



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

05-25154

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO COMPUESTOS DE BENZOTRIAZOL-1-IL-AMINOACETONITRILLO Y SU USO EN EL
CONTROL DE ENFERMEDAD POR PARASITOS.

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL COD 249/18. A61K31/4192.
A61P33/00.

71. SOLICITANTE NOVARTIS AG

DOMICILIO BASILEA, SUIZA

74. APODERADO JIMENA ESCOBAR URIBE

22. BOGOTA, D.C., Marzo 17-2005

SS

GF

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

11-04-2005

SOLICITUD DE:

1

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Capítulo I

☒

Capítulo II

2

S LICITANTE
(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
AP DERADO
(74)

Nombre: **JIMENA ESCOBAR URIBE**

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

Teléfono: 6 162051/81 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:

folio 3

5 **PCT (86)**

Solicitud Internacional No. PCT/EP2003/010047 Fecha 10 de septiembre de 2003

Publicación Internacional No. WO 2004/024704 A1 Fecha 25 de marzo de 2004

6 **TITUL (54)** COMPUESTOS DE BENZOTRIAZOL-1-IL-AMINOACETONITRIL Y SU USO EN EL CONTROL DE ENFERMEDAD POR PARASITOS.

7 **Clasificación Internacional (51)** C07D 249/18; A61K31/4192; A61P33/00

8 **Pri ridad**

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

SUIZA

(32) Fecha

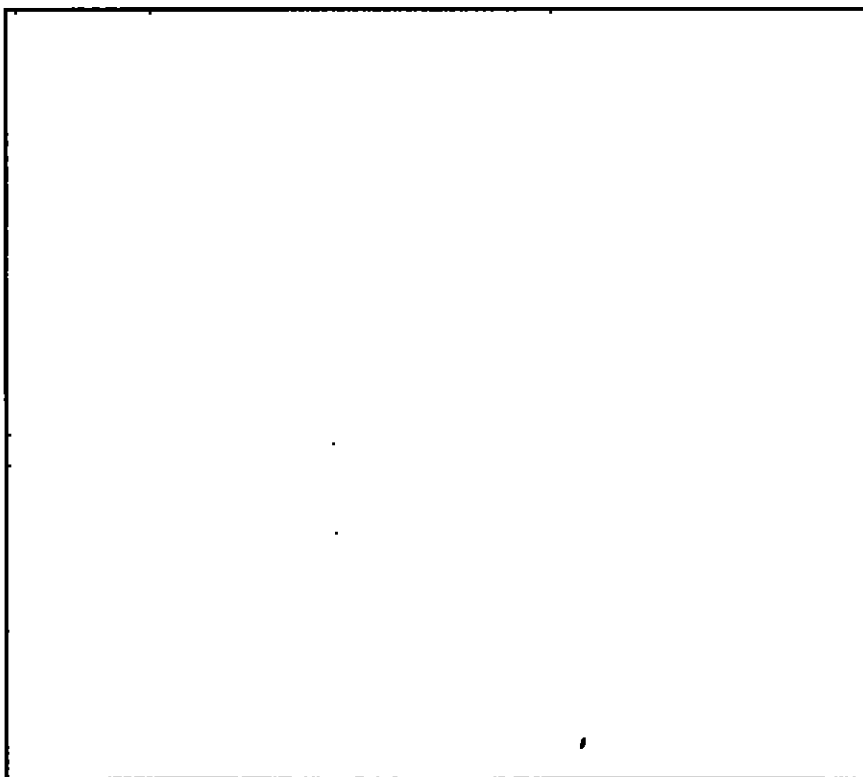
11 de septiembre de 2002

(31) Número de Solicitud

1542/02

9 **Comprobante de pago N** 05 - 16.520 **Fecha** 4 de marzo de 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 deposito 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 S licito la concesión de la patente**NOMBRE: JIMENA ESCOBAR URIBEFIRMA: 

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

2793

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
REGISTRACION : 0302134 00000000 FOLIOS: 14/
FOLIO 00000000000000000000
ITEMITO : 011 PCT-MRIZAL 1/3 FASE APLIC 411 PRESENCIAL
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 16,520
FECHA : MARZO 4 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	37354434	03/03/2005	7,044,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	443,000.00
	TOTAL :	\$ 443,000.

SON: 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);

3.) GAUVRY, Noëlle
(8F, rue des buissons, F-68680 Kembs-Loechle, Francia).

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 "**COMPUESTOS DE
BENZOTRIAZOL-1-IL-AMINOACETO
NITRILO Y SU USO EN EL CONTROL
DE ENFERMEDAD POR PARASITOS**".

Clase: C07D 249/18


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

DOCUMENTO DE CESIÓN
ASSIGNMENT DOCUMENT

El (los) suscrito (s), en su calidad de inventor (es) de
Pierre DUCRAY, 8 rue des allées, 68128 Village-Neuf, France, citizen of France

Thomas GOEBEL, Lettenweg 28B, 79539 Lörrach, Germany, citizen of Germany

Noëlle GAUVRY, 8F, rue des bulsons, 68680 Kembs-Loechle, France, citizen of France

declara (an) que cede (n) y traspasa (n) todos los derechos que les correspondan en y sobre el invento atrás mencionado a NOVARTIS AG, una compañía suiza constituida y existente bajo las leyes de Suiza, domiciliada en CH-4002 Basilea, Suiza, en cuanto se refiere a la República de Colombia.

The undersigned, as inventor (s) of

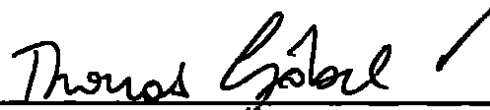
BENZOTRIAZOL-1-YL-AMINOACETONITRILE COMPOUNDS AND THEIR USE IN THE
CONTROL OF PARASITE DISEASE

hereby declare (s) that assign (s) all the rights in and to the aforementioned invention to NOVARTIS AG, a Swiss company incorporated and existing in conformity with the laws of Switzerland, domiciled at CH-4002 Basel, Switzerland, as far as the Republic of Colombia is concerned.



Pierre DUCRAY
domiciled at
8 rue des allées 68128 Village-Neuf, France

FIRMA DEL CEDENTE
domiciliado en



Thomas GOEBEL
domiciled at
Lettenweg 28B, 79539 Lörrach, Germany

FIRMA DEL CEDENTE
domiciliado en



Noëlle GAUVRY
domiciled at
8F, rue des bulsons, 68680 Kembs-Loechle, France

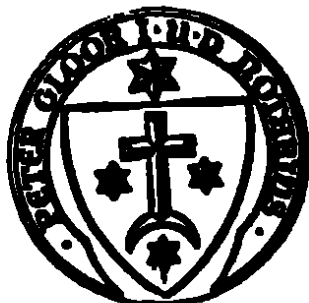
FIRMA DEL CEDENTE
domiciliado en

Attestation

I, the undersigned notary public of Basel, Switzerland, certify herewith the authenticity of the signatures of **Mr. Pierre Ducray**, French citizen, residing in Village-Neuf, France, **Mr. Thomas Goebel**, German citizen, residing in Lörrach, Germany, and **Mr. Nöelle Gauvry**, French citizen, residing in Kembs-Loechele, France.

The authenticity of the signatures was established by comparison.

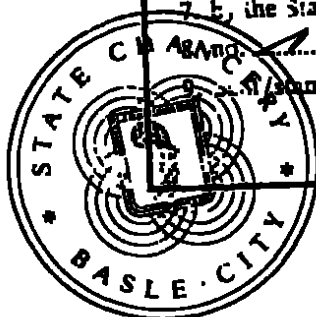
BASEL, this 10th (tenth) day of February 2005 (twothousandandfive).



P. Ducray
Nöelle

Leg.Prot.Nr.: 28 /2005

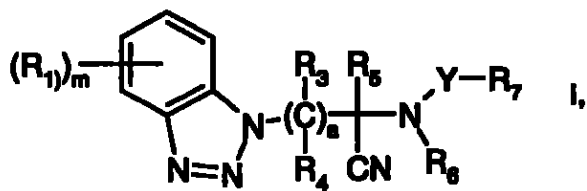
OFFICIAL AUTHENTICATION (Hague Convention of October 5 th , 1961)	
1. Country: Switzerland (Schweiz / Suisse)	
This official document	
2. is signed by <i>P. Ducray</i>	
3. in his/her function is <i>Off. 120</i>	
4. and certified by the seal of the <i>Notary</i>	
Certified 17 Feb. 2005	
5. in Basel (Eile)	6. on
7. E, the State Chancery of the Canton of Basel-Stadt	
Stamp: <i>17/12/05</i>	10. Signature: <i>Fischer</i>
	Heidi Fischer



RESUMEN

La invención se refiere a compuestos de la fórmula general: (I) en donde R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , Y, a y m tienen los significados dados en la reivindicación 1, y opcionalmente enantiómeros de los mismos. Los ingredientes activos tienen propiedades plaguicidas convenientes. Son especialmente adecuados para controlar parásitos en animales de sangre caliente.

10



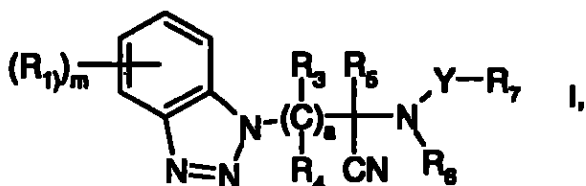
15

20

25

**COMPUESTOS DE BENZOTRIAZOL-1-IL-AMINOACETONITRILLO Y SU
USO EN EL CONTROL DE ENFERMEDAD POR PARASITOS**

La presente invención se refiere a nuevos compuestos de
5 benzotriazolil-aminoacetonitrilo de la fórmula:



10 en donde:

R₁ significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de
carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a
6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioarilo,
alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxilo de 3 a 6 átomos
15 de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo
de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de
carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo
de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de
carbono, di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino, arilo
20 insustituido o sustituido, o fenoxilo insustituido o sustituido, en
donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y
se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro,
ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6
átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono,
25 haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos

de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono;

5 R₃, R₄, y R₅, independientemente unos de otros, significan hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los
10 sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno y alquilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser
15 independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a
20 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, o di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino;

 o R₄ y R₅ significan juntos alquileno de 2 a 6 átomos de carbono;

25 R₆ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, aminocarbonilo, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, o bencilo;

R₇ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino, piperonilo, fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alqueno de 2 a 6 átomos de carbono, haloalqueno de 2 a 6 átomos de carbono, alquino de 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alqueno de 2 a 6 átomos de carbono, haloalqueno de 2 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalqueno de 2 a 6 átomos de carbono, halotioalqueno de 2 a 6

átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino, alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)aminocarbonilo; arilalquilo de 1 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilamino que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilcarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilcarboniloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, hetariloxialquilo de 1 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxicarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonilamino que está insustituido o sustituido una o muchas veces, piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y fenilacetilenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independientes de los otros y se seleccionan a partir

del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono;

hetarilo insustituido o hetarilo que está sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halotioalquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, y di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino;

o naftilo o quinolilo que están insustituídos o sustituidos una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alquénilóxido de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilóxido de 2 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquénilo de 2 a 6 átomos de carbono, halotioalquénilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquénilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquénilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, y di-(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino;

R_8 y R_9 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltiocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo, o hetarilo;

Y significa un enlace directo, C(O), C(S), ó S(O)_n;

a significa 1, 2, ó 3;

m significa 0, 1, 2, 3, ó 4; y

n es 1 ó 2;

a su preparación y uso en el control de endo- y ecto-parásitos, en especial helmintos, dentro y sobre ganado productor de sangre caliente y animales domésticos y plantas, y además a plaguicidas que contienen cuando menos uno de estos compuestos.

