Biarra).

Una pieza de cinta adhesiva se anexo horizontalmente a una hoja de PVC, por lo que las 10 garrapatas hembra completamente congestionadas de *Boophilus microplus* (cepa Biarra) pueden ser adheridas a las mismas en sus espaldas, de lado a lado, en una fila. Al utilizar una aguja para inyección, se inyectó 1 ml de un líquido dentro de cada garrapata. El líquido es una mezcla de 1:1 de glicol polietilénico y acetona y contiene, disuelto en el mismo, una cierta cantidad de ingrediente activo seleccionado de 1, 0.1, o 0.01 µg por garrapata. A los animales de control se les dio una inyección sin el ingrediente activo. Después del tratamiento, los animales se mantuvieron bajo condiciones normales en un insectario a aproximadamente 28°C y a una humedad relativa de 80% hasta que tomó lugar la puesta de huevos y las larvas se incubaron a partir de los huevos de los animales de control. La actividad de una sustancia probada se determinó a través de IR₉₀, es decir, se hace una evaluación del grado del ingrediente activo en el cual 9 de 10 garrapatas hembra (=90%) pusieron huevos que son infértiles aún después de 30 días.

20

4. Eficacia *In vitro* en *Boophilus microplus* hembra congestionada (BIARRA):

Se adhirieron 4x10 garrapatas hembra congestionadas del a cepa BIARRA resistente a OP a una tira adhesiva y se cubrieron durante 1 hora con una bola de algodón-lana empapada en una

25

emulsión o suspensión del compuesto de prueba en concentraciones de 500, 125, 31, y 8 ppm respectivamente. La evaluación tomó lugar a los 28 días después basados en la mortalidad, puesta de huevos e incubación de las larvas.

5 Una indicación de la actividad de los compuestos de prueba se muestra a través del número de hembras que:

- mueren rápidamente antes de poner los huevos
- sobreviven durante algún tiempo si ponen huevos,
- ponen huevos en los cuales no se forman embriones,
- 10 - ponen huevos en los cuales se forman embriones, a partir de los cuales las larvas normalmente se incuban dentro de los 26 a 27 días.

5. Eficacia *in vitro* de ninfas de *Amblyomma hebraeum*

15 Se colocaron alrededor de 5 ninfas en ayunas en un tubo de ensayo de poliestireno conteniendo 2 ml del compuesto de prueba en solución, suspensión o emulsión.

Después de la inmersión durante 10 minutos, y agitación durante 2x10 segundos en un mezclador vórtice, los tubos de ensayo
20 se bloquearon con un tapón ligero de lana de algodón y se rotó. Tan pronto como se empapó de líquido a través de la bola de algodón-lana, se empujó a medio camino dentro del tubo de ensayo el cual aún estaba rotando, por lo que la mayor parte del líquido se exprimió de la bola de algodón-lana y fluyó dentro del disco de Petri hacia
25 abajo.

Los tubos de ensayo después se mantuvieron a temperatura ambiente en un cuarto con luz de día hasta que se evaluaron. Después de 14 días, los tubos de ensayo se sumergieron en un vaso de laboratorio con agua hirviendo. Si las garrapatas se empiezan a mover como reacción al calor, la sustancia de prueba es inactiva a la concentración probada, de lo contrario las garrapatas son consideradas como muertas y las sustancias de prueba son consideradas como activas a la concentración probada. Todas las sustancias se probaron en un rango de concentración de 0.1 a 100 ppm.

6. Actividad contra *Dermanyssus gallinae*

Se agregaron de 2 a 3 ml de una solución conteniendo ingrediente activo a 10 ppm, y aproximadamente 200 ácaros (*Dermanyssus gallinae*) a diferentes etapas de desarrollo a un contenedor de vidrio el cual está abierto en la parte superior. Después el contenedor se cerró con un tapón ligero de lana de algodón, se agitó durante 10 minutos hasta que los ácaros estuvieron completamente mojados, y después se invirtió brevemente para que el restante de la solución de prueba pudiera ser absorbido por la lana de algodón. Después de 3 días, la mortalidad de los ácaros se determinó a través de los individuos muertos y se indicó como un porcentaje.

83
78

7. Actividad contra *Musca doméstica*

Se trató un cubo de azúcar con una solución de la sustancia de prueba en dicha forma que la concentración de la sustancia de prueba en el azúcar, después de secar durante la noche, es de 250 ppm. El cubo tratado en esta forma se colocó en un plato de aluminio con lana de algodón húmeda y 10 *Musca doméstica* adultas de una cepa resistente a OP, se cubrieron con un vaso de laboratorio y se incubaron a 25°C. La tasa de mortalidad se determinó después de 24 horas.

10

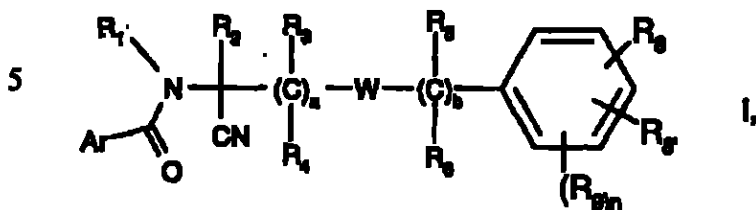
15

20

25

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula



Ar significa arilo o hetarilo, el cual es no sustituido o sustituido una o muchas veces, por lo cual los sustituyentes
 10 pueden ser independientes uno del otro y se seleccionan del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6
 15 átomos de carbono, alquinilo 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilamino de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiltio de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6
 20 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de
 25 carbono, alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniltio de

2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenilamino el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, arilsulfonilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilmetoximino el cual está no substituido o substituido una o muchas veces; fenilhidroximetilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilclorometilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilcianometilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenoxi el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilacetilenilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces y piridiloxi el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, siempre que los

substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono y di-
10 alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o alcoximetilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, son ya sea, independientemente uno del
15 otro, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alcoxi
20 de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionan del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono el cual
25 está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre

que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno y alquilo de 1 a 6 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas, siempre que los substituyentes puedan ser
5 independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono,
10 alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, o di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono;

o R_2 y R_3 juntos significan alquilenos de 2 a 6 átomos de
15 carbono;

R_7 significa hidrógeno o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

cualquier R_8 significa fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxycarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
20 benciloxycarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenil-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenil-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono el
25 cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,

84
83

hetariloxicarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o
muchas veces, alquilcarboxi de 1 a 6 átomos de carbono; fenilcarboxi
el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
bencilcarboxi el cual está substituido o no substituido una vez o
5 muchas veces, fenilcarboxamido el cual está substituido o no
substituido una vez o muchas veces, alquilcarboxamido,
alquiloxicarboxamido de 1 a 6 átomos de carbono;
feniloxicarboxamido el cual está no substituido o substituido una o
muchas veces, fenilaminocarboxi el cual está substituido o no
10 substituido una vez o muchas veces, feniloxicarboxi, el cual está no
substituido o substituido una o muchas veces, fenilaminocarboxamido
el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono-alquiloxi de 1 a 6 átomos de
carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a
15 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono,
alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, (alquilo de 1 a 6
átomos de carbono)₂aminocarbonilo; fenilaminocarbonilo el cual está
substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquiltio de 1 a
6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, feniltio-
20 alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no
substituido una vez o muchas veces, fenilmetoxiimino el cual está
substituido o no substituido una vez o muchas veces,
fenilhidroximetilo el cual está substituido o no substituido una vez o
muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está substituido o no
25 substituido una vez o muchas veces, fenilclorometilo el cual está

substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenilcianometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
5 de R₆; y R₆ significa hidrógeno;

o R₆ y R₆ juntos significan alquileo de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces a través de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, siempre que uno o dos átomos de carbono pueden ser reemplazados por oxígeno;

10 R₆ significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono,
15 cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilamino de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiltio de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos
20 de carbono, alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, halo-
25 alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6

90
85

átomos de carbono, halo-alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de
carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-
alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6
átomos de carbono, di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono,
5 alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, halo-
alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1
a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de
carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono,
alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di-
10 alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenilamino el cual
está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o
muchas veces, fenilmetoxiimino el cual está substituido o no
substituido una vez o muchas veces; fenilhidroximetilo el cual está
15 substituido o no substituido una vez o muchas veces, 1-fenil-1-
hidroxietilo el cual está substituido o no substituido una vez o
muchas veces, fenilclorometilo el cual está substituido o no
substituido una vez o muchas veces, fenilcianometilo el cual está
substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual
20 está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el
cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
feniltio el cual está substituido o no substituido una vez o muchas
veces, fenilacetilenilo el cual está substituido o no substituido una
vez o muchas veces, o piridiloxi el cual está substituido o no
25 substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes

puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, y halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono;

10 W significa O, S, S(O)₂ o N(R₇);

 a significa 1, 2, 3, o 4;

 b significa 0, 1, 2, 3, o 4; y

 n es 0, 1, 2, o 3;

 2. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la
15 reivindicación 1, en donde Ar significa arilo o hetarilo los cuales
 están substituidos o no substituidos una vez o muchas veces, en
 donde lo substituyentes, independientes uno del otro, se seleccionan
 del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6
 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi
20 de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono,
 alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6
 átomos de carbono, alquinilo 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo
 de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de
 carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniloxi de
25 2 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de

92
87

carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilamino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
5 fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, y piridiloxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
10 de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono.

3. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Ar significa arilo el cual está substituido
15 o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 4
20 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono; fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el
25 cual está substituido o no substituido una o muchas veces y fenoxi el

cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono.

4. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Ar significa fenilo que está ya sea substituido o no substituido una o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; y fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono.

5. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₁ es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

6. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₁ es hidrógeno, o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono.

7. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_1 es hidrógeno.

8. Un compuesto de la fórmula I, en donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , y R_6 , son, independientemente uno del otro, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno y alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono.

9. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , y R_6 , son, independientemente uno del otro, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser

independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes
5 puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, clano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono.

10 10. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , y R_6 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno; o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno,
15 alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono.

11. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_7 significa hidrógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

20 12. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_7 es hidrógeno.

13. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en donde R_8 significa alquilcarboxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi-aquilloxi de 1 a 6 átomos de carbono,
25 hidroxi-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 6 átomos

de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenil-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono
5 el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_8 y R_9 signifiquen hidrógeno;

o R_8 y R_9 juntos significan alquilenos de 1 a 4 átomos de
10 carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces por alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, siempre que uno o dos átomos de carbono puedan ser reemplazados por oxígeno.

14. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde cualquier R_8 significa alquilcarboxi de 1 a
15 4 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; fenil-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-
20 alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_8 y R_9 significa hidrógeno;

o R_8 y R_9 juntos significan alquilenos de 1 a 3 átomos de
25 carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas

veces por metilo, siempre que uno o dos átomos de carbono puedan ser reemplazados por oxígeno.

15. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde cualquier R_1 significa alquiloxi de 1 a 2' átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; fenil-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_1 ; y R_2 significa hidrógeno.

16. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, R_1 significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 3 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilamino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o piridiloxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del

98
93

otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono.

5 17. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₆ significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono,
10 cicloalquiloxi de 3 a 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, o alcoxicarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono.

 18. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₆ significa halógeno, nitro, ciano, alquilo
15 de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, o halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono.

 19. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde W es O o S.

20 20. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde W es O.

 21. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde a es 1, 2 o 3.

 22. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la
25 reivindicación 1, en donde a es 1 o 2.

23. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde a es 1.

24. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde b es 0, 1, 2, o 3.

5 25. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde b es 0, 1, o 2.

26. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde b es 0.

10 27. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde n es 0 o 1.

28. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde n es 0.

29. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Ar significa arilo o hetarilo el cual está
15 substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6
20 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6
25 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono,

alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilamino el cual está
 substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarbonilo
 el cual está substituido o no substituido una o muchas veces, fenilo
 el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
 5 fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas
 veces, y piridiloxi el cual está substituido o no substituido una vez o
 muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser
 independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
 de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-
 10 alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de
 carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono o
 halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, independientemente uno del otro significan
 15 hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono el cual está
 substituido o no substituido una vez o muchas veces, alcoxi de 1 a 4
 átomos de carbono, siempre que los substituyentes puedan ser
 independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste
 de halógeno, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a
 20 4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono el cual
 está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre
 que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se
 seleccionen del grupo que consiste de halógeno, y alquilo de 1 a 4
 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido
 25 una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser

10+
95

independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

5 R_7 significa hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

 cualquier R_8 significa alquilcarboxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenil-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser
10 independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_8 ; y R_9 significa hidrógeno;

 o R_8 y R_9 juntos significan alquilenos de 1 a 4 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces por alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; siempre que uno o dos
20 átomos de carbono puedan ser reemplazados por oxígeno;

R_9 significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono,
25 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono,

102
97

halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilamino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o piridiloxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono;

W es O o S;

a significa 1, 2, o 3;

15 b significa 0, 1, 2, o 3; y

n es 0 o 1;

30. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Ar significa arilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4

átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono; fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, y
5 fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono y halo-
10 alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, independientemente uno del otro significan hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que
15 los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; o fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes
20 uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

R₇ significa hidrógeno;

25 cualquier R₈ significa alquilcarboxi de 1 a 4 átomos de carbono,

alquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 4 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; fenil-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenil-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientemente uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_6 ; y R_6 significa hidrógeno;

10 o R_6 y R_6 juntos significan alquileno de 1 a 3 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces por metilo, siempre que uno o dos átomos de carbono puedan ser reemplazados por oxígeno;

15 R_6 significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono o alcoxicarbonilo de 20 1 a 4 átomos de carbono;

W significa O;

a significa 1 o 2;

b significa 0, 1, o 2; y

n significa 0.

25 31. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la

reivindicación 1, en donde Ar significa fenilo que está ya sea no
substituido o substituido una o más veces, siempre que los
substituyentes sean independientes uno del otro y se seleccionen del
grupo que consiste de halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono,
5 halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de
carbono, halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono; y fenilcarbonilo el
cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces,
siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del
otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro,
10 ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2
átomos de carbono, alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alcoxi
de 1 a 2 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, independientemente uno del otro significan
15 hidrógeno, o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, el cual está
substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que
los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se
seleccionen del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 2
átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono;

20 R₇ significa hidrógeno;

R₈ significa alquiloxi de 1 a 2 átomos de carbono-alquiloxi de 1
a 2 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 2 átomos de carbono-alquilo
de 1 a 2 átomos de carbono; fenil-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono
el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o
25 fenil-alcoxi de 1 a 2 átomos de carbono el cual está substituido o no

substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_6 ;

R_6 significa hidrógeno;

- 5 R_6 significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxí de 1 a 2 átomos de carbono o halo-alcoxí de 1 a 2 átomos de carbono;

W significa O;

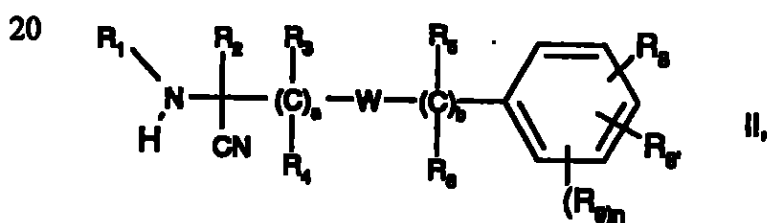
a significa 1;

- 10 b significa 0; y

n es 0.

32. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, que tiene el nombre de N-[1-ciano-1-metil-2-(2-bencil-4-clorofenoxi)-etil]-4-trifluorometoxibenzamida.

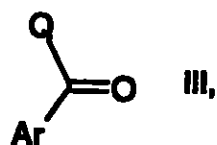
- 15 33. El procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula I, respectivamente en forma libre o en la forma de sal, de acuerdo con la reivindicación 1, siempre que un compuesto de la fórmula



- 25 el cual es conocido o puede ser producido analógicamente a los compuestos correspondientes conocidos, y en donde R_1 , R_2 , R_3 ,

R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , W , a , b , y n se definen como se dan para la fórmula I, se hacen reaccionar con un compuesto de la fórmula correspondiente

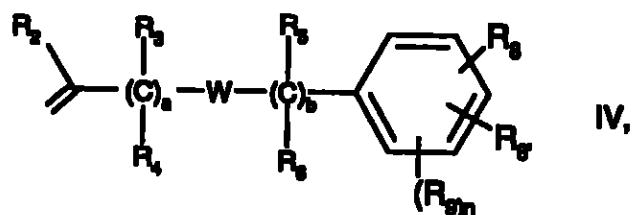
5



el cual es conocido o puede ser preparado analógicamente a lo compuestos conocidos correspondientes, y en donde Ar se define como se da para la fórmula I y Q es un grupo saliente, opcionalmente en presencia de un catalizador básico y si se desea, un compuesto de la fórmula I que se puede obtener de acuerdo con el método o en otra forma, respectivamente en forma libre o forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula I, una mezcla de isómeros que se pueden obtener de acuerdo con el método se separan y el isómero deseado aislado y/o un compuesto libre de la fórmula I que se obtiene de acuerdo con el método se convierte en una sal o una sal de un compuesto de la fórmula I que se obtiene de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula I o en otra sal.

34. El procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula II, respectivamente en forma libre o en la forma de sal, de acuerdo con la reivindicación 2, siempre que un compuesto de la fórmula

25



103
108

el cual es conocido o puede ser producido analógicamente a los compuestos correspondientes conocidos, y en donde R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , W , a , b , y n se definen como en la fórmula I, se hacen reaccionar con un cianuro inorgánico u orgánico y con un compuesto de la fórmula R_9-NH_2 el cual es conocido o puede ser producido analógicamente a compuestos conocidos correspondientes y en donde R_9 se define como para la fórmula I, y si se desea, un compuesto de la fórmula II que se puede obtener de acuerdo con el método o en otra forma, respectivamente en forma libre o en la forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula II, una mezcla de isómeros que se obtienen de acuerdo con el método se separan y el isómero deseado aislado y/o un compuesto libre de la fórmula II se obtiene de acuerdo con el método se convierte en una sal o una sal de un compuesto de la fórmula II que se obtiene de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula II o en otra sal.

35. La composición para el control de parásitos, la cual contiene como ingrediente activo por lo menos un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, además de portadores y/o dispersantes

36. El uso de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en el control de parásitos.

37. El método para controlar parásitos, siempre que una cantidad efectiva de por lo menos un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, se utilice en los parásitos.