Los compuestos de aminoacetonitrilo sustituido que tienen actividad plaguicida se describen, por ejemplo, en la Patente Europea Número EP-0,953,565 A2. Sin embargo, los ingredientes activos específicamente dados a conocer en la misma no siempre pueden satisfacer los requerimientos con respecto a la potencia y al espectro de actividad. Por consiguiente, existe una necesidad de ingredientes activos con mejores propiedades plaguicidas. Ahora se ha encontrado que los compuestos de aminoacetonitrilo de la fórmula I tienen excelentes propiedades plaguicidas, en especial contra endo- y ecto-parásitos dentro y sobre ganado productor y animales domésticos y plantas.

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, benzotiazolilo, indolilo, o indazolilo, de preferencia piridilo, pirimidilo, s-triazinilo, ó 1,2,4-triazinilo, en especial piridilo o pirimidilo.

Alquilo - como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos, por ejemplo de

haloalquilo, alcoxilo, y tioalquilo - es, en cada caso con la debida consideración del número específico de átomos de carbono en el grupo o compuesto en cuestión, ya sea de cadena recta, es decir, metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, ó hexilo, o de cadena
5 ramificada, por ejemplo isopropilo, isobutilo, butilo secundario, butilo terciario, isopentilo, neopentilo, o isohexilo.

Alquenilo - como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos - es, en cada caso con la debida consideración del número específico de átomos de carbono en
10 el grupo o compuesto en cuestión, y de los dobles enlaces conjugados o aislados, ya sea de cadena recta, por ejemplo alilo, 2-butenilo, 3-pentenilo, 1-hexenilo, ó 1,3-hexadienilo, o de cadena ramificada, por ejemplo isopropenilo, isobutenilo, isoprenilo, pentenilo terciario, ó isohexenilo.

15 Alquinilo - como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos - es, en cada caso con la debida consideración del número específico de átomos de carbono en el grupo o compuesto en cuestión, y de dobles enlaces conjugados o aislados, ya sea de cadena recta, por ejemplo propargilo, 2-butinilo,
20 3-pentinilo, 1-hexinilo, 1-heptinilo, ó 3-hexen-1-inilo, ó de cadena ramificada, por ejemplo 3-metilbut-1-inilo, 4-etilpent-1-inilo, ó 4-metilhex-2-inilo.

Cicloalquilo - como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como
25 halocicloalquilo - es, en cada caso con la debida consideración del

número específico de átomos de carbono que tenga el grupo o compuesto en cuestión, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ó ciclohexilo.

5 Halógeno - como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como haloalquilo, haloalcoxilo, y halotioalquilo - es flúor, cloro, bromo, o yodo, en especial flúor, cloro, o bromo, en particular flúor o cloro.

10 Los grupos y compuestos que contienen carbono sustituidos por halógeno, tales como haloalquilo, haloalcoxilo, o halotioalquilo, pueden estar parcialmente halogenados o perhalogenados, en donde, en el caso de la halogenación múltiple, los sustituyentes de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. Los ejemplos de haloalquilo - como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como haloalcoxilo o halotioalquilo - son
15 metilo que está mono- a tri-sustituido por flúor, cloro y/o bromo, tal como CHF_2 ó CF_3 ; etilo que está mono- a penta-sustituido por flúor, cloro, y/o bromo, tal como CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF ó CClFCHClF ; propilo o isopropilo mono- a hepta-sustituidos por flúor, cloro y/o
20 bromo, tales como $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, ó $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; butilo o uno de sus isómeros, mono- a nona-sustituido por flúor, cloro y/o bromo, tal como $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCH}_2\text{F}$ ó $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$; pentilo o uno de sus isómeros, sustituido de una a once veces por flúor, cloro y/o bromo, tal como $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ ó $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$; y
25 hexilo o uno de sus isómeros, sustituido de una a trece veces por

flúor, cloro y/o bromo, tal como $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$, ó $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$.

Los grupos alcoxilo de preferencia tienen una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Alcoxilo es, por ejemplo, metoxilo, etoxilo, propoxilo, isopropoxilo, butoxilo normal, isobutoxilo, butoxilo secundario, y butoxilo terciario, así como los isómeros pentiloxilo y hexiloxilo; de preferencia metoxilo y etoxilo. Los grupos haloalcoxilo de preferencia tienen una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Haloalcoxilo es, por ejemplo, fluorometoxilo, difluorometoxilo, trifluorometoxilo, 2,2,2-trifluoroetoxilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxilo, 2-fluoroetoxilo, 2-cloroetoxilo, 2,2-difluoroetoxilo, y 2,2,2-tricloroetoxilo; de preferencia difluorometoxilo, 2-cloroetoxilo, y trifluorometoxilo.

Los grupos tioalquilo de preferencia tienen una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono: Tioalquilo es, por ejemplo, tiometilo, tioetilo, tiopropilo, tioisopropilo, tiobutilo normal, tioisobutilo, tiobutilo secundario, o tiobutilo terciario, de preferencia tiometilo y tioetilo.

Las modalidades preferidas dentro del alcance de la invención son:

(1) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_1 significa halógeno, clano, nitro, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de

carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenoxilo insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono;

en especial halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, o fenoxilo insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono;

de una manera más particular, halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono;

(2) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, son hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo

que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o R_4 y R_5 son juntos alquileno de 2 a 6 átomos de carbono;

en especial, independientemente unos de otros, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono; o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

de una manera más particular, independientemente unos de otros, hidrógeno, metilo o halometilo;

(3) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_6 es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono; alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o bencilo;

en especial hidrógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, o bencilo;

más particularmente hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

(4) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_7 significa fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de

carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxilo de
5 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 4 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)amino, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono;
10 arilalquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, hetariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o
15 sustituido una o muchas veces, ariloxycarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independientes de los otros y se seleccionan a partir
20 del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4
25

átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y
5 haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, alquénilóxido de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquénilóxido de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y
10 haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, o

naftilo o quinolilo que están insustituidos o sustituidos una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, alquénilóxido de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquénilóxido de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquénilo de 2 a 4 átomos de carbono, halotioalquénilo de 2 a 4 átomos de carbono,
20
25

21.26

alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

5 en particular, arilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, 10 alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos 15 de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, 20 alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1

a 2 átomos de carbono; o

hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en
5 halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a
10 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono;

más particularmente arilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo
15 que consiste en halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1
20 a 2 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independiente de los otros y se seleccionan a partir del grupo que
25 consiste en halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono,

haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono;

(5) Un compuesto de la fórmula I, en donde R_1 y R_2 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, o arilo;

en especial, independientemente uno del otro, hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

en especial, independientemente uno del otro, hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

(6) Un compuesto de la fórmula I, en donde Y es $C(O)$ ó $S(O)_n$;

en especial $C(O)$;

(7) Un compuesto de la fórmula I, en donde a es 1 ó 2;

en especial 1;

(8) Un compuesto de la fórmula I, en donde n es 2;

(9) Un compuesto de la fórmula I, en donde n es 2;

(10) Un compuesto de la fórmula I, en donde:

R_1 significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, o fenóxido insustituído o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se

seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

- 5 R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, son hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos
- 10 de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o
- 15 R_4 y R_5 son juntos alquilenos de 2 a 6 átomos de carbono;

R_6 es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono; alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o bencilo;

- R_7 significa fenilo que está insustituido o sustituido una o
- 20 muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 4
- 25 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono,

alquinilo de 2 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 4 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)amino, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, hetariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxicarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independiente de los otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono,

tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

5 hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2
10 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

 naftilo o quinolilo que están insustituidos o sustituidos
15 una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono,
20 alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, halotioalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1
25 a 4 átomos de carbono;

22
27

R_8 y R_9 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, o arilo;

5 Y es $C(O)$ ó $S(O)_n$;

a significa 1 ó 2;

m es 1, 2, ó 3, y

n significa 2;

(11) Un compuesto de la fórmula I, en donde:

10 R_1 significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcóxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o fenóxilo insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se
15 seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, significan
20 hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono; o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono;

R_6 significa hidrógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, o bencilo;

25 R_7 significa fenilo que está insustituido o sustituido una o

muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes
unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en
halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono,
haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de
5 carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a
5 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono,
halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2
átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono,
alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1
10 a 2 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono;
arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o
sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o
sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de
carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y
15 piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en
donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y
se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro,
ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2
átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono,
20 haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos
de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono,
alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1
a 2 átomos de carbono; o

hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas
25 veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos

de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R_8 y R_9 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

Y significa C(O);

a significa 1; y

m es 1 ó 2;

(12) Un compuesto de la fórmula I, en donde:

R_1 significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, significan hidrógeno, metilo o halometilo;

R_6 significa hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R_7 significa fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en

halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independiente de los otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R_6 y R_6 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

Y significa $C(O)$;

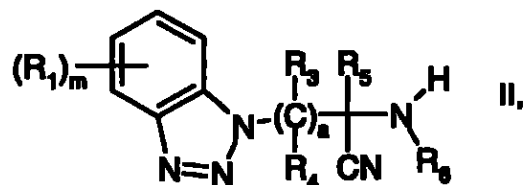
a significa 1; y

m es 1 ó 2.

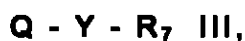
Dentro del contexto de la invención, se da una preferencia particular a los compuestos de la fórmula I enlistados en la Tabla 1, y más particularmente aquéllos mencionados en los ejemplos de síntesis.

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 forma de sal, por ejemplo caracterizado porque se

hace reaccionar un compuesto de la fórmula:



el cual es conocido o se puede producir de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , a y m son como se definen para la fórmula I, con un compuesto de la fórmula:



el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde Y y R_7 se definen como se da para la fórmula I, y Q es un grupo saliente, opcionalmente en la presencia de un catalizador básico, y si se desea, un compuesto de la fórmula I que se pueda obtener de acuerdo con el método o de otra manera, respectivamente en forma libre o en forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula I, se separa una mezcla de isómeros que se pueda obtener de acuerdo con el método, y se aísla el isómero deseado, y/o un compuesto libre de la fórmula I que se pueda obtener de acuerdo con el método, se convierte en una sal, o una sal de un compuesto de la fórmula I que se pueda obtener de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula I o en otra sal.

Lo que se ha mencionado anteriormente para sales de los compuestos I, también se aplica de una manera análoga a las sales

de los materiales de partida enlistados anteriormente en la presente y más adelante en la presente.

Los componentes de reacción se pueden hacer reaccionar unos con otros como tales, es decir, sin la adición de un solvente o diluyente, por ejemplo en la fusión. Sin embargo, en la mayoría de los casos, es conveniente la adición de un solvente o diluyente inerte, o una mezcla de los mismos. Los ejemplos de estos 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, hexano, ciclohexano, diclorometano, triclorometano, tetraclorometano, dicloroetano, tricloroetano, o tetracloroetano; éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, di-isopropiléter, dibutiléter, terbutilmetiléter, monometiléter de etilenglicol, monoetiléter de etilenglicol, dimetiléter de etilenglicol, dimetoxidietiléter, tetrahidrofurano, o dioxano; cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, o metilisobutilcetona; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-diethylformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona, ó triamida del ácido hexametilfosfórico; nitrilos, tales como acetonitrilo o propionitrilo; y sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo.

Los grupos salientes preferidos son halógenos, en especial cloro.

Las bases adecuadas para facilitar la reacción son, por ejemplo, hidróxidos, hidruros, amidas, alcanolatos, acetatos,

carbonatos, dialquilamidas, o alquilsililamidas de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos; alquilaminas, alquilendiaminas, opcionalmente N-alquiladas, opcionalmente insaturadas, cicloalquilaminas, heterociclos básicos, hidróxidos de amonio y aminas carbocíclicas. Aquéllas que se pueden mencionar a manera de ejemplo son hidróxido, hidruro, amida, metanolato, acetato, y carbonato de sodio; terbutanolato, hidróxido, carbonato, e hidruro de potasio; di-isopropilamida de litio, bis(trimetilsilil)amida de potasio, hidruro de calcio, trietilamina, di-isopropiletilamina, trietilendiamina, ciclohexilamina, N-ciclohexil-N,N-dimetilamina, N,N-dietilanilina, piridina, 4-(N,N-dimetilamino)piridina, quinuclidina, N-metilmorfolina, hidróxido de benciltrimetilamonio, así como 1,5-diazabicyclo[5.4.0]undec-5-eno (DBU). Se da preferencia a di-isopropiletilamina y 4-(N,N-dimetilamino)piridina.

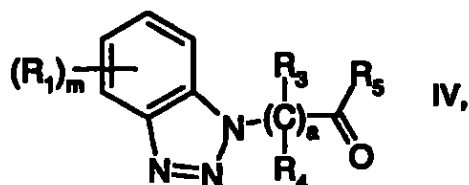
La reacción convenientemente tiene lugar en un rango de temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente 100°C, de preferencia de aproximadamente 10°C a aproximadamente 40°C.

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

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

forma libre o en forma de sal, por ejemplo, caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de la fórmula:

5



10

15

20

el cual es conocido o se puede producir de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, en donde R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , a y m son como se definen para la fórmula I, con un cianuro inorgánico u orgánico y con un compuesto de la fórmula $\text{R}_6\text{-NH}_2$, el cual es conocido o se puede producir de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_6 es como se define para la fórmula I, y si se desea, un compuesto de la fórmula II que se pueda obtener de acuerdo con el método o de otra manera, respectivamente en forma libre o en forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula II, se separa de una mezcla de isómeros que se pueda obtener de acuerdo con el método, y se aísla el isómero deseado, y/o un compuesto libre de la fórmula II que se pueda obtener de acuerdo con el método se convierte en una sal, o una sal de un compuesto de la fórmula II que se pueda obtener de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula II o en otra sal.

25

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 de

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

Las sales de los compuestos I se pueden producir de una manera conocida. Por ejemplo, las sales de adición de ácido de los compuestos I se pueden obtener mediante el tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo de intercambio de iones adecuado, y las sales con bases se pueden obtener mediante el tratamiento con una base adecuada o con un reactivo de intercambio de iones adecuado.

Las sales de los compuestos I se pueden convertir en los compuestos I libres por medios usuales, las sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante el tratamiento con una composición básica adecuada o con un reactivo de intercambio de iones adecuado, y las sales con bases, por ejemplo, mediante el tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo de intercambio de iones adecuado.

Las sales de los compuestos I se pueden convertir en otras sales de los compuestos I de una manera conocida; las sales de adición de ácido se pueden convertir por ejemplo en otras sales de adición de ácido, por ejemplo mediante el tratamiento de una sal de un ácido inorgánico, tal como un clorhidrato, con una sal de metal adecuada, tal como una sal de sodio, bario, o plata, de un ácido, por ejemplo con acetato de plata, en un solvente adecuado en el que sea insoluble una sal inorgánica resultante, por ejemplo cloruro de plata,

y que por lo tanto se precipite hacia afuera de la mezcla de reacción.

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

5 Las sales de los compuestos I se pueden producir de una manera conocida. Por ejemplo, las sales de adición de ácido de los compuestos I se pueden obtener mediante el tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo de intercambio de iones adecuado, y las sales con bases se pueden obtener mediante el tratamiento con
10 una base adecuada o con un reactivo de intercambio de iones adecuado.

Las sales de los compuestos I se pueden convertir en los compuestos I libres por medios usuales, las sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante el tratamiento con una composición
15 básica adecuada o con un reactivo de intercambio de iones adecuado, y las sales con bases, por ejemplo, mediante el tratamiento con un ácido adecuado o un reactivo de intercambio de iones adecuado.

Las sales de los compuestos I se pueden convertir en otras
20 sales de los compuestos I de una manera conocida; las sales de adición de ácido se pueden convertir por ejemplo en otras sales de adición de ácido, por ejemplo mediante el tratamiento de una sal de un ácido inorgánico, tal como un clorhidrato, con una sal de metal adecuada, tal como una sal de sodio, bario, o plata, de un ácido, por
25 ejemplo con acetato de plata, en un solvente adecuado en el que sea

insoluble una sal inorgánica resultante, por ejemplo cloruro de plata, y que por lo tanto se precipite hacia afuera de la mezcla de reacción.

Los compuestos I también se pueden obtener en la forma de sus hidratos, y/o también pueden incluir otros solventes utilizados, por ejemplo, cuando sea necesario para la cristalización de los compuestos presentes en forma sólida.

Los compuestos I y II pueden estar opcionalmente presentes como isómeros ópticos y/o geométricos, o como una mezcla de los mismos. La invención se refiere tanto a los isómeros puros como a todas las posibles mezclas isoméricas, y por consiguiente, se debe entender así anteriormente en la presente y posteriormente en la presente, inclusive cuando no se mencionen específicamente los detalles estereoquímicos en cada caso.

Las mezclas diaestereoisoméricas de los compuestos I, que se pueden obtener mediante el procedimiento o de otra manera, con base en las diferencias fisicoquímicas de los componentes, en los diaestereoisómeros puros, por ejemplo mediante cristalización fraccionaria, destilación, y/o cromatografía.

La división de las mezclas de enantiómeros, que se pueden obtener de conformidad con lo mismo, en los isómeros puros, se puede lograr mediante métodos conocidos, por ejemplo mediante recristalización a partir de un solvente ópticamente activo, mediante cromatografías sobre adsorbentes quirales, por ejemplo cromatografía de líquidos de alta presión (HPLC) sobre acetilcelulosa, con la asistencia de microorganismos apropiados,

mediante disociación con enzimas inmovilizadas específicas, por medio de la formación de compuestos de inclusión, por ejemplo utilizando éteres de corona quirales, en donde solamente forme complejo un enantiómero.

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

Es conveniente aislar o sintetizar el isómero biológicamente más activo, por ejemplo el enantiómero, o la mezcla de isómeros, por ejemplo la mezcla de enantiómeros, en el entendido de que los
15 componentes individuales tengan diferente eficacia biológica.

En el método de la presente invención, los materiales de partida y los intermediarios utilizados son de preferencia aquéllos que conduzcan a los compuestos I descritos al principio como especialmente útiles.

20 La invención se refiere en special al método de preparación descrito en el ejemplo.

Los materiales de partida y los intermediarios que son nuevos y que se utilizan de acuerdo con la invención para la preparación de los compuestos I, así como su uso y procedimiento para su
25 preparación, de una manera similar forman un objeto de la invención.

Los compuestos I de acuerdo con la invención son notorios por su espectro de actividad particularmente amplio, y son valiosos ingredientes activos para utilizarse en el control de plagas, incluyendo en particular el control de endo- y ecto-parásitos en animales, mientras que son bien tolerados por los animales de sangre caliente, los peces, y las plantas.

En el contexto de la presente invención, se entiende que los ectoparásitos son en particular insectos, ácaros, y garrapatas. Éstos incluyen insectos de los órdenes: Lepidópteros, Coleópteros, Homópteros, Heterópteros, Dípteros, Tisanópteros, Ortópteros, Anoplura, Sifonápteros, Malófagos, Tisanura, Isópteros, Psocópteros, e Himenópteros. Sin embargo, se los ectoparásitos que se pueden mencionar en particular son aquéllos que dan problemas a los seres humanos o a los animales, o que portan patógenos, por ejemplo moscas, tales como *Musca domestica*, *Musca vetustissima*, *Musca autumnalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Lucilia cuprina*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Chrysomya chloropyga*, *Dermatobia hominis*, *Cochliomyia hominivorax*, *Gasterophilus intestinalis*, *Oestrus ovis*, *Stomoxys calcitrans*, *Haematobia irritans*, y palomillas (*Nematocera*), tales como *Culicidae*, *Simuliidae*, *Psychodidae*, pero también parásitos succionadores de sangre, por ejemplo pulgas, tales como *Ctenocephalides felis* y *Ctenocephalides canis* (pulgas de gatos y perros), *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Dermatophilus penetrans*, piojos, tales como *Damalina ovis*, *Pediculus humanis*, insectos mordedores y moscas de caballos

(*Tabanidae*), *Haematopota* spp., tales como *Haematopota pluvialis*, *Tabanidea* spp., tales como *Tabanus nigrovittatus*, *Chrysopsinae* spp., tales como *Chrysops caecutiens*, moscas tsetse, tales como las especies de *Glossinia*, insectos mordedores, en particular
5 cucarachas, tales como *Blatella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, ácaros, tales como *Dermanyssus gallinae*, *Sarcoptes scabiei*, *Psoroptes ovis*, y *Psorergates* spp., y finalmente, pero no cuando menos, garrapatas. Las últimas pertenecen al orden *Acarina*. Los representantes conocidos de las garrapatas son, por
10 ejemplo *Boophilus*, *Amblyomma*, *Anocentor*, *Dermacentor*, *Haemaphysalis*, *Hyalomma*, *Ixodes*, *Rhipicentor*, *Margaropus*, *Rhipicephalus*, *Argas*, *Otobius*, y *Ornithodoros*, y similares, que de preferencia infestan a los animales de sangre caliente, incluyendo a los animales de granja, tales como reses, cerdos, ovejas, y cabras,
15 aves de corral, tales como pollos, pavos, y gansos, animales de piel, tales como mink, zorras, chinchillas, conejos y similares, así como animales domésticos, tales como gatos y perros, pero también a los seres humanos.

Los compuestos I también se pueden utilizar contra las plagas
20 de higiene, en especial del orden de los Dípteros de las familias *Sarcophagidae*, *Anophilidae*, y *Culicidae*; de los órdenes *Ortópteros*, *Dictiópteros* (por ejemplo, de la familia *Blattidae*), e *Himenópteros* (por ejemplo, de la familia *Formicidae*).

Los compuestos I también tienen una eficacia sostenible sobre
25 ácaros parasitarios e insectos de plantas. En el caso de los ácaros-

araña del orden *Acarina*, son efectivos contra los huevos, ninfas, y adultos de *Tetranychidae* (*Tetranychus spp.* y *Panonychus spp.*).