~~105~~
104

38. El uso de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en un procedimiento para controlar parásitos en animales de sangre caliente.

39. El uso de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la
5 reivindicación 1, en la preparación de una composición farmacéutica contra parásitos en animales de sangre caliente.

10

15

20

25

PCT

REQUEST

The undersigned requests that the present international application be processed according to the Patent Cooperation Treaty.

For receiving Office use only

International Application No. **PCT/EP 03 / 06 490**International Filing Date **18 JUN 2003** **(18.06.2003)**Name of receiving Office and "PCT International Application"
EUROPEAN PATENT OFFICE
PCT INTERNATIONAL APPLICATIONApplicant's or agent's file reference
(if desired) (12 characters maximum) **H -32531A**

Box No. I TITLE OF INVENTION Organic Compounds	
Box No. II APPLICANT ☐ This person is also inventor	
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)	
Novartis AG Lichtstrasse 35 4056 Basel CH	Telephone No. +41 61 324 11 11 Facsimile No. +41 61 322 75 32 Teleprinter No. Applicant's registration No. with the Office
State (that is, country) of nationality: CH	State (that is, country) of residence: CH
This person is applicant for the purposes of: ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☐ the United States of America only ☒ the States indicated in the Supplemental Box	
Box No. III FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S)	
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)	
Novartis Pharma GmbH Brunner Strasse 59 1230 Vienna AT	This person is: ☒ applicant only ☐ applicant and inventor ☐ inventor only (if this check-box is marked, do not fill in below.) Applicant's registration No. with the Office
State (that is, country) of nationality: AT	State (that is, country) of residence: AT
This person is applicant for the purposes of: ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☐ the United States of America only ☒ the States indicated in the Supplemental Box	
☒ Further applicants and/or (further) inventors are indicated on a continuation sheet.	
Box No. IV AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE; OR ADDRESS FOR CORRESPONDENCE	
The person identified below is hereby/has been appointed to act on behalf of this applicant(s) before the competent International Authorities as: ☒ agent ☐ common representative	
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)	
GRUBB, Philip Novartis AG Corporate Intellectual Property 4002 Basel CH	Telephone No. +41 61 324 11 11 Facsimile No. +41 61 322 75 32 Teleprinter No. Agent's registration No. with the Office
☐ Address for correspondence: Mark this check-box where no agent or common representative is/has been appointed and the space above is used instead to indicate a special address to which correspondence should be sent.	

Continuation of Box No. III FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S) <i>If none of the following sub-boxes is used, this sheet should not be included in the request.</i>	
Name and address: <i>(Family name followed by given names; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</i> DUCRAY, Pierre 8 rue des allés 68128 Village-Neuf FR	This person is: ☐ applicant only ☒ applicant and inventor ☐ inventor only <i>(If this check-box is marked, do not fill in below.)</i> Applicant's registration No. with the Office
State (that is, country) of nationality: FR	State (that is, country) of residence: FR
This person is applicant for the purposes of: ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☒ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box	
Name and address: <i>(Family name followed by given names; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</i> GOEBEL, Thomas Lettenweg 28B 79539 Lörrach DE	This person is: ☐ applicant only ☒ applicant and inventor ☐ inventor only <i>(If this check-box is marked, do not fill in below.)</i> Applicant's registration No. with the Office
State (that is, country) of nationality: DE	State (that is, country) of residence: DE
This person is applicant for the purposes of: ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☒ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box	
Name and address: <i>(Family name followed by given names; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</i> 	This person is: ☐ applicant only ☐ applicant and inventor ☐ inventor only <i>(If this check-box is marked, do not fill in below.)</i> Applicant's registration No. with the Office
State (that is, country) of nationality:	State (that is, country) of residence:
This person is applicant for the purposes of: ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☐ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box	
Name and address: <i>(Family name followed by given names; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</i> 	This person is: ☐ applicant only ☐ applicant and inventor ☐ inventor only <i>(If this check-box is marked, do not fill in below.)</i> Applicant's registration No. with the Office
State (that is, country) of nationality:	State (that is, country) of residence:
This person is applicant for the purposes of: ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☐ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box	
☐ Further applicants and/or (further) inventors are indicated on another continuation sheet.	

12
107

Box No. V DESIGNATION OF STATES

Mark the applicable check-boxes below; at least one must be marked.

The following designations are hereby made under Rule 4.9(a):

Regional Patent

- ☐ AP ARIPO Patent: GH Ghana, GM Gambia, KE Kenya, LS Lesotho, MW Malawi, MZ Mozambique, SD Sudan, SL Sierra Leone, SZ Swaziland, TZ United Republic of Tanzania, UG Uganda, ZM Zambia, ZW Zimbabwe, and any other State which is a Contracting State of the Harare Protocol and of the PCT (if other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line)
- ☒ EA Eurasian Patent: AM Armenia, AZ Azerbaijan, BY Belarus, KG Kyrgyzstan, KZ Kazakhstan, MD Republic of Moldova, RU Russian Federation, TJ Tajikistan, TM Turkmenistan, and any other State which is a Contracting State of the Eurasian Patent Convention and of the PCT
- ☒ EP European Patent: AT Austria, BE Belgium, BG Bulgaria, CH & LI Switzerland and Liechtenstein, CY Cyprus, CZ Czech Republic, DE Germany, DK Denmark, EE Estonia, ES Spain, FI Finland, FR France, GB United Kingdom, GR Greece, IE Ireland, IT Italy, LU Luxembourg, MC Monaco, NL Netherlands, PT Portugal, SE Sweden, SI Slovenia, SK Slovakia, TR Turkey, and any other State which is a Contracting State of the European Patent Convention and of the PCT
- ☐ OA OAPI Patent: BF Burkina Faso, BJ Benin, CF Central African Republic, CG Congo, CI Côte d'Ivoire, CM Cameroon, GA Gabon, GN Guinea, GQ Equatorial Guinea, GW Guinea-Bissau, ML Mali, MR Mauritania, NE Niger, SN Senegal, TD Chad, TG Togo, and any other State which is a member State of OAPI and a Contracting State of the PCT (if other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line)

National Patent (if other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line):

- | | | |
|---|--|---|
| ☒ AE United Arab Emirates | ☐ GM Gambia | ☒ NZ New Zealand |
| ☒ AG Antigua and Barbuda | ☒ HR Croatia | ☒ OM Oman |
| ☒ AL Albania | ☒ HU Hungary | ☒ PH Philippines |
| ☒ AM Armenia | ☒ ID Indonesia | ☒ PL Poland |
| ☒ AT Austria | ☒ IL Israel | ☒ PT Portugal |
| ☒ AU Australia | ☒ IN India | ☒ RO Romania |
| ☒ AZ Azerbaijan | ☒ IS Iceland | ☒ RU Russian Federation |
| ☒ BA Bosnia and Herzegovina | ☒ JP Japan | ☒ SC Seychelles |
| ☒ BB Barbados | ☒ KE Kenya | ☐ SD Sudan |
| ☒ BG Bulgaria | ☒ KG Kyrgyzstan | ☒ SE Sweden |
| ☒ BR Brazil | ☒ KP Democratic People's Republic of Korea | ☒ SG Singapore |
| ☒ BY Belarus | ☒ KR Republic of Korea | ☒ SK Slovakia |
| ☒ BZ Belize | ☒ KZ Kazakhstan | ☐ SL Sierra Leone |
| ☒ CA Canada | ☒ LC Saint Lucia | ☒ TJ Tajikistan |
| ☒ CH & LI Switzerland and Liechtenstein | ☒ LK Sri Lanka | ☒ TM Turkmenistan |
| ☒ CN China | ☐ LR Liberia | ☒ TN Tunisia |
| ☒ CO Colombia | ☐ LS Lesotho | ☒ TR Turkey |
| ☒ CR Costa Rica | ☒ LT Lithuania | ☒ TT Trinidad and Tobago |
| ☒ CU Cuba | ☒ LU Luxembourg | ☐ TZ United Republic of Tanzania |
| ☒ CZ Czech Republic | ☒ LV Latvia | ☒ UA Ukraine |
| ☒ DE Germany | ☒ MA Morocco | ☐ UG Uganda |
| ☒ DK Denmark | ☒ MD Republic of Moldova | ☒ US United States of America |
| ☒ DM Dominica | ☐ MG Madagascar | ☐ UZ Uzbekistan |
| ☒ DZ Algeria | ☒ MK The former Yugoslav Republic of Macedonia | ☒ VC Saint Vincent and the Grenadines |
| ☒ EC Ecuador | ☒ MN Mongolia | ☒ VN Viet Nam |
| ☒ EE Estonia | ☐ MW Malawi | ☒ YU Yugoslavia |
| ☒ ES Spain | ☒ MX Mexico | ☒ ZA South Africa |
| ☒ FI Finland | ☐ MZ Mozambique | ☐ ZM Zambia |
| ☒ GB United Kingdom | ☒ NO Norway | ☒ ZW Zimbabwe |
| ☒ GD Grenada | | |
| ☒ GE Georgia | | |
| ☒ GH Ghana | | |

Check-boxes below reserved for designating States which have become party to the PCT after issuance of this sheet:

- ☒ NI Nicaragua
- ☐ ☐ ☐

Precautionary Designation Statement: In addition to the designations made above, the applicant also makes under Rule 4.9(b) all other designations which would be permitted under the PCT except any designation(s) indicated in the Supplemental Box as being excluded from the scope of this statement. The applicant declares that those additional designations are subject to confirmation and that any designation which is not confirmed before the expiration of 15 months from the priority date is to be regarded as withdrawn by the applicant at the expiration of that time limit. (Confirmation (including fees) must reach the receiving Office within the 15-month time limit.)

Supplemental Box

If the Supplemental Box is not used, this sheet should not be included in the request.

1. If, in any of the Boxes, except Boxes Nos. VIII(i) to (v) for which a special continuation box is provided, the space is insufficient to furnish all the information: in such case, write "Continuation of Box No." (Indicate the number of the Box) and furnish the information in the same manner as required according to the captions of the Box in which the space was insufficient, in particular:

Continuation of Box No. II

Novartis AG is applicant for all designated States with the exception of: AT (Austria) and US (USA)

- (i) If more than two persons are to be indicated as applicants and/or inventors and no "continuation sheet" is available: in such case, write "Continuation of Box No. III" and indicate for each additional person the same type of information as required in Box No. III. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below;

Continuation of Box No. III

Novartis Pharma GmbH is applicant for AT (Austria) only.

- (ii) If, in Box No. II or in any of the sub-boxes of Box No. III, the indication "the States indicated in the Supplemental Box" is checked: in such case, write "Continuation of Box No. II" or "Continuation of Box No. III" or "Continuation of Boxes No. II and No. III" (as the case may be), indicate the name of the applicant(s) involved and, next to (each) such name, the State(s) (and/or, where applicable, ARIPO, Eurasian, European or OAPI patent) for the purposes of which the named person is applicant;

- (iii) If, in Box No. II or in any of the sub-boxes of Box No. III, the inventor or the inventor-applicant is not inventor for the purposes of all designated States or for the purposes of the United States of America: in such case, write "Continuation of Box No. II" or "Continuation of Box No. III" or "Continuation of Boxes No. II and No. III" (as the case may be), indicate the name of the inventor(s) and, next to (each) such name, the State(s) (and/or, where applicable, ARIPO, Eurasian, European or OAPI patent) for the purposes of which the named person is inventor;

- (iv) If, in addition to the agent(s) indicated in Box No. IV, there are further agents: in such case, write "Continuation of Box No. IV" and indicate for each further agent the same type of information as required in Box No. IV;

- (v) If, in Box No. V, the name of any State (or OAPI) is accompanied by the indication "patent of addition," or "certificate of addition," or if, in Box No. V, the name of the United States of America is accompanied by an indication "continuation" or "continuation-in-part": in such case, write "Continuation of Box No. V" and the name of each State involved (or OAPI), and after the name of each such State (or OAPI), the number of the parent title or parent application and the date of grant of the parent title or filing of the parent application;

- (vi) If, in Box No. VI, there are more than five earlier applications whose priority is claimed: in such case, write "Continuation of Box No. VI" and indicate for each additional earlier application the same type of information as required in Box No. VI.

2. If, with regard to the precautionary designation statement contained in Box No. V, the applicant wishes to exclude any State(s) from the scope of that statement: in such case, write "Designation(s) excluded from precautionary designation statement" and indicate the name or two-letter code of each State so excluded.

114
109**Box No. VI PRIORITY CLAIM**

The priority of the following earlier application(s) is hereby claimed:

Filing date of earlier application (day/month/year)	Number of earlier application	Where earlier application is:		
		national application: country or Member of WTO	regional application:* regional Office	international application: receiving Office
item (1) 19 June 2002 (19.06.02)	1047/02	CH		
item (2)				
item (3)				
item (4)				
item (5)				

☐ Further priority claims are indicated in the Supplemental Box.

The receiving Office is requested to prepare and transmit to the International Bureau a certified copy of the earlier application(s) (only if the earlier application was filed with the Office which for the purposes of this international application is the receiving Office) identified above as:

☐ all items ☐ item (1) ☐ item (2) ☐ item (3) ☐ item (4) ☐ item (5) ☐ other, see Supplemental Box

* Where the earlier application is an ARIPO application, indicate at least one country party to the Paris Convention for the Protection of Industrial Property or one Member of the World Trade Organization for which that earlier application was filed (Rule 4.10(b)(II)):

Box No. VII INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

Choice of International Searching Authority (ISA) (if two or more International Searching Authorities are competent to carry out the international search, indicate the Authority chosen; the two-letter code may be used):

ISA /

Request to use results of earlier search; reference to that search (if an earlier search has been carried out by or requested from the International Searching Authority):

Date (day/month/year) Number Country (or regional Office)

Box No. VIII DECLARATIONS

The following declarations are contained in Boxes Nos. VIII (i) to (v) (mark the applicable check-boxes below and indicate in the right column the number of each type of declaration):

Number of
declarations

- | | | |
|---|--|---|
| ☐ Box No. VIII (i) | Declaration as to the identity of the inventor | : |
| ☐ Box No. VIII (ii) | Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to apply for and be granted a patent | : |
| ☐ Box No. VIII (iii) | Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to claim the priority of the earlier application | : |
| ☐ Box No. VIII (iv) | Declaration of inventorship (only for the purposes of the designation of the United States of America) | : |
| ☐ Box No. VIII (v) | Declaration as to non-prejudicial disclosures or exceptions to lack of novelty | : |

Box No. IX CHECK LIST; LANGUAGE OF FILING

This international application contains:

(a) In paper form, the following number of sheets:

request (including declaration sheets) : 6
 description (excluding sequence listings and/or tables related thereto) : 41
 claims : 12
 abstract : 1
 drawings : 0

Sub-total number of sheets : 80

sequence listings :
 tables related thereto :

(for both, actual number of sheets if filed in paper form, whether or not also filed in computer readable form; see (c) below)

Total number of sheets : 80

(b) ☐ only in computer readable form (Section 801(a)(i))(i) ☐ sequence listings(ii) ☐ tables related thereto(c) ☐ also in computer readable form (Section 801(a)(ii))(i) ☐ sequence listings(ii) ☐ tables related thereto

Type and number of carriers (diskette, CD-ROM, CD-R or other) on which are contained the

☐ sequence listings:☐ tables related thereto:

(additional copies to be indicated under items 9(ii) and/or 10(ii), in right column)

This international application is accompanied by the following item(s) (mark the applicable check-boxes below and indicate in right column the number of each item):

- | | | |
|---|---|---|
| 1. ☒ fee calculation sheet | : | 1 |
| 2. ☒ original separate power of attorney | : | 1 |
| 3. ☐ original general power of attorney | : | |
| 4. ☒ copy of general power of attorney; reference number, if any: AV 36671 + 48171 | : | 2 |
| 5. ☐ statement explaining lack of signature | : | |
| 6. ☒ priority document(s) identified in Box No. VI as item(s): (1) | : | 1 |
| 7. ☐ translation of international application into (language): | : | |
| 8. ☐ separate indications concerning deposited microorganism or other biological material | : | |
| 9. ☐ sequence listings in computer readable form (indicate type and number of carriers) | : | |
| (i) ☐ copy submitted for the purposes of international search under Rule 13ter only (and not as part of the international application): | : | |
| (ii) ☐ (only where check-box (b)(i) or (c)(i) is marked in left column) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under Rule 13ter | : | |
| (iii) ☐ together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the sequence listings mentioned in left column | : | |
| 10. ☐ tables in computer readable form related to sequence listings (indicate type and number of carriers) | : | |
| (i) ☐ copy submitted for the purposes of international search under Section 802(b-quater) only (and not as part of the international application) | : | |
| (ii) ☐ (only where check-box (b)(ii) or (c)(ii) is marked in left column) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under Section 802(b-quater) | : | |
| (iii) ☐ together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the tables mentioned in left column | : | |
| 11. ☐ other (specify): | : | |

Figure of the drawings which should accompany the abstract:

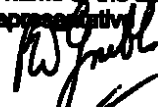
Language of filing of the international application:

English

Box No. X SIGNATURE OF APPLICANT, AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE

Next to each signature, indicate the name of the person signing and the capacity in which the person signs (if such capacity is not obvious from reading the request).

In the name of the applicants
 The representative



02.06.2003

GRUBB, Philip AV 36671 + 48171

For receiving Office use only

1. Date of actual receipt of the purported international application:	18 JUN 2003 (18.06.03)	2. Drawings: ☐ received: ☐ not received:
3. Corrected date of actual receipt due to later but timely received papers or drawings completing the purported international application:		
4. Date of timely receipt of the required corrections under PCT Article 11(2):		
5. International Searching Authority (if two or more are competent): ISA /	6. ☐ Transmittal of search copy delayed until search fee is paid	

For International Bureau use only

Date of receipt of the record copy by the International Bureau:

116
111

**(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA DE ACUERDO CON EL TRATADO DE
COOPERACION DE PATENTES (PCT)**

(19) Organización de la Propiedad Intelectual Mundial
Oficina Internacional



(43) Fecha de Publicación Internacional
31 de Diciembre del 2003 (31.12.2003)

(10) Número de Publicación Internacional
WO 03/039544 A1

PCT

(51) Clasificación de Patente Inter.: C07C 255/29, 323/20, C07D 307/86, A61K 31/277, 31/343, 31/36, A61P 33/14, 33/10, A01N, 39/02

(74) Agente: GRUBB, Philip; NOVARTIS AG, Corporate Intellectual Property, CH-4002 Basel (CH).