5 Tienen una alta actividad contra los insectos succionadores del orden de Homópteros, en especial contra las plagas de las familias *Aphididae*, *Delphacidae*, *Cicadellidae*, *Psyllidae*, *Loccidae*, *Diaspididae*, y *Eriophyidae* (por ejemplo, ácaro de añublo de fruta cítrica); de los órdenes de Hemípteros, Heterópteros, y Tisanópteros, y sobre los insectos comedores de plantas de los órdenes de Lepidópteros, Coleópteros, Dípteros, y Ortópteros.

10 También son similarmente adecuados como insecticidas del suelo contra las plagas de la tierra.

Por consiguiente, los compuestos de la fórmula I son efectivos contra todas las etapas de desarrollo de los insectos succionadores y de los insectos comedores en cultivos, tales como cereales, algodón, arroz, maíz, soya, papas, verduras, fruta, tabaco, lúpulos, cítricos, aguacates, y otros cultivos.

Los compuestos de la fórmula I también son efectivos contra los nemátodos de plantas de las especies *Meloidogyne*, *Heterodera*, *Pratylenchus*, *Ditylenchus*, *Radopholus*, *Rizoglyphus*, y otros.

20 En particular, los compuestos son efectivos contra helmintos, en los cuales, los nemátodos y tremátodos endoparasitarios pueden ser la causa de serias enfermedades en mamíferos y aves de corral, por ejemplo en ovejas, cerdos, cabras, ganado, caballos, burros, perros, gatos, conejillos de indias, y aves exóticas. Los nemátodos típicos de esta indicación son: *Haemonchus*, *Trichostrongylus*,

25

Ostertagia, *Nematodirus*, *Cooperia*, *Ascaris*, *Bunostomum*,
Oesophagostomum, *Charbertia*, *Trichuris*, *Strongylus*, *Trichonema*,
Dictyocaulus, *Capillaria*, *Heterakis*, *Toxocara*, *Ascaridia*, *Oxyuris*,
Ancylostoma, *Uncinaria*, *Toxascaris*, y *Parascaris*. Los tremátodos
5 incluyen, en particular, la familia de *Fasciolidae*, en especial
Fasciola hepatica. La ventaja particular de los compuestos de la
fórmula I es su eficacia contra estos parásitos que son resistentes
hacia los ingredientes activos basados en bencimidazol.

Ciertas plagas de las especies de *Nematodirus*, *Cooperia*, y
10 *Oesophagostomum*, infestan el tracto intestinal del animal huésped,
mientras que otras de las especies *Haemonchus* y *Ostertagia*
parasitizan en el estómago, y otras de la especie *Dictyocaulus*
parasitizan en el tejido pulmonar. Los parásitos de las familias
Filaridae y *Setariidae*, se pueden encontrar en el tejido celular
15 interno y en los órganos, por ejemplo el corazón, los vasos
sanguíneos, los vasos linfáticos, y el tejido subcutáneo. Un parásito
particularmente notorio es el gusano del corazón del perro,
Dirofilaria immitis. Los compuestos de la fórmula I son altamente
efectivos contra estos parásitos.

20 Adicionalmente, los compuestos de la fórmula I son adecuados
para el control de parásitos patogénicos para el ser humano. De
éstos, los representantes típicos que aparecen en el tracto digestivo
son aquéllos de las especies *Ancylostoma*, *Necator*, *Ascaris*,
Strongyloides, *Trichinella*, *Capillaria*, *Trichuris*, y *Enterobius*. Los
25 compuestos de la presente invención también son efectivos contra

los parásitos de las especies *Wuchereria*, *Brugia*, *Onchocerca* y *Loa* de la familia de *Filariidae*, que aparecen en la sangre, en el tejido, y en diferentes órganos, y también contra *Dracunculus*, y los parásitos de las especies *Strongyloides* y *Trichinella*, que infectan en particular el tracto gastrointestinal.

Finalmente, los compuestos de la fórmula I también tienen actividad fungicida y bactericida.

La buena actividad plaguicida de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención corresponde a un índice de mortalidad de cuando menos el 50 al 60 por ciento de las plagas mencionadas. En particular, los compuestos de la fórmula I son notorios por la duración de eficacia excepcionalmente larga.

Los compuestos de la fórmula I de preferencia se emplean en una forma no modificada, o de preferencia junto con los adyuvantes convencionalmente utilizados en la técnica de la formulación, y por consiguiente, se pueden procesar de una manera conocida para dar, por ejemplo, concentrados emulsionables, 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 pretendidos y las circunstancias prevalecientes.

La formulación, es decir, los agentes, las preparaciones, o las composiciones que contienen al ingrediente activo de la fórmula I, o combinaciones de estos ingredientes activos con otros ingredientes activos, y opcionalmente un adyuvante sólido o líquido, se producen

de una manera conocida por sí misma, por ejemplo mediante mezcla íntima y/o molienda de los ingredientes activos con composiciones extensoras, por ejemplo con solventes, vehículos sólidos, y opcionalmente compuestos de actividad superficial (tensoactivos).

5 Los solventes en cuestión pueden ser: alcoholes, tales como etanol, propanol, o butanol, y glicoles y sus éteres y ésteres, tales como propilenglicol, dipropilenglicoléter, etilenglicol, mono-metiléter o -etiléter de etilenglicol, cetonas, tales como ciclohexanona, isoforona, o alcohol de diacetona, solventes fuertemente polares, 10 tales como N-metil-2-pirrolidona, sulfóxido de dimetilo o dimetilformamida, o agua, aceites vegetales, tales como aceite de semilla de colza, de ricino, de coco, o de semilla de soya; y también, si es apropiado, aceites de silicona.

 Las formas de aplicación preferidas para utilizarse en 15 animales de sangre caliente en el control de helmintos incluyen soluciones, emulsiones, suspensiones (inundaciones), aditivos de alimentos, polvos, tabletas, incluyendo tabletas efervescentes, bolos, cápsulas, microcápsulas y formulaciones vertidas, en donde se debe tomar en consideración la compatibilidad fisiológica de los 20 excipientes de la formulación.

 Los aglutinantes para tabletas y bolos pueden ser sustancias naturales poliméricas químicamente modificados que sean solubles en agua o en alcohol, tales como almidón, celulosa, o derivados de proteína (por ejemplo metilcelulosa, carboximetilcelulosa, 25 etilhidroxietilcelulosa, proteínas tales como zeína, gelatina, y

similares), así como polímeros sintéticos, tales como alcohol polivinílico, polivinil-pirrolidona, etc. Las tabletas también contienen rellenos (por ejemplo, almidón, celulosa microcristalina, azúcar, lactosa, etc.), abrillantadores y desintegrantes.

5 Si los antihelmínticos están presentes en la forma de concentrados alimenticios, entonces los vehículos utilizados son, por ejemplo, alimentos de alto desempeño, granos alimenticios, o concentrados de proteína. Estos concentrados de alimento o composiciones pueden contener, aparte de los ingredientes activos, 10 también aditivos, vitaminas, antibióticos, quimioterapéuticos, u otros plaguicidas, primordialmente bacteriostáticos, fungistáticos, coccidiostáticos, o inclusive preparaciones de hormonas, sustancias que tengan acción anabólica, o sustancias que promuevan el crecimiento, que afecten la calidad de la carne de los animales para 15 matanza, o que sean benéficos para el organismo de otra manera. Si las composiciones o los ingredientes activos de la fórmula I contenidos en las mismas, se agregan directamente al alimento o a las artesas para beber, entonces el alimento o bebida formulada contiene a los ingredientes activos de preferencia en una 20 concentración de aproximadamente el 0.0005 al 0.02 por ciento en peso (de 5 a 200 ppm).

Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención, se pueden utilizar solos o en combinación con otros biocidas. Se pueden combinar con plaguicidas que tengan la misma esfera de 25 actividad, por ejemplo para aumentar la actividad, o con sustancias

que tengan otra esfera de actividad, por ejemplo para ampliar el rango de actividad. También puede tener sentido agregar los denominados "repelentes". Si se desea extender el rango de actividad para los endoparásitos, por ejemplo gusanos, los compuestos de la fórmula I se combinan adecuadamente con sustancias que tengan propiedades endoparasitarias. Por supuesto, también se pueden utilizar en combinación con composiciones antibacterianas. Debido a que los compuestos de la fórmula I son adulticidas, es decir, debido a que son efectivos en particular contra la etapa adulta de los parásitos objetivo, la adición de plaguicidas que en su lugar ataquen a las etapas juveniles de los parásitos puede ser muy conveniente. De esta manera, se cubrirá la mayor parte de los parásitos que produzcan un gran daño económico. Más aún, esta acción contribuirá sustancialmente para evitar la formación de resistencia. Muchas combinaciones también pueden conducir a efectos sinérgicos, es decir, que se puede reducir la cantidad total de ingrediente activo, lo cual es deseable desde un punto de vista ecológico. Los grupos preferidos de componentes de combinación, y los componentes de combinación especialmente preferidos se mencionan subsecuentemente, en donde las combinaciones pueden contener uno o más de estos componentes en adición a un compuesto de la fórmula I.

Los componentes adecuados en la mezcla pueden ser biocidas, por ejemplo los insecticidas y acaricidas con diferentes mecanismos de actividad, los cuales se mencionan

subsecuentemente, y hay sido conocidos por la persona experta en la materia durante un largo tiempo, por ejemplo inhibidores de la síntesis de quitina, reguladores del crecimiento; ingredientes activos que actúan como hormonas juveniles; ingredientes activos que actúan como adulticidas; insecticidas de banda amplia, acaricidas de banda amplia, y nematicidas; y también los antihelmínticos bien conocidos y las sustancias que repelan a los insectos y/o ácaros, dichos repelentes o alejadores.

Los ejemplos no limitantes de los insecticidas y acaricidas adecuados son:

1. Abamectina
2. AC 303 630
3. Acefat
4. Acrinatrina
5. Alanicarb
6. Aldicarb
7. α -cipermetrina
8. Alfamectrina
9. Amitraz
10. Avermectina B₁
11. AZ 60541
12. Azinfos A
13. Azinfos M
14. Azinfos-metilo
15. Azociclotina

	16.	Toxina de <i>Bacillus subtil.</i>
	17.	Bendiocarb
	18.	Benfuracarb
	19.	Bensultap
5	20.	□-ciflutrina
	21.	Bifentrina
	22.	BPMC
	23.	Brofenprox
	24.	Bromofos A
10	25.	Bufencarb
	26.	Buprofezina
	27.	Butocarboxima
	28.	Butilpiridabeno
	29.	Cadusafos
15	30.	Carbarilo
	31.	Carbofurano
	32.	Carbofenotión
	33.	Cartap
	34.	Cloetocarb
20	35.	Cloretoxifos
	36.	Clorfenapir
	37.	Clorfluazurón
	38.	Clormefos
	39.	Clorpirifos
25	40.	Cis-resmetrina

49st

	41. Clocitrina
	42. Clofentecina
	43. Cianofos
	44. Cicloprotrina
5	45. Ciflutrina
	46. Cihexatina
	47. D 2341
	48. Deltametrina
	49. Demetón M
10	50. Demetón S
	51. Demetón-S-metilo
	52. Dibutiltioamino
	53. Diclofentión
	54. Diclifos
15	55. Dietión
	56. Diflubenzurón
	57. Dimetoato
	58. Dimetilvinfos
	59. Dioxatión
20	60. DPX-MP062
	61. Edifenfos
	62. Emamectina
	63. Endosulfano
	64. Esfenvalerato
25	65. Etiofencarb

	66. Etión
	67. Etofenprox
	68. Etoprofos
	69. Etrimfos
5	70. Fenamifos
	71. Fenazaquina
	72. Fenbutatinoxida
	73. Fenitrotión
	74. Fenobucarb
10	75. Fenotiocarb
	76. Fenoxicarb
	77. Fenpropatrina
	78. Fenpirad
	79. Fenpiroximato
15	80. Fentión
	81. Fenvalerato
	82. Fipronil
	83. Fluazinam
	84. Fluazurón
20	85. Flucicloخورón
	86. Flucitrinato
	87. Flufenoxurón
	88. Flufenprox
	89. Fonofos
25	90. Formotión

	91. Fostiazato
	92. Fubfenprox
	93. HCH
	94. Heptenofos
5	95. Hexaflumurón
	96. Hexitiazox
	97. Hidropreno
	98. Imidacloprida
	99. Hongos activos contra insectos
10	100. Nemátodos activos contra insectos
	101. Virus activos contra insectos
	102. Iprobenfos
	103. Isofenfos
	104. Isoprocarb
15	105. Isoxatión
	106. Ivermectina
	107. λ-Cihalotrina
	108. Lufenurón
	109. Malatión
20	110. Mecarbam
	111. Mesulfenfos
	112. Metaldehído
	113. Metamidofos
	114. Metiocarb
25	115. Metomilo

57
52

	116. Metopreno
	117. Metolcarb
	118. Mevinfos
	119. Milbemectina
5	120. Moxidectina
	121. Naled
	122. NC 184
	123. NI-25, Acetamiprida
	124. Nitenpiram
10	125. Ometoato
	126. Oxamilo
	127. Oxidemetón M
	128. Oxideprofos
	129. Paratión
15	130. Paratión-metilo
	131. Permetrina
	132. Fentoato
	133. Forato
	134. Fosalona
20	135. Fosmet
	136. Foxima
	137. Pirimicarb
	138. Pirimifos A
	139. Pirimifos M
25	140. Promecarb

	141. Propafos
	142. Propoxur
	143. Protiofos
	144. Protoato
5	145. Piraclofos
	146. Piradafentión
	147. Piresmetrina
	148. Piretro
	149. Piridabeno
10	150. Pirimidifeno
	151. Piriproxifeno
	152. RH 5992
	153. RH-2485
	154. Salitión
15	155. Sebufos
	156. Silafluofeno
	157. Espinosad
	158. Sulfotep
	159. Sulprofos
20	160. Tebufenozida
	161. Tebufenpirad
	162. Tebupirimfos
	163. Teflubenzurón
	164. Teflutrina
25	165. Temefos

166. Terbam
167. Terbufos
168. Tetraclorvinfos
169. Tiafenox
5 170. Tiodicarb
171. Tiofanox
172. Tionacina
173. Turingiensina
174. Tralometrina
10 175. Triarateno
176. Triazamato
177. Triazofos
178. Triazurón
179. Triclorfón
15 180. Triflumurón
181. Trimetacarb
182. Vamidotión
183. XMC (metilcarbamato de 3,5-xililo)
184. Xililcarb
20 185. YI 5301/5302
186. ξ -Cipermetrina
187. Zetametrina

Los ejemplos no limitantes de los antihelmínticos adecuados
25 se mencionan subsecuentemente; unos cuantos representantes

tienen una actividad insecticida y acaricida en adición a la actividad antihelmíntica, y ya están parcialmente en la lista anterior:

- (A1) Praziquantel = 2-ciclohexilcarbonil-4-oxo-1,2,3,6,7, 11b-hexahidro-4H-pirazino[2,1- $\square$]isoquinolina.
- 5 (A2) Closantel = 3,5-diiodo-N-[5-cloro-2-metil-4-($\square$ -ciano-4-clorobencil)fenil]-salicilamida.
- (A3) Triclabendazol = 5-cloro-6-(2,3-diclorofenoxi)-2-tiometil-1H-bencimidazol.
- (A4) Levamisol = L-(-)-2,3,5,6-tetrahidro-6-fenilimidazo[2,1-b]tiazol.
- 10 (A5) Mebendazol = metiléster de ácido 5-benzoil-1H-bencimidazol-2-il)carbámico.
- (A6) Omfalotina = un producto de fermentación macrocíclico del hongo *Omphalotus olearius* descrito en la Publicación Número WO 97/20857.
- 15 (A7) Abamectina = avermectina B1
- (A8) Ivermectina = 22,23-dihidroavermectina B1.
- (A9) Moxidectina = 5-O-demetil-28-desoxi-25-(1,3-dimetil-1-butenil)-6,28-epoxi-23-(metoxi-imino)-milbemicina B.
- (A10) Doramectina = 25-ciclohexil-5-O-demetil-25-de(1-metil-propil)-
- 20 avermectina A1a.
- (A11) Milbemectina = mezcla de milbemicina A3 y milbemicina A4.
- (A12) Milbemicinoxima = 5-oxima de milbemectina.

Los ejemplos no limitantes de los repelentes y alejadores son:

- 25 (R1) DEET = (N,N-dietil-m-toluamida).

(R2) KBR 3023 = N-butil-2-oxicarbonil-2-(2-hidroxietil)-piperidina.

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

5 Los participantes en la mezcla son mejor conocidos por los especialistas en este campo. La mayoría se describen en las diferentes ediciones del Pesticide Manual, The British Crop Protection Council, Londres, y otros en las diferentes ediciones de The Merck Index, Merck & Co., Inc., Rahway, Nueva Jersey, E.U.A.,
10 o en la literatura de patente. Por consiguiente, el siguiente listado está restringido a unos cuantos lugares en donde se pueden encontrar a manera de ejemplo.

(I) 2-metil-2-(tiometil)propionaldehído-O-metilcarbamoiloxima (Aldicarb), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The
15 British Crop Protection Council, Londres, Página 26;

(II) S-(3,4-dihidro-4-oxobenzod-[1,2,3]-triazin-3-ilmetil) O,O-dimetil-fosforoditioato (Azinfos-metilo), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 67;

20 (III) Etil-N-[2,3-dihidro-2,2-dimetilbenzofuran-7-iloxicarbonil(metil)tioamino]-N-isopropil- α -alaninato(Benfuracarb) del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 96;

(IV) 2-metilbifenil-3-ilmetil-(Z)-(1RS)-cis-3-(2-cloro-3,3,3-trifluoroprop-1-enil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato
25

- (Bifentrina), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 118;
- (V) 2-terbutilimino-3-isopropil-5-fenil-1,3,5-tiadiazinan-4-ona (Buprofecina), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997),
5 The British Crop Protection Council, Londres, página 157;
- (VI) 2,3-dihidro-2,2-dimetilbenzofuran-7-il-metilcarbamato (Carbofurano), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997),
The British Crop Protection Council, Londres, página 186;
- (VII) 2,3-dihidro-2,2-dimetilbenzofuran-7-il-(dibutiltioamino)metilcarbamato (Carbosulfano), del The Pesticide Manual,
10 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 188;
- (VIII) S,S'-(2-dimetilaminotrimetilen)bis(tiocarbamato) (Cartap), del
The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop
15 Protection Council, Londres, página 193;
- (IX) 1-[3,5-dicloro-4-(3-cloro-5-trifluorometil-2-piridiloxi) fenil]-3-(2,6-difluorobenzoil)-urea (Clorfluazurón), del The Pesticide
Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection
Council, Londres, página 213;
- (X) O,O-dietil-O-3,5,6-tricloro-2-piridil-fosforotioato (Clorpirifos),
20 del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop
Protection Council, Londres, página 235;
- (XI) (RS)- α -ciano-4-fluoro-3-fenoxibencil-(1RS,3RS;1RS,3RS)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato (Ciflutrina),
25 del The Pesticide Manual, 11^a 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-trifluoro-propenil)-2,2-dimetilciclopropan-carboxilato y (R)- α -ciano-3-fenoxibencil-(Z)-(1S,3S)-3-(2-cloro-3,3,3-trifluoropropenil)-2,2-dimetilciclopropan-carboxilato (Lambda-Cihalotrina), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 300;

(XIII) Racemato que consiste en (S)- α -ciano-3-fenoxibencil-(Z)-(1R,3R)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropan-carboxilato y (R)- α -ciano-3-fenoxibencil-(1S,3S)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropan-carboxilato (Alfa-cipermetrina), del The Pesticide Manual, 11^a 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-dimetilciclopropan-carboxilato (zeta-cipermetrina), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 314;

(XV) (S)- α -ciano-3-fenoxibencil-(1R,3R)-3-(2,2-dibromovinil)-2,2-dimetilciclopropan-carboxilato (Deltametrina), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 344;

(XVI) 1-(4-clorofenil)-3-(2,6-difluorobenzoil)urea (Diflubenzurón), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 395;

- (XVII) (1,4,5,6,7,7-hexacloro-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-ilenbismetilen)-sulfito (Endosulfano), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 459;
- 5 (XVIII) α -tioetil-o-tolil-metilcarbamato (Etiofencarb), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 479;
- (XIX) O,O-dimetil-O-4-nitro-m-tolil-fosforotioato (Fenitro-tión), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 514;
- 10 (XX) 2-sec-butilfenil-metilcarbamato (Fenobucarb), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 516;
- (XXI) (RS)- α -ciano-3-fenoxibencil-(RS)-2-(4-clorofenil)-3-metilbutirato (Fenvalerato), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 539;
- 15 (XXII) S-[formil(metil)carbamoilmetil]-O,O-dimetil-fosforodi-tioato (Formotión), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 625;
- 20 (XXIII) 4-tiometil-3,5-xilil-metilcarbamato (Metiocarb), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 813;
- (XXIV) 7-clorobiciclo[3.2.0]hepta-2,6-dien-6-il-dimetilfos-fato (Heptenofos), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 670;
- 25

- (XXV) 1-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-nitroimidazolidin-2-ilidenamina
(Imidacloprid), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997),
The British Crop Protection Council, Londres, página 706;
- 5 (XXVI) 2-isopropilfenil-metilcarbamato (Isoprocarb), del The
Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop
Protection Council, Londres, página 729;
- (XXVII) O,S-dimetil-fosforamidotioato (Metamidofos), del The
Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop
Protection Council, Londres, página 808;
- 10 (XXVIII) S-metil-N-(metilcarbamoiloxi)tioacetimidato (Metomilo),
del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop
Protection Council, Londres, página 815;
- (XXIX) Metil-3-(dimetoxifosfinoiloxi)but-2-enoato (Mevinfos), del The
Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop
15 Protection Council, Londres, página 844;
- (XXX) O,O-dietil-O-4-nitrofenil-fosforotioato (Paratión), del The
Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop
Protection Council, Londres, página 926;
- (XXXI) O,O-dimetil-O-4-nitrofenil-fosforotioato (Paratión-metilo), del
20 The Pesticide Manual, 11^a 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-
dietil-fosforoditioato (Fosalona), del The Pesticide Manual, 11^a
Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres,
25 página 963;