(21) Número de Solicitud Inter.: PCT/EP2003/0006490

(22) Fecha de Presentación Inter.: 18 de Junio del 2003 (18.06.2003)

(25) Idioma de Presentación:

Inglés

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

(26) Idioma de Publicación:

Inglés

(84) Estados Designados (regional): patente Eurasíática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM). Patente Europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR).

(30) Datos de Prioridad:

1047/02 19 de Junio del 2002 (19.06.2002)

CH

(71) Solicitante (para todos los Estados designados excepto AT, US): NOVARTIS AG [CH/CH]; Lichstrasse 35, CH-4056 Basel (CH).

Publicada:

- Con Informe de búsqueda internacional
- Antes del término del límite de tiempo para enmendar las reivindicaciones y para volver a publicar en caso de recibir las enmiendas.

(71) Solicitante (sólo para AT): NOVARTIS PHARMA GMBH [AT/AT]; Brunner Strasse 59, A-1230 Vienna (AT).

(88) Fecha de publicación del informe de búsqueda Inter.:
19 de Febrero del 2004

(72) Inventores: y

(75) Inventores/Solicitantes: DUCRAY, Pierre [FR/FR]; 8, rue des halléas, F-68128 Village-Neuf (FR). GOEBEL, Thomas [DE/DE]; Lettenweg 28B, 79539 Lörrach (DE).

Para códigos de dos letras y otras abreviaturas, hacer referencia a "Notas de Guía sobre Códigos y Abreviaturas" que aparece al principio de cada emisión regular de la Gaceta del PCT.

(54) Título: DERIVADOS DE ACETONITRILLO ADECUADOS PARA CONTROLAR PARASITOS

(57) Resumen:

La invención se refiere a compuestos de la fórmula general (I), en donde R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, W, a, b, y n tienen la importancia dada en la reivindicación 1, y opcionalmente los enantiómeros de los mismos. Los ingredientes activos tienen propiedades pesticidas ventajosas. Son especialmente adecuados para controlar los parásitos en animales de sangre caliente.

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
31 December 2003 (31.12.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2004/000793 A3

(51) International Patent Classification²: C07C 255/29,
323/20, C07D 307/86, 317/64, A61K 31/277, 31/343,
31/36, A61P 33/14, 33/10, A01N 39/02

(74) Agent: GRUBB, Phillip; Novartis AG, Corporate Intel-
lectual Property, CH-4002 Basel (CH).

(21) International Application Number:
PCT/EP2003/006490

(81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GR, GH,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LT, LU, LV, MA, MD, MK, MN, MX, NI, NO, NZ, OM,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SE, SG, SK, TJ, TM, TN, TR,
TT, UA, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZW.

(22) International Filing Date: 18 June 2003 (18.06.2003)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(84) Designated States (*regional*): Eurasian patent (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

(30) Priority Data:
1047/02 19 June 2002 (19.06.2002) CH

(71) Applicant (*for all designated States except AT, US*): NO-
VARTIS AG [CH/CH]; Lichtstrasse 35, CH-4056 Basel
(CH).

Published:

- with International search report
- before the expiration of the time limits for amending the
claims and to be republished in the event of receipt of
amendments

(71) Applicant (*for AT only*): NOVARTIS PHARMA GMBH
[AT/AT]; Brunner Strasse 59, A-1230 Vienna (AT).

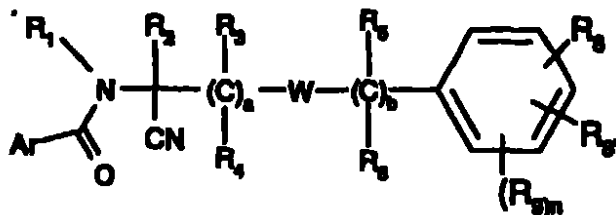
(88) Date of publication of the International search report:
19 February 2004

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (*for US only*): DUCRAY, Pierre
[FR/FR]; 8, rue des aliés, F-68128 Village-Neuf (FR).
GOEBEL, Thomas [DE/DE]; Lettenweg 28B, 79539
Lörrach (DE).

*For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.*

(54) Title: AMINOACETONITRILE DERIVATIVES SUITABLE FOR CONTROLLING PARASITES



(57) Abstract: The invention relates to compounds of
the general formula (I), wherein R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆,
R₇, R₈, R₉, W, a, b and n have the significances given
in claim 1, and optionally the enantiomers thereof. The
active ingredients have advantageous pesticidal proper-
ties. They are especially suitable for controlling parasites
on warm-blooded animals.

PCT

From the INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF
THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT
OR THE DECLARATION

(PCT Rule 44.1)

To: NOVARTIS AG Corporate Intellectual Property Attn. Grubb, Philip CH-4002 Basel SWITZERLAND		Corporate Intellectual Property 10. Dez. 2003			
APPL.	M/D	F/L	PS	Copy:	Date of mailing (day/month/year)
					11/12/2003
Applicant's or agent's file reference H-32531A					FOR FURTHER ACTION See paragraphs 1 and 4 below
International application No. PCT/EP 03/06490					International filing date (day/month/year) 18/06/2003
Applicant NOVARTIS AG					

1. ☒ The applicant is hereby notified that the International Search Report has been established and is transmitted herewith.

Filing of amendments and statement under Article 18:

The applicant is entitled, if he so wishes, to amend the claims of the International Application (see Rule 46):

When? The time limit for filing such amendments is normally 2 months from the date of transmittal of the International Search Report; however, for more details, see the notes on the accompanying sheet.

Where? Directly to the International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland
Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

For more detailed instructions, see the notes on the accompanying sheet.

2. ☐ The applicant is hereby notified that no International Search Report will be established and that the declaration under Article 17(2)(a) to that effect is transmitted herewith.

3. ☐ With regard to the protest against payment of (an) additional fee(s) under Rule 40.2, the applicant is notified that:

☐ the protest together with the decision thereon has been transmitted to the International Bureau together with the applicant's request to forward the texts of both the protest and the decision thereon to the designated Offices.

☐ no decision has been made yet on the protest; the applicant will be notified as soon as a decision is made.

4. **Further action(s):** The applicant is reminded of the following:

Shortly after 18 months from the priority date, the international application will be published by the International Bureau. If the applicant wishes to avoid or postpone publication, a notice of withdrawal of the international application, or of the priority claim, must reach the International Bureau as provided in Rules 90bis.1 and 90bis.3, respectively, before the completion of the technical preparations for international publication.

Within 19 months from the priority date, a demand for international preliminary examination must be filed if the applicant wishes to postpone the entry into the national phase until 30 months from the priority date (in some Offices even later).

Within 20 months from the priority date, the applicant must perform the prescribed acts for entry into the national phase before all designated Offices which have not been elected in the demand or in a later election within 19 months from the priority date or could not be elected because they are not bound by Chapter II.

Name and mailing address of the International Searching Authority  European Patent Office, P.B. 5818 Patentaan 2 NL-2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 851 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer Kerstin G^tz
---	------------------------------------

NOTES TO FORM PCT/ISA/220

These Notes are intended to give the basic instructions concerning the filing of amendments under article 19. The Notes are based on the requirements of the Patent Cooperation Treaty, the Regulations and the Administrative Instructions under that Treaty. In case of discrepancy between these Notes and those requirements, the latter are applicable. For more detailed information, see also the PCT Applicant's Guide, a publication of WIPO.

In these Notes, "Article", "Rule", and "Section" refer to the provisions of the PCT, the PCT Regulations and the PCT Administrative Instructions respectively.

INSTRUCTIONS CONCERNING AMENDMENTS UNDER ARTICLE 19

The applicant has, after having received the international search report, one opportunity to amend the claims of the international application. It should however be emphasized that, since all parts of the international application (claims, description and drawings) may be amended during the international preliminary examination procedure, there is usually no need to file amendments of the claims under Article 19 except where, e.g. the applicant wants the letter to be published for the purposes of provisional protection or has another reason for amending the claims before international publication. Furthermore, it should be emphasized that provisional protection is available in some States only.

What parts of the international application may be amended?

Under Article 19, only the claims may be amended.

During the international phase, the claims may also be amended (or further amended) under Article 34 before the International Preliminary Examining Authority. The description and drawings may only be amended under Article 34 before the International Examining Authority.

Upon entry into the national phase, all parts of the international application may be amended under Article 25 or, where applicable, Article 41.

When?

Within 2 months from the date of transmittal of the international search report or 16 months from the priority date, whichever time limit expires later. It should be noted, however, that the amendments will be considered as having been received on time if they are received by the International Bureau after the expiration of the applicable time limit but before the completion of the technical preparations for international publication (Rule 46.1).

Where not to file the amendments?

The amendments may only be filed with the International Bureau and not with the receiving Office or the International Searching Authority (Rule 46.2).

Where a demand for international preliminary examination has been/is filed, see below.

How?

Either by cancelling one or more entire claims, by adding one or more new claims or by amending the text of one or more of the claims as filed.

A replacement sheet must be submitted for each sheet of the claims which, on account of an amendment or amendments, differs from the sheet originally filed.

All the claims appearing on a replacement sheet must be numbered in Arabic numerals. Where a claim is cancelled, no renumbering of the other claims is required. In all cases where claims are renumbered, they must be renumbered consecutively (Administrative Instructions, Section 205(b)).