- (XXXIII) 2-dimetilamino-5,6-dimetilpirimidin-4-il-dimetil-carbamato (Pirimicarb), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 985;
- 5 (XXXIV) 2-isopropoxifenil-metilcarbamato (Propoxur), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1036;
- (XXXV) 1-(3,5-dicloro-2,4-difluorofenil)-3-(2,6-difluoroben-zoil)urea (Teflubenzurón), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1158;
- 10 (XXXVI) S-terbutiltiometil-O,O-dietil-fosforoditioato (Terbufos), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1165;
- (XXXVII) Etil-(3-terbutil-1-dimetilcarbamoil-1H-1,2,4-triazol-5-il-tio)acetato (Triazamato), del The Pesticide Manual, 11^a Edición
- 15 (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1224;
- (XXXVIII) Abamectina, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 3;
- (XXXIX) 2-sec-butilfenil-metilcarbamato (Fenobucarb), del The
- 20 Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 516;
- (XL) N-terbutil-N'-(4-etilbenzoi)-3,5-dimetilbenzohidrazida (Tebufenozida), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1147;
- 25 (XLI) ($\pm$)-5-amino-1-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-4-

trifluorometilsulfinilpirazol-3-carbonitrilo (Fipronil), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 545;

5 (XLII) (RS)- α -ciano-4-fluoro-3-fenoxibencil(1RS,3RS;1RS,3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropancarboxilato (beta-Ciflutrina), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 295;

10 (XLIII) (4-etoxifenil)[3-(4-fluoro-3-fenoxifenil)propil] (dimetil)silano (Silafluofeno), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1105;

(XLIV) (E)- α -(1,3-dimetil-5-fenoxipirazol-4-ilmetilenamino-oxi)-p-tolurato de terbutilo (Fenpiroximato), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 530;

15 (XLV) 2-terbutil-5-(4-terbutiltiobencil)-4-cloropiridazin-3(2H)-ona (Piridabeno), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1161;

20 (XLVI) 4-[[4-(1,1-dimetiletil)fenil]etoxi]-quinazolina (Fenazaquina), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 507;

(XLVII) 4-fenoxifenil-(RS)-2-(piridiloxi)propil-éter (Piriproxifeno), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1073;

25 (XLVIII) 5-cloro-N-{2-[4-(2-etoxietil)-2,3-dimetilfenoxi] etil}-6-etilpirimidin-4-amina (Pirimidifeno), del The Pesticide Manual,

11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1070;

(XLIX) (E)-N-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-etil-N'-metil-2-

5 nitrovinilidendiamina (Nitenpiram), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 880;

(L) (E)-N¹-[(6-cloro-3-piridil)metil]-N²-clano-N¹-metilaceta-midina (NI-25, Acetamiprid), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 9;

10 (LI) Avermectina B₁, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 3;

(LII) un extracto de una planta activo contra insectos, especialmente (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),
15 del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1097; y un extracto de *Azadirachta indica*, especialmente azadiractina, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 59; y

20 (LIII) una preparación que contiene nemátodos activos contra insectos, de preferencia *Heterorhabditis bacteriophora* y *Heterorhabditis megidis*, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 671; *Steinernema feltiae*, del The Pesticide Manual, 11^a Edición
25 (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página

1115, y *Steinernema scapterisci*, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1116;

5 (LIV) una preparación que se puede obtener a partir de *Bacillus subtilis*, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 72; o a partir de una cepa de *Bacillus thuringiensis* con la excepción de los compuestos aislados a partir de GC91 o a partir de NCTC11821; The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The
10 British Crop Protection Council, Londres, página 73;

(LV) una preparación que contiene hongos activos contra insectos, de preferencia *Verticillium lecanii*, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1266; *Beauveria brogniartii*, del The Pesticide
15 Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 85; y *Beauveria bassiana*, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 83;

(LVI) una preparación que contiene virus activos contra insectos, de preferencia *Neodiprion Sertifer* NPV, del The Pesticide
20 Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1342; *Mamestra brassicae* NPV, del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 759, y virus *Cydia pomonella granulosis*, del The Pesticide Manual, 11^a Edición
25

(1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 291;

(CLXXXI) 7-cloro-2,3,4a,5-tetrahidro-2-[metoxicarbonil(4-trifluorometoxifenil)-carbamoil]indol[1,2e]oxazolin-4a-carboxilato (DPX-MP062, Indoxicarb), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 453;

(CLXXXII) N'-terbutil-N'-(3,5-dimetilbenzoil)-3-metoxi-2-metilbenzohidrazida (RH-2485, Metoxifenoazida), del The Pesticide Manual, 11^a Edición (1997), The British Crop Protection Council, Londres, página 1094; y

(CLXXXIII) isopropiléster del ácido N'-[4-metoxibifenil-3-il]-hidrazincarboxílico (D 2341), de Brighton Crop Protection Conference, 1998, 487-493;

(R2) Book of Abstracts, 212th ACS National Meeting Orlando, FL, 25-29 de agosto (1996), AGRO-020. Editor: American Chemical Society, Washington, D.C. CONEN: 63BFAF.

Como una consecuencia de los detalles anteriores, un aspecto esencial adicional de la presente invención se refiere a preparaciones en combinación para el control de parásitos en animales de sangre caliente, caracterizadas porque contienen, en adición a un compuesto de la fórmula I, cuando menos un ingrediente activo adicional, con una esfera de actividad igual o diferente, y cuando menos un vehículo fisiológicamente aceptable. La presente invención no está restringida a combinaciones dobles.

Como regla, las composiciones antihelmínticas de acuerdo con la invención contienen del 0.1 al 99 por ciento en peso, en especial del 0.1 al 95 por ciento en peso del ingrediente activo de la fórmula I, Ia, ó mezclas de los mismos, y del 99.9 al 1 por ciento en peso, en especial del 99.8 al 5 por ciento en peso de una mezcla sólida o líquida, incluyendo del 0 al 25 por ciento en peso, en especial del 0.1 al 25 por ciento en peso de un tensoactivo.

La aplicación de las composiciones de acuerdo con la invención a los animales que se vayan a tratar, puede tener lugar tópicamente, peroralmente, parenteralmente, o subcutáneamente, estando la composición presente en la forma de soluciones, emulsiones, suspensiones (inundaciones), polvos, tabletas, bolos, cápsulas, y formulaciones vertidas.

El método vertido o aplicado consiste en aplicar el compuesto de la fórmula I a un lugar específico de la piel o del pelo, convenientemente al cuello o al lomo del animal. Esto tiene lugar, por ejemplo, mediante la aplicación de un cotonete o rocío de la formulación vertida o aplicada a un área relativamente pequeña del pelo, desde donde se dispersa la sustancia activa casi automáticamente sobre amplias áreas del pelo, debido a la naturaleza extensora de los componentes de la formulación, y asistido por los movimientos del animal.

Las formulaciones vertidas o aplicadas adecuadamente contienen vehículos que promuevan la dispersión rápida sobre la superficie de la piel o en el pelo del animal huésped, y en general se

consideran como aceites extensores. Los vehículos adecuados son, por ejemplo, soluciones oleosas; soluciones alcohólicas e isopropanólicas, tales como soluciones de 2-octildodecanol o alcohol oleílico; soluciones en ésteres de ácidos monocarboxílicos, tales como miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, oxalato de ácido láurico, oleiléster de ácido oleico, deciléster de ácido oleico, laurato de hexilo, oleato de oleilo, oleato de decilo, ésteres del ácido cáprico de los alcoholes grasos saturados con una longitud de cadena de 12 a 18 átomos de carbono; soluciones de ésteres de ácidos dicarboxílicos, tales como ftalato de dibutilo, isoftalato de di-isopropilo, di-isopropiléster de ácido adípico, adipato de di-butilo normal, o también soluciones de ésteres de ácidos alifáticos, por ejemplo glicoles. Puede ser conveniente si adicionalmente está presente un agente dispersante, tal como uno conocido en la industria farmacéutica o cosmética. Los ejemplos son 2-pirrolidona, 2-(N-alquil)pirrolidona, acetona, polietilen-glicol, y éteres y ésteres de los mismos, propilenglicol, o triglicéridos sintéticos.

Las soluciones oleosas incluyen, por ejemplo, aceites vegetales tales como aceite de oliva, aceite de cacahuete, aceite de ajonjolí, aceite de pino, aceite de linaza, o aceite de ricino. Los aceites vegetales también pueden estar presentes en una forma epoxidada. También se pueden utilizar parafinas y aceites de silicona.

En general, una formulación vertida o aplicada contiene del 1 al 20 por ciento en peso de un compuesto de la fórmula I, del 0.1 al

50 por ciento en peso de un agente dispersante, y del 45 al 98.9 por ciento en peso de un solvente.

El método vertido o aplicado es especialmente conveniente para utilizarse en animales gregarios, tales como ganado, caballos, 5 ovejas, o cerdos, en donde es difícil o tardado tratar a todos los animales oralmente o mediante inyección. Debido a su simplicidad, este método, por supuesto, también se puede utilizar para todos los demás animales, incluyendo animales domésticos individuales o mascotas, y es muy favorecido por los cuidadores de los animales, 10 debido a que con frecuencia se puede llevar a cabo sin la presencia especialista de un veterinario.

Aunque se prefiere formular los productos comerciales como concentrados, el usuario final normalmente utilizará formulaciones diluidas.

15 Estas composiciones también pueden contener aditivos adicionales, tales como estabilizantes, agentes antiespumantes, reguladores de viscosidad, agentes aglutinantes, o viscosantes, así como otros ingredientes activos para alcanzar efectos especiales.

Las composiciones antihelmínticas de este tipo, que son 20 utilizadas por el usuario final, similarmente forman un constituyente de la presente invención.

En cada uno de los procedimientos de conformidad con la invención para el control de plagas, o en cada una de las composiciones para el control de plagas de acuerdo con la invención, 25 los ingredientes activos de la fórmula I se pueden utilizar en todas

sus configuraciones estéricas o en mezclas de las mismas.

La invención también incluye un método para la protección profiláctica de animales de sangre caliente, en especial de ganado productor, animales domésticos y mascotas, contra helmintos parasitarios, el cual se caracteriza porque los ingredientes activos de la fórmula, o las formulaciones de ingredientes activos preparadas a partir de los mismos, se administran a los animales como un aditivo al alimento o a las bebidas, o también en una forma sólida o líquida, oralmente, mediante inyección, o parenteralmente. La invención también incluye los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención para utilizarse en uno de estos procedimientos.

Los siguientes ejemplos sirven meramente para ilustrar la invención, sin restringirla, representando el término "ingrediente activo" una sustancia enlistada en las tablas.

En particular, las formulaciones preferidas se forman como sigue:

(% = por ciento en peso)

Ejemplos de Formulación

<u>1. Granulado</u>	a)	b)
ingrediente activo	5%	10%
caolín	94%	-
ácido silícico altamente dispersado	1%	-
atapulgita	-	90%

El ingrediente activo se disuelve en cloruro de metileno, se rocía sobre el vehículo, y el solvente subsecuentemente se concentra por evaporación al vacío. El granulado de esta clase se puede mezclar con el alimento del animal.

5

2. Granulado

ingrediente activo	3%
polietilenglicol (PM: 200)	3%
caolín	94%

10 (PM: peso molecular)

El ingrediente activo finamente molido se aplica uniformemente en una mezcladora al caolín, que se ha humedecido con polietilenglicol. De esta manera, se obtienen gránulos recubiertos exentos de polvo.

15

3. Tabletas o bolos

I.	ingrediente activo	33.00%
	metilcelulosa	0.80%
	ácido silícico altamente dispersado	0.80%
20	almidón de maíz	8.40%
II.	Lactosa cristalina	22.50%
	almidón de maíz	17.00%
	celulosa microcristalina	16.50%
	estearato de magnesio	1.00%

25

76
71

- I. La metilcelulosa se agita en agua. Después de que se ha hinchado el material, se agita el ácido silícico, y la mezcla se suspende homogéneamente. Se mezclan el ingrediente activo y el almidón de maíz. La suspensión acuosa se procesa en esta mezcla y se amasa hasta obtener una masa. La masa resultante se granula a través de un tamiz de 12 M, y se seca.
- II. Los cuatro excipientes se mezclan completamente.
- III. Las mezclas preliminares obtenidas de acuerdo con I y II se mezclan y se comprimen para dar tabletas o bolos.

10

4. Inyectables

A. Vehículo oleoso (liberación lenta)

- | | | |
|----|-----------------------|----------------------|
| 1. | ingrediente activo | 0.1-1.0 gramos |
| | aceite de cacahuete | hasta 100 mililitros |
| 15 | 2. ingrediente activo | 0.1-1.0 gramos |
| | aceite de ajonjolí | hasta 100 mililitros |

Preparación: El ingrediente activo se disuelve en una parte del aceite con agitación, y si se requiere, con ligero calentamiento, luego, después de enfriarse, se lleva hasta el volumen deseado, y se filtra estéril a través de un filtro de membrana adecuado con un tamaño de poros de 0.22 micras.

20

B. Solvente miscible en agua (velocidad de liberación promedio)

- | | | |
|----|------------------------------|----------------|
| | ingrediente activo | 0.1-1.0 gramos |
| 25 | 4-hidroximetil-1,3-dioxolano | 40 gramos |

77
72

	(glicerol-formal)	
	1,2-propanodiol	hasta 100 mililitros
	ingrediente activo	0.1-1.0 gramos
	glicerol-dimetil-cetal	40 gramos
5	1,2-propanodiol	hasta 100 mililitros
Preparación: El ingrediente activo se disuelve en una parte del solvente con agitación, se lleva hasta el volumen deseado, y se filtra estéril a través de un filtro de membrana adecuado con un tamaño de poros de 0.22 micras.		
10	C. <u>Solubilizado acuoso (liberación rápida)</u>	
	1. ingrediente activo	0.1-1.0 gramos
	aceite de ricino polietoxilado	10 gramos
	(40 unidades de óxido de etileno)	
15	1,2-propanodiol	20 gramos
	alcohol bencílico	1 gramo
	agua para inyección	hasta 100 mililitros
	2. ingrediente activo	0.1-1.0 gramos
20	mono-oleato de sorbitán polietoxi-	8 gramos
	lado (20 unidades de óxido de etileno)	
	4-hidroximetil-1,3-dioxolano	20 gramos
	(glicerol-formal)	
	alcohol bencílico	1 gramo
25	agua para inyección	hasta 100 mililitros

Preparación: El ingrediente activo se disuelve en los solventes y el tensoactivo, y se lleva hasta el volumen deseado con agua. Filtración estéril a través de un filtro de membrana apropiado con un tamaño de poros de 0.22 micras.

5

5. Vertido

A.

Ingrediente activo	5 gramos
Miristato de isopropilo	10 gramos
Isopropanol	hasta 100 mililitros

10

B.

Ingrediente activo	2 gramos
Laurato de hexilo	5 gramos
Triglicéridos de cadena mediana.	15 gramos
Etanol	hasta 100 mililitros.

15

C.

Ingrediente activo	2 gramos
Oleato de oleilo	5 gramos
N-metilpirrolidona	40 gramos
Isopropanol	hasta 100 mililitros.

20

25

Los sistemas acuosos también se pueden utilizar de

preferencia para aplicación oral y/o intrarruminal.

Las composiciones también pueden contener aditivos adicionales, tales como estabilizantes, por ejemplo, donde sea apropiado, aceites vegetales epoxidados (aceite de coco, aceite de semilla de colza, o aceite de semilla de soya epoxidados);
antiespumantes, por ejemplo aceite de silicona, conservadores, reguladores de viscosidad, aglutinantes, viscosantes, así como fertilizantes u otros ingredientes activos para lograr efectos especiales.

También se pueden agregar sustancias biológicamente activas o aditivos adicionales que sean neutros hacia los compuestos de la fórmula I, y que no tengan un efecto dañino sobre el animal huésped que se vaya a tratar, así como sales minerales o vitaminas, a las composiciones descritas.

Los siguientes ejemplos sirven para ilustrar la invención. No limitan la invención. La letra 'h' denota horas.

Ejemplos de Preparación

Ejemplo 1: N-[1-clano-1-metil-2-(5-clorobenzotriazol-1-il)-etil]-4-trifluorometoxibenzamida

a) Una mezcla de 5 gramos de 5-clorobenzotriazol, 1.4 gramos de cloroacetona, 5.1 gramos de carbonato de potasio, y 0.5 gramos de yoduro de potasio se agitan en 50 mililitros de acetona, a temperatura ambiente durante 48 horas. Subsecuentemente la mezcla se filtra, el filtrado se concentra por evaporación al vacío, y

80
75

el residuo se purifica mediante cromatografía por evaporación. De esta manera, se aislan dos productos isoméricos, 1-(5-clorobenzotriazol-1-il)-propan-2-ona y 1-(6-clorobenzotriazol-1-il)-propan-2-ona, en aproximadamente las mismas cantidades, el primero de los cuales se utiliza entonces directamente en el siguiente paso.

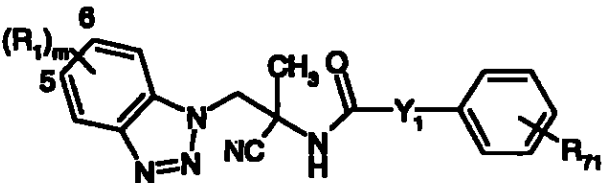
b) Se disuelven 240 miligramos de 1-(5-clorobenzotriazol-1-il)-propan-2-ona en 4 mililitros de una solución 2 molar de amoníaco en etanol; luego se agregan 64 miligramos de cianuro de sodio y 91 miligramos de cloruro de amonio, y la mezcla se agita durante la noche a temperatura ambiente. Subsecuentemente, la mezcla de reacción se concentra por evaporación al vacío, se disuelve nuevamente en acetato de etilo, y se lava con agua y una solución saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica se separa, se seca con sulfato de magnesio, y se concentra por evaporación. De esta manera se obtiene el 2-amino-3-(5-clorobenzotriazol-1-il)-2-metilpropionitrilo.

c) Se disuelven 258 miligramos de 2-amino-3-(5-clorobenzotriazol-1-il)-2-metilpropionitrilo en 8 mililitros de diclorometano seco, se mezclan con 194 miligramos de etildiisopropilamina, 16 miligramos de 4-dimetilaminopiridina, y 292 miligramos de cloruro de 4-(2-trifluorometoxi)-benzolio, y subsecuentemente se agitan durante 7 horas a temperatura ambiente. Después, la mezcla de reacción se diluye con acetato de etilo, luego se lava con una solución saturada de bicarbonato de

sodio y con una solución saturada de cloruro de sodio. Después de secar la fase orgánica con sulfato de magnesio y de concentrar por evaporación, el residuo se recrystaliza en dietiléter. De esta manera, se obtiene el compuesto del título con un punto de fusión de 135°C.

5 Las sustancias mencionadas en la siguiente tabla también se pueden preparar de una manera análoga al método anteriormente descrito. Los valores de los puntos de fusión se indican en °C. Bd. significa un enlace directo.

10 **Tabla 1**



15

No.	Y ₁	(R ₁) _m	R ₇₁	Datos Fís.
1.1	Bd.	H	H	
20 1.2	Bd.	H	2-Cl	
1.3	Bd.	H	3-Cl	
1.4	Bd.	H	4-Cl	
1.5	Bd.	H	2-F	
1.6	Bd.	H	3-F	
25 1.7	Bd.	H	4-F	

47
71

	1.8	Bd.	H	2-CH ₃
	1.9	Bd.	H	3-CH ₃
	1.10	Bd.	H	4-CH ₃
	1.11	Bd.	H	2-OCH ₃
5	1.12	Bd.	H	3-OCH ₃
	1.13	Bd.	H	4-OCH ₃
	1.14	Bd.	H	2-CF ₃
	1.15	Bd.	H	3-CF ₃
	1.16	Bd.	H	4-CF ₃
10	1.17	Bd.	H	2-OCF ₃
	1.18	Bd.	H	3-OCF ₃
	1.19	Bd.	H	4-OCF ₃
	1.20	Bd.	H	2-OCF ₂ CF ₂
	1.21	Bd.	H	3-OCF ₂ CF ₂
15	1.22	Bd.	H	4-OCF ₂ CF ₂
	1.23	Bd.	H	2-OC ₂ F ₅
	1.24	Bd.	H	3-OC ₂ F ₅
	1.25	Bd.	H	4-OC ₂ F ₅
	1.26	Bd.	H	2-OC ₆ H ₅
20	1.27	Bd.	H	3-OC ₆ H ₅
	1.28	Bd.	H	4-OC ₆ H ₅
	1.29	Bd.	H	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.30	Bd.	H	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.31	Bd.	H	4-C(O)C ₆ H ₅
25	1.32	Bd.	H	4-CN

43
78

	1.33	Bd.	5-Cl	H	
	1.34	Bd.	5-Cl	2-Cl	
	1.35	Bd.	5-Cl	3-Cl	
	1.36	Bd.	5-Cl	4-Cl	
5	1.37	Bd.	5-Cl	2-F	
	1.38	Bd.	5-Cl	3-F	
	1.39	Bd.	5-Cl	4-F	
	1.40	Bd.	5-Cl	2-CH ₃	
	1.41	Bd.	5-Cl	3-CH ₃	
10	1.42	Bd.	5-Cl	4-CH ₃	
	1.43	Bd.	5-Cl	2-OCH ₃	
	1.44	Bd.	5-Cl	3-OCH ₃	
	1.45	Bd.	5-Cl	4-OCH ₃	
	1.46	Bd.	5-Cl	2-CF ₃	
15	1.47	Bd.	5-Cl	3-CF ₃	
	1.48	Bd.	5-Cl	4-CF ₃	
	1.49	Bd.	5-Cl	2-OCF ₃	
	1.50	Bd.	5-Cl	3-OCF ₃	
	1.51	Bd.	5-Cl	4-OCF ₃	p.f.135°
20	1.52	Bd.	5-Cl	2-OCF ₂ CF ₂	
	1.53	Bd.	5-Cl	3-OCF ₂ CF ₂	
	1.54	Bd.	5-Cl	4-OCF ₂ CF ₂	
	1.55	Bd.	5-Cl	2-OC ₂ F ₆	
	1.56	Bd.	5-Cl	3-OC ₂ F ₆	
25	1.57	Bd.	5-Cl	4-OC ₂ F ₆	