The amendments must be made in the language in which the international application is to be published.

What documents must/may accompany the amendments?

Letter (Section 205(b)):

The amendments must be submitted with a letter.

The letter will not be published with the international application and the amended claims. It should not be confused with the "Statement under Article 19(1)" (see below, under "Statement under Article 19(1)").

The letter must be in English or French, at the choice of the applicant. However, if the language of the international application is English, the letter must be in English; if the language of the international application is French, the letter must be in French.

The letter must indicate the differences between the claims as filed and the claims as amended. It must, in particular, indicate, in connection with each claim appearing in the international application (it being understood that identical indications concerning several claims may be grouped), whether

- (i) the claim is unchanged;
- (ii) the claim is cancelled;
- (iii) the claim is new;
- (iv) the claim replaces one or more claims as filed;
- (v) the claim is the result of the division of a claim as filed.

The following examples illustrate the manner in which amendments must be explained in the accompanying letter:

1. [Where originally there were 48 claims and after amendment of some claims there are 51]:
"Claims 1 to 28, 31, 32, 34, 35, 37 to 48 replaced by amended claims bearing the same numbers; claims 30, 33 and 36 unchanged; new claims 49 to 51 added."
2. [Where originally there were 15 claims and after amendment of all claims there are 11]:
"Claims 1 to 15 replaced by amended claims 1 to 11."
3. [Where originally there were 14 claims and the amendments consist in cancelling some claims and in adding new claims]:
"Claims 1 to 6 and 14 unchanged; claims 7 to 13 cancelled; new claims 15, 16 and 17 added." or
"Claims 7 to 13 cancelled; new claims 15, 16 and 17 added; all other claims unchanged."
4. [Where various kinds of amendments are made]:
"Claims 1-10 unchanged; claims 11 to 13, 16 and 19 cancelled; claims 14, 15 and 18 replaced by amended claim 14; claim 17 subdivided into amended claims 15, 16 and 17; new claims 20 and 21 added."

"Statement under article 19(1)" (Rule 48.4)

The amendments may be accompanied by a statement explaining the amendments and indicating any impact that such amendments might have on the description and the drawings (which cannot be amended under Article 19(1)).

The statement will be published with the international application and the amended claims.

It must be in the language in which the international application is to be published.

It must be brief, not exceeding 500 words if in English or if translated into English.

It should not be confused with and does not replace the letter indicating the differences between the claims as filed and as amended. It must be filed on a separate sheet and must be identified as such by a heading, preferably by using the words "Statement under Article 19(1)."

It may not contain any disparaging comments on the international search report or the relevance of citations contained in that report. Reference to citations, relevant to a given claim, contained in the international search report may be made only in connection with an amendment of that claim.

Consequence if a demand for international preliminary examination has already been filed

If, at the time of filing any amendments under Article 19, a demand for international preliminary examination has already been submitted, the applicant must preferably, at the same time of filing the amendments with the International Bureau, also file a copy of such amendments with the International Preliminary Examining Authority (see Rule 62.2(a), first sentence).

Consequence with regard to translation of the international application for entry into the national phase

The applicant's attention is drawn to the fact that, where upon entry into the national phase, a translation of the claims as amended under Article 19 may have to be furnished to the designated/elected Offices, instead of, or in addition to, the translation of the claims as filed.

For further details on the requirements of each designated/elected Office, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

Applicant's or agent's file reference H-32531A	FOR FURTHER ACTION see Notification of Transmittal of International Search Report (Form PCT/ISA/220) as well as, where applicable, Item 5 below.	
International application No. PCT/EP 03/06490	International filing date (day/month/year) 18/06/2003	(Earliest) Priority Date (day/month/year) 19/06/2002
Applicant NOVARTIS AG		

This International Search Report has been prepared by this International Searching Authority and is transmitted to the applicant according to Article 18. A copy is being transmitted to the International Bureau.

This International Search Report consists of a total of 4 sheets.



It is also accompanied by a copy of each prior art document cited in this report.

1. Basis of the report

- a. With regard to the language, the international search was carried out on the basis of the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.



the international search was carried out on the basis of a translation of the international application furnished to this Authority (Rule 23.1(b)).

- b. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international search was carried out on the basis of the sequence listing:



contained in the international application in written form.



filed together with the international application in computer readable form.



furnished subsequently to this Authority in written form.



furnished subsequently to this Authority in computer readable form.



the statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.



the statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished

2. ☒ Certain claims were found unsearchable (See Box I).

3. ☐ Unity of invention is lacking (see Box II).

4. With regard to the title,

the text is approved as submitted by the applicant.



the text has been established by this Authority to read as follows:

AMINOACETONITRILE DERIVATIVES SUITABLE FOR CONTROLLING PARASITES

5. With regard to the abstract,

the text is approved as submitted by the applicant.



the text has been established, according to Rule 38.2(b), by this Authority as it appears in Box III. The applicant may, within one month from the date of mailing of this international search report, submit comments to this Authority.

6. The figure of the drawings to be published with the abstract is Figure No.

as suggested by the applicant.



because the applicant failed to suggest a figure.



because this figure better characterizes the invention.



None of the figures.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/06490

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07C255/29 C07C323/20 C07D307/86 C07D317/64 A61K31/277
A61K31/343 A61K31/36 A61P33/14 A61P33/10 A01N39/02

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07C C07D A61K A61P A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data bases consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

WPI Data, EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 953 565 A (NIHON NOHYAKU CO LTD) 3 November 1999 (1999-11-03) cited in the application page 49, line 7 - line 46; claims 1-4 page 5, line 20 -page 8, line 11	1-14, 16-30, 33-37
E	WO 03 080577 A (NOVARTIS PHARMA GMBH ;NOVARTIS AG (CH); GOEBEL THOMAS (DE); DUCRAY) 2 October 2003 (2003-10-02) page 4, line 5 - line 8; claims 1-29 page 14, line 5 -page 16, last line	1-12, 16-30, 33-39

☐ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E" earlier document but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

3 December 2003

Date of mailing of the international search report

11/12/2003

Name and mailing address of the ISA

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

Authorized officer

Seufert, G

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP 03/06490

118

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 1 of first sheet)

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
Although claims 36-38 are directed to a method of treatment of the human/animal body, the search has been carried out and based on the alleged effects of the compound/composition.
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/06490

119

124

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0953565	A	03-11-1999	AU 752112 B2	05-09-2002
			AU 2602799 A	11-11-1999
			CN 1234177 A	10-11-1999
			EP 0953565 A2	03-11-1999
			JP 2000026392 A	25-01-2000
			US 6239077 B1	29-05-2001
WO 03080577	A	02-10-2003	WO 03080577 A2	02-10-2003

120 125 1C

The demand must be filed directly with the competent International Preliminary Examining Authority or, if two or more Authorities are competent, with the one chosen by the applicant. The full name or two-letter code of that Authority may be indicated by the applicant on the line below:

IPEA/ _____

PCT

CHAPTER II

DEMAND

under Article 31 of the Patent Cooperation Treaty:
The undersigned requests that the international application specified below be the subject of international preliminary examination according to the Patent Cooperation Treaty and hereby elects all eligible States (except where otherwise indicated).

For International Preliminary Examining Authority use only			
Identification of IPEA		Date of receipt of DEMAND	
Box No. I IDENTIFICATION OF THE INTERNATIONAL APPLICATION		Applicant's or agent's file reference H -32531A	
International application No. PCT/EP 03/06490	International filing date (day/month/year) 18 June 2003 (18.06.03)	(Earliest) Priority date (day/month/year) 19 June 2002 (19.06.02)	
Title of invention Organic Compounds			
Box No. II APPLICANT(S)			
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.) Novartis AG Lichtstrasse 35 4056 Basel CH		Telephone No. +4161 324 11 11	
		Facsimile No. +4161 322 75 32	
		Teleprinter No.	
		Applicant's registration No. with the Office	
State (that is, country) of nationality: CH		State (that is, country) of residence: CH	
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.) Novartis Pharma GmbH Brunner Strasse 59 1230 Vienna AT			
State (that is, country) of nationality: AT		State (that is, country) of residence: AT	
Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.) DUCRAY, Pierre 8 rue des alliés 68128 Village-Neuf FR			
State (that is, country) of nationality: FR		State (that is, country) of residence: FR	
☒ Further applicants are indicated on a continuation sheet.			

121 126

Sheet No. 2.

International application No.
PCT/EP 03/08490

Continuation of Box No. II APPLICANT(S)

If none of the following sub-boxes is used, this sheet should not be included in the demand.

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)

GOEBEL, Thomas
Letteweg 28B
79539 Lörrach
DE

State (that is, country) of nationality:
DE

State (that is, country) of residence:
DE

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)

State (that is, country) of nationality:

State (that is, country) of residence:

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)

State (that is, country) of nationality:

State (that is, country) of residence:

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)

State (that is, country) of nationality:

State (that is, country) of residence:

☐ Further applicants are indicated on another continuation sheet.

Box No. III AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE; OR ADDRESS FOR CORRESPONDENCEThe following person is ☒ agent ☐ common representativeand ☐ has been appointed earlier and represents the applicant(s) also for international preliminary examination.☐ is hereby appointed and any earlier appointment of (an) agent(s)/common representative is hereby revoked.☒ is hereby appointed, specifically for the procedure before the International Preliminary Examining Authority, in addition to the agent(s)/common representative appointed earlier.Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation.
The address must include postal code and name of country.)GRUBB, Philip
Novartis AG
Corporate Intellectual Property
4002 Basel
CH

Telephone No.