84
79

	1.58	Bd.	5-Cl	2-OC ₆ H ₅
	1.59	Bd.	5-Cl	3-OC ₆ H ₅
	1.60	Bd.	5-Cl	4-OC ₆ H ₅
	1.61	Bd.	5-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅
5	1.62	Bd.	5-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.63	Bd.	5-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅
	1.64	Bd.	5-Cl	4-CN
	1.65	Bd.	6-Cl	H
	1.66	Bd.	6-Cl	2-Cl
10	1.67	Bd.	6-Cl	3-Cl
	1.68	Bd.	6-Cl	4-Cl
	1.69	Bd.	6-Cl	2-F
	1.70	Bd.	6-Cl	3-F
	1.71	Bd.	6-Cl	4-F
15	1.72	Bd.	6-Cl	2-CH ₃
	1.73	Bd.	6-Cl	3-CH ₃
	1.74	Bd.	6-Cl	4-CH ₃
	1.75	Bd.	6-Cl	2-OCH ₃
	1.76	Bd.	6-Cl	3-OCH ₃
20	1.77	Bd.	6-Cl	4-OCH ₃
	1.78	Bd.	6-Cl	2-CF ₃
	1.79	Bd.	6-Cl	3-CF ₃
	1.80	Bd.	6-Cl	4-CF ₃
	1.81	Bd.	6-Cl	2-OCF ₃
25	1.82	Bd.	6-Cl	3-OCF ₃

85
80

	1.83	Bd.	6-Cl	4-OCF ₃	p.f. 124°
	1.84	Bd.	6-Cl	2-OCF ₂ CF ₂	
	1.85	Bd.	6-Cl	3-OCF ₂ CF ₂	
	1.86	Bd.	6-Cl	4-OCF ₂ CF ₂	
5	1.87	Bd.	6-Cl	2-OC ₂ F ₅	
	1.88	Bd.	6-Cl	3-OC ₂ F ₅	
	1.89	Bd.	6-Cl	4-OC ₂ F ₅	
	1.90	Bd.	6-Cl	2-OC ₈ H ₅	
	1.91	Bd.	6-Cl	3-OC ₈ H ₅	
10	1.92	Bd.	6-Cl	4-OC ₈ H ₅	
	1.93	Bd.	6-Cl	2-C(O)C ₈ H ₅	
	1.94	Bd.	6-Cl	3-C(O)C ₈ H ₅	
	1.95	Bd.	6-Cl	4-C(O)C ₈ H ₅	
	1.96	Bd.	6-Cl	4-CN	
15	1.97	Bd.	5-Cl,6-F	H	
	1.98	Bd.	5-Cl,6-F	2-Cl	
	1.99	Bd.	5-Cl,6-F	3-Cl	
	1.100	Bd.	5-Cl,6-F	4-Cl	
	1.101	Bd.	5-Cl,6-F	2-F	
20	1.102	Bd.	5-Cl,6-F	3-F	
	1.103	Bd.	5-Cl,6-F	4-F	
	1.104	Bd.	5-Cl,6-F	2-CH ₃	
	1.105	Bd.	5-Cl,6-F	3-CH ₃	
	1.106	Bd.	5-Cl,6-F	4-CH ₃	
25	1.107	Bd.	5-Cl,6-F	2-OCH ₃	

	1.108	Bd.	5-Cl,6-F	3-OCH ₃	
	1.109	Bd.	5-Cl,6-F	4-OCH ₃	
	1.110	Bd.	5-Cl,6-F	2-CF ₃	
	1.111	Bd.	5-Cl,6-F	3-CF ₃	
5	1.112	Bd.	5-Cl,6-F	4-CF ₃	
	1.113	Bd.	5-Cl,6-F	2-OCF ₃	
	1.114	Bd.	5-Cl,6-F	3-OCF ₃	
	1.115	Bd.	5-Cl,6-F	4-OCF ₃	sólido
	1.116	Bd.	5-Cl,6-F	2-OCF ₂ CF ₂	
10	1.117	Bd.	5-Cl,6-F	3-OCF ₂ CF ₂	
	1.118	Bd.	5-Cl,6-F	4-OCF ₂ CF ₂	
	1.119	Bd.	5-Cl,6-F	2-OC ₂ F ₅	
	1.120	Bd.	5-Cl,6-F	3-OC ₂ F ₅	
	1.121	Bd.	5-Cl,6-F	4-OC ₂ F ₅	
15	1.122	Bd.	5-Cl,6-F	2-OC ₆ H ₅	
	1.123	Bd.	5-Cl,6-F	3-OC ₆ H ₅	
	1.124	Bd.	5-Cl,6-F	4-OC ₆ H ₅	
	1.125	Bd.	5-Cl,6-F	2-C(O)C ₆ H ₅	
	1.126	Bd.	5-Cl,6-F	3-C(O)C ₆ H ₅	
20	1.127	Bd.	5-Cl,6-F	4-C(O)C ₆ H ₅	
	1.128	Bd.	5-Cl,6-F	4-CN	
	1.129	Bd.	6-Cl,5-F	H	
	1.130	Bd.	6-Cl,5-F	2-Cl	
	1.131	Bd.	6-Cl,5-F	3-Cl	
25	1.132	Bd.	6-Cl,5-F	4-Cl	

87
82

	1.133	Bd.	6-Cl,5-F	2-F	
	1.134	Bd.	6-Cl,5-F	3-F	
	1.135	Bd.	6-Cl,5-F	4-F	
	1.136	Bd.	6-Cl,5-F	2-CH ₃	
5	1.137	Bd.	6-Cl,5-F	3-CH ₃	
	1.138	Bd.	6-Cl,5-F	4-CH ₃	
	1.139	Bd.	6-Cl,5-F	2-OCH ₃	
	1.140	Bd.	6-Cl,5-F	3-OCH ₃	
	1.141	Bd.	6-Cl,5-F	4-OCH ₃	
10	1.142	Bd.	6-Cl,5-F	2-CF ₃	
	1.143	Bd.	6-Cl,5-F	3-CF ₃	
	1.144	Bd.	6-Cl,5-F	4-CF ₃	
	1.145	Bd.	6-Cl,5-F	2-OCF ₃	
	1.146	Bd.	6-Cl,5-F	3-OCF ₃	
15	1.147	Bd.	6-Cl,5-F	4-OCF ₃	sólido
	1.148	Bd.	6-Cl,5-F	2-OCF ₂ CF ₂	
	1.149	Bd.	6-Cl,5-F	3-OCF ₂ CF ₂	
	1.150	Bd.	6-Cl,5-F	4-OCF ₂ CF ₂	
	1.151	Bd.	6-Cl,5-F	2-OC ₂ F ₅	
20	1.152	Bd.	6-Cl,5-F	3-OC ₂ F ₅	
	1.153	Bd.	6-Cl,5-F	4-OC ₂ F ₅	
	1.154	Bd.	6-Cl,5-F	2-OC ₆ H ₅	
	1.155	Bd.	6-Cl,5-F	3-OC ₆ H ₅	
	1.156	Bd.	6-Cl,5-F	4-OC ₆ H ₅	
25	1.157	Bd.	6-Cl,5-F	2-C(O)C ₆ H ₅	

	1.158	Bd.	6-Cl,5-F	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.159	Bd.	6-Cl,5-F	4-C(O)C ₆ H ₅
	1.160	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-CN
	1.161	CH ₂ O	H	H
5	1.162	CH ₂ O	H	2-Cl
	1.163	CH ₂ O	H	3-Cl
	1.164	CH ₂ O	H	4-Cl
	1.165	CH ₂ O	H	2-F
	1.166	CH ₂ O	H	3-F
10	1.167	CH ₂ O	H	4-F
	1.168	CH ₂ O	H	2-CH ₃
	1.169	CH ₂ O	H	3-CH ₃
	1.170	CH ₂ O	H	4-CH ₃
	1.171	CH ₂ O	H	2-OCH ₃
15	1.172	CH ₂ O	H	3-OCH ₃
	1.173	CH ₂ O	H	4-OCH ₃
	1.174	CH ₂ O	H	2-CF ₃
	1.175	CH ₂ O	H	3-CF ₃
	1.176	CH ₂ O	H	4-CF ₃
20	1.177	CH ₂ O	H	2-OCF ₃
	1.178	CH ₂ O	H	3-OCF ₃
	1.179	CH ₂ O	H	4-OCF ₃
	1.180	CH ₂ O	H	2-OCF ₂ CF ₂
	1.181	CH ₂ O	H	3-OCF ₂ CF ₂
25	1.182	CH ₂ O	H	4-OCF ₂ CF ₂

84

	1.183	CH ₂ O	H	2-OC ₂ F ₆
	1.184	CH ₂ O	H	3-OC ₂ F ₆
	1.185	CH ₂ O	H	4-OC ₂ F ₆
	1.186	CH ₂ O	H	2-OC ₆ H ₅
5	1.187	CH ₂ O	H	3-OC ₆ H ₅
	1.188	CH ₂ O	H	4-OC ₆ H ₅
	1.189	CH ₂ O	H	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.190	CH ₂ O	H	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.191	CH ₂ O	H	4-C(O)C ₆ H ₅
10	1.192	CH ₂ O	H	4-CN
	1.193	CH ₂ O	5-Cl	H
	1.194	CH ₂ O	5-Cl	2-Cl
	1.195	CH ₂ O	5-Cl	3-Cl
	1.196	CH ₂ O	5-Cl	4-Cl
15	1.197	CH ₂ O	5-Cl	2-F
	1.198	CH ₂ O	5-Cl	3-F
	1.199	CH ₂ O	5-Cl	4-F
	1.200	CH ₂ O	5-Cl	2-CH ₃
	1.201	CH ₂ O	5-Cl	3-CH ₃
20	1.202	CH ₂ O	5-Cl	4-CH ₃
	1.203	CH ₂ O	5-Cl	2-OCH ₃
	1.204	CH ₂ O	5-Cl	3-OCH ₃
	1.205	CH ₂ O	5-Cl	4-OCH ₃
	1.206	CH ₂ O	5-Cl	2-CF ₃
25	1.207	CH ₂ O	5-Cl	3-CF ₃

90
85

	1.208	CH ₂ O	5-Cl	4-CF ₃
	1.209	CH ₂ O	5-Cl	2-OCF ₃
	1.210	CH ₂ O	5-Cl	3-OCF ₃
	1.211	CH ₂ O	5-Cl	4-OCF ₃
5	1.212	CH ₂ O	5-Cl	2-OCF ₂ CF ₂
	1.213	CH ₂ O	5-Cl	3-OCF ₂ CF ₂
	1.214	CH ₂ O	5-Cl	4-OCF ₂ CF ₂
	1.215	CH ₂ O	5-Cl	2-OC ₂ F ₅
	1.216	CH ₂ O	5-Cl	3-OC ₂ F ₅
10	1.217	CH ₂ O	5-Cl	4-OC ₂ F ₅
	1.218	CH ₂ O	5-Cl	2-OC ₆ H ₅