+4161 324 11 11

Facsimile No.

+4161 322 75 32

Teleprinter No.

Agent's registration No. with the Office

☐ Address for correspondences: Mark this check-box where no agent or common representative is/has been appointed and the space above is used instead to indicate a special address to which correspondence should be sent.**Box No. IV BASIS FOR INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION**

Statement concerning amendments:*

1. The applicant wishes the international preliminary examination to start on the basis of:

☒ the international application as originally filedthe description ☐ as originally filed☐ as amended under Article 34the claims ☐ as originally filed☐ as amended under Article 19 (together with any accompanying statement)☐ as amended under Article 34the drawings ☐ as originally filed☐ as amended under Article 342. ☐ The applicant wishes any amendment to the claims under Article 19 to be considered as reversed.3. ☐ The applicant wishes the start of the international preliminary examination to be postponed until the expiration of 20 months from the priority date unless the International Preliminary Examining Authority receives a copy of any amendments made under Article 19 or a notice from the applicant that he does not wish to make such amendments (Rule 69.1(d)). (This check-box may be marked only where the time limit under Article 19 has not yet expired.)

* Where no check-box is marked, international preliminary examination will start on the basis of the international application as originally filed or, where a copy of amendments to the claims under Article 19 and/or amendments of the international application under Article 34 are received by the International Preliminary Examining Authority before it has begun to draw up a written opinion or the international preliminary examination report, as so amended.

Language for the purposes of international preliminary examination: English

☒ which is the language in which the international application was filed.☐ which is the language of a translation furnished for the purposes of international search.☒ which is the language of publication of the international application.☐ which is the language of the translation (to be) furnished for the purposes of international preliminary examination.**Box No. V ELECTION OF STATES**

The applicant hereby elects all eligible States (that is, all States which have been designated and which are bound by Chapter II of the PCT)

excluding the following States which the applicant wishes not to elect:

123
+28

Box No. VI CHECK LIST

The demand is accompanied by the following elements, in the language referred to in Box No. IV, for the purposes of international preliminary examination:

- | | | |
|--|---|--------|
| 1. translation of international application | : | sheets |
| 2. amendments under Article 34 | : | sheets |
| 3. copy (or, where required, translation) of amendments under Article 19 | : | sheets |
| 4. copy (or, where required, translation) of statement under Article 19 | : | sheets |
| 5. letter | : | sheets |
| 6. other (specify) | : | sheets |

For International Preliminary
Examining Authority use only

- | received | not received |
|--------------------------|--------------------------|
| ☐ | ☐ |
| ☐ | ☐ |
| ☐ | ☐ |
| ☐ | ☐ |
| ☐ | ☐ |
| ☐ | ☐ |

The demand is also accompanied by the item(s) marked below:

- | | |
|--|---|
| 1. ☒ fee calculation sheet | 5. ☐ statement explaining lack of signature |
| 2. ☐ original separate power of attorney | 6. ☐ sequence listings in computer readable form |
| 3. ☐ original general power of attorney | 7. ☐ tables in computer readable form related to sequence listings |
| 4. ☐ copy of general power of attorney; reference number, if any: | 8. ☐ other (specify): |

Box No. VII SIGNATURE OF APPLICANT, AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE

Next to each signature, indicate the name of the person signing and the capacity in which the person signs (if such capacity is not obvious from reading the demand).

In the name of the applicants
The representative



16.12.2003

GRUBB, Philip AV 36671 + 46171

For International Preliminary Examining Authority use only

1. Date of actual receipt of DEMAND:

2. Adjusted date of receipt of demand due to CORRECTIONS under Rule 60.1(b):

3. ☐ The date of receipt of the demand is AFTER the expiration of 19 months from the priority date and item 4 or 5, below, does not apply.☐ The applicant has been informed accordingly.4. ☐ The date of receipt of the demand is WITHIN the period of 19 months from the priority date as extended by virtue of Rule 80.5.5. ☐ Although the date of receipt of the demand is after the expiration of 19 months from the priority date, the delay in arrival is EXCUSED pursuant to Rule 82.

For International Bureau use only

Demand received from IPEA on:

PATENT COOPERATION TREATY

10. Mai 2004				
F/F	M/D	F/L	PS	Copy

From the
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

PCT

124

To:

GRUBB, Philip
NOVARTIS AG
Corporate Intellectual Property
CH-4002 Basel
SUISSE

NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF
INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT

(PCT Rule 71.1)

Date of mailing
(day/month/year) 06/05/2004Applicant's or agent's file reference
H-32531A

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/EP03/06490

International filing date (day/month/year)

18/06/2003

Priority date (day/month/year)

19/06/2002

Applicant

NOVARTIS AG et al.

1. The applicant is hereby notified that this International Preliminary Examining Authority transmits herewith the international preliminary examination report and its annexes, if any, established on the international application.
2. A copy of the report and its annexes, if any, is being transmitted to the International Bureau for communication to all the elected Offices.
3. Where required by any of the elected Offices, the International Bureau will prepare an English translation of the report (but not of any annexes) and will transmit such translation to those Offices.

4. REMINDER

The applicant must enter the national phase before each elected Office by performing certain acts (filing translations and paying national fees) within 30 months from the priority date (or later in some Offices)(Article 39(1))(see also the reminder sent by the International Bureau with Form PCT/IB/301).

Where a translation of the international application must be furnished to an elected Office, that translation must contain a translation of any annexes to the international preliminary examination report. It is the applicant's responsibility to prepare and furnish such translation directly to each elected Office concerned.

For further details on the applicable time limits and requirements of the elected Offices, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

The applicant's attention is drawn to Article 33(5), which provides that the criteria of novelty, inventive step and industrial applicability described in Article 33(2) to (4) merely serve the purposes of international preliminary examination and that "any Contracting State may apply additional or different criteria for the purposes of deciding whether, in that State, the claimed inventions is patentable or not" (see also Article 27(5)). Such additional criteria may relate, for example, to exemptions from patentability, requirements for enabling disclosure, clarity and support for the claims.

Name and mailing address of the IPEA/



European Patent Office
D-80298 Munich
Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d
Fax: (+49-89) 2399-4465

Authorized officer

PITTORRU R
Tel. (+49-89) 2399 2828



INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

(Rationalised Report according to the Notice of the President of the EPO published in the OJ11/2001)

Applicant's or agent's file reference H-32531A	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP03/06490	International filing date (day/month/year) 18/06/2003	Priority date (day/month/year) 19/06/2002
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC G07C255/29		
Applicant NOVARTIS AG et al.		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 2 sheets, including this cover sheet.
- ☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 807 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consists of a total of _____ sheets.

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

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

Date of submission of the demand 18/12/2003	Date of completion of this report 29/04/2004
Name and mailing address of the IPEA/  European Patent Office D-80298 Munich Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epma d Fax: (+49-89) 2399-4465	Authorized officer JONES M H Tel. (+49-89) 2399 2828

Form PCT/IPEA/409 (cover sheet) P20476 (October 2002)



131
126

I. Basis of the report

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

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

The question of whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step, or to be industrially applicable has not been the subject of the international preliminary examination in respect of the claims which have not been searched (Article 17(2)(a) or (3) and Rule 66.1(e) PCT); see also international search report).

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

To the extent that the international preliminary examination has been carried out (see item III above), the following is pointed out:

In light of the documents cited in the international search report, it is considered that the invention as defined in at least some of the claims, which have been the subject of an international search report, does not appear to meet the criteria mentioned in Article 33(1) PCT, i.e. does not appear to be novel and/or to involve an inventive step (see international search report, in particular the documents cited X and/or Y and corresponding claim references).

09.04.2004
H-32531A
Rudolf Naef

OFFACT
PCT
EP03/06490

Corporate Intellectual Property

11. Feb. 2004

APPL M/D F/L PS Copy

From the
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

PCT

credit 127

To:

GRUBB, Philip
NOVARTIS AG
Corporate Intellectual Property
CH-4002 Basel
SUISSE

WRITTEN OPINION

(PCT Rule 66)

Date of mailing
(day/month/year) 09/02/2004

Applicant's or agent's file reference
H-32531A

REPLY DUE
within 2 / 00 months/days
from the above date of mailing

International application No.

PCT/EP03/06490

International filing date (day/month/year)

18/06/2003

Priority date (day/month/year)

19/06/2002

International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC

G07C255/29

Applicant

NOVARTIS AG et al.

1. This written opinion is the first drawn up by this International Preliminary Examining Authority.

2. This opinion contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the opinion
- II ☐ Priority
- III ☒ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Rule 66.2(a)(ii) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

3. The applicant is hereby invited to reply to this opinion.

When? See the time limit indicated above. The applicant may, before the expiration of that time limit, request this Authority to grant an extension, see Rule 66.2(d).

How? By submitting a written reply, accompanied, where appropriate, by amendments, according to Rule 66.3.
For the form and the language of the amendments, see Rules 66.8 and 66.9.

Also For an additional opportunity to submit amendments, see Rule 66.4.
For the examiner's obligation to consider amendments and/or arguments, see Rule 66.4bis.
For an informal communication with the examiner, see Rule 66.6.

If no reply is filed, the international preliminary examination report will be established on the basis of this opinion.

4. The final date by which the international preliminary examination report must be established according to Rule 69.2 is: 19/10/2004

Name and mailing address of the IPEA/

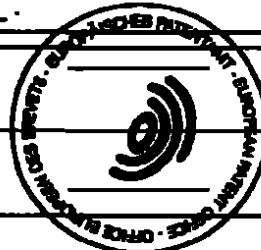


European Patent Office
D-80298 Munich
Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d
Fax: (+49-89) 2399-4465

Authorized officer

Examiner

Formalities officer
(incl. extension of time limits)
Tel. (+49-89) 2399 2828



I. Basis of the opinion

The basis of this written opinion is the application as originally filed.

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

The question of whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step, or to be industrially applicable has not been and will not be the subject of the international preliminary examination in respect of the claims which have not been searched (Article 17(2)(a) or (3) and Rule 66.1(e) PCT; see also international search report).

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

1. To the extent that the international preliminary examination has been carried out (see item III above), the following is pointed out:
2. In light of the documents cited in the international search report, it is considered that the invention as defined in at least some of the claims, which have been the subject of an international search report, does not appear to meet the criteria mentioned in Article 33(1) PCT, i.e. does not appear to be novel and/or to involve an inventive step (see international search report, in particular the documents cited X and/or Y and corresponding claim references).
3. If amendments are filed, the applicant should comply with the requirements of Rule 66.8 PCT and indicate the basis of the amendments in the documents of the application as originally filed (Article 34 (2) (b) PCT) otherwise these amendments may not be taken into consideration for the establishment of the international preliminary examination report. The attention of the applicant is drawn to the fact that if the application contains an unnecessary plurality of independent claims, no examination of any of the claims will be carried out.

NB: Should the applicant decide to request detailed substantive examination, then an international preliminary examination report will normally be established directly. Exceptionally the examiner may draw up a second written opinion, should this be explicitly requested.

129 134

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL
TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION	()	()
MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
- Descripción de la invención.	()	()
- Dibujos de ser estos pertinentes.	()	()
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()
DISEÑO INDUSTRIAL ()		
- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.	()	()
- Representación gráfica o fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()
ESQUEMA DE TRAZADO ()		
- Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud.	()	()
- Representación gráfica del esquema de trazado	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()

Firma Responsable:



Fecha:

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

MANTENIMIENTO DE PROTOCOLOS

Número : 17398

Fecha : 16/04/1997

Conferido: NOVARTIS AG (NOVARTIS SA) (NOVARTIS INC.)

Pais : CH SUIZA

Ciudad : 3 BASILEA

Represent: S Sustituir : S Desistir : S

No. Radicación : 97 19953 Clase: 0 Seev: 0 Seac: 0

scncia	Codigo	Ctr	Nombre
1	5376		ESCOBAR URIBE JIMENA
2	267		ESCOBAR URIBE IGNACIO

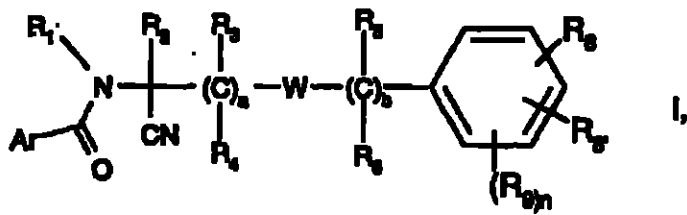
Encontrados (1/1) registro(s)

131 136-5

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud: 05-3903. (22) Fecha de solicitud: 19/01/2005. (30) Prioridad SUIZA (31) No. Prioridad 1047/02 (32) Fecha 19/06/02 (33) País CH		(51) Int Cl: C07C 255/29 A61K31/277; 31/343 (71) Solicitante(s) NOVARTIS AG. 31/36 A61P33/A A61P33/10 (72) Inventor(es) DUCRAY, Pierre // GOEBEL, Thomas // (74) Agente: JIMENA ESCOBAR URIBE	
(85) Fecha inicio fase nacional: 19/01/2005. (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: Fecha 18/06/03 No. de solicitud PCT/EP2003/006490		(87) Publicación Internacional Fecha: Fecha (dd/mm/aa) N° publicación: WO 03/039544 A1 de 31/12/03 WO 2004/000793 A3 de 31/12/03	
(54) Título: DERIVADOS DE ACETONITRILO ADECUADOS PARA CONTROLAR PARASITOS.			

Reivindicación(es):

1. Un compuesto de la fórmula



Ar significa arilo o hetarilo, el cual es no sustituido o sustituido una o muchas veces, por lo cual los sustituyentes pueden ser independientes uno del otro y se seleccionan del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquínilo 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilamino de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiltio de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilamino de 1 a 6 átomos de

137
132

carbono, alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenilamino el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, arilsulfonilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilmetoximino el cual está no substituido o substituido una o muchas veces; fenilhidroximetilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilclorometilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilcianometilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenoxi el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, fenilacetilenilo el cual está no substituido o substituido una o muchas veces y piridiloxi el cual está no substituido o substituido una o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono y di-alquillamino de 1 a 6 átomos de carbono;

R₁ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o alcoximetilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R₂, R₃, R₄, R₅, y R₆, son ya sea, independientemente uno del otro, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionan del grupo que consiste de halógeno, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono y halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido

138 7
133

una vez o muchas veces, siempre que los sustituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno y alquilo de 1 a 6 átomos de carbono; o fenilo el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas, siempre que los sustituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, clano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquillamino de 1 a 6 átomos de carbono, o di-alquillamino de 1 a 6 átomos de carbono;

o R₂ y R₃ juntos significan alquilenos de 2 a 6 átomos de carbono;

R₇ significa hidrógeno o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

cualquier R₈ significa fenilcarbonilo el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, fenoxycarbonilo el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, benciloxycarbonilo el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, fenil-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, fenoxi-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, fenil-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, hetariloxycarbonilo el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, alquilcarboxi de 1 a 6 átomos de carbono; fenilcarboxi el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, bencilcarboxi el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, fenilcarboxamido el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, alquilcarboxamido, alquiloxycarboxamido de 1 a 6 átomos de carbono; feniloxycarboxamido el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenilaminocarboxi el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, feniloxycarboxi, el cual está no sustituido o sustituido una o muchas veces, fenilaminocarboxamido el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono-alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono, hidroxi-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiloxi de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquillaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, (alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)₂aminocarbonilo; fenilaminocarbonilo el cual está sustituido o no sustituido una vez o muchas veces, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1

a 6 átomos de carbono, feniltio-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilmetoxilmino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilhidroximetilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilclorometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o fenilcianometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de R_1 ; y R_2 significa hidrógeno;

o R_1 y R_2 juntos significan alquieno de 1 a 4 átomos de carbono el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces a través de alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, siempre que uno o dos átomos de carbono pueden ser reemplazados por oxígeno;

R_3 significa halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxi de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilamino de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquiltio de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniloxi de 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfoniloxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alqueniltio de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, halo-alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di-alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenilamino el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcarbonilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilmetoxilmino el cual está

140 9
135

substituido o no substituido una vez o muchas veces; fenilhidroximetilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, 1-fenil-1-hidroxietilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilclorometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilcianometilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenoxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, feniltio el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, fenilacetilenilo el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, o piridiloxi el cual está substituido o no substituido una vez o muchas veces, siempre que los substituyentes puedan ser independientes uno del otro y se seleccionen del grupo que consiste de halógeno, nitro, clano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alcoxi de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquiltio de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, y halo-alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono;

W significa O, S, S(O)₂ o N(R₇);

a significa 1, 2, 3, o 4;

b significa 0, 1, 2, 3, o 4; y

n es 0, 1, 2, o 3;

2020
Bogotá D C

Doctor(a)
JIMENA ESCOBAR URIBE
Apoderado(a)
NOVARTIS AG

Oficio N°
11971

ASUNTO:

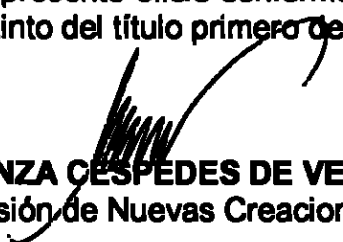
Radicación N°	05 - 3903
Solicitud internacional	PCT/EP2003/006490
Fecha inicio fase nacional	19/01/2005
Trámite	011
Evento	379
Actuación	430
Folios	001

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

- El solicitante deberá anexar la traducción del documento en que consta la cesión del derecho de patente del inventor al solicitante o a su causante establecido, de acuerdo con la regla 4.17 51 bis PCT. (Art. 26-k) Decisión 486). Folios 51-53.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

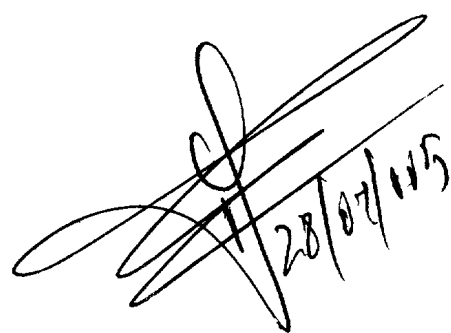
Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha,
28 ENE. 2005

202044

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Commutador: 3 820840 Fax: 3 505220
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 3153265 al 69
Fax: 3 505220. Línea 9800-910 165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia

 28/07/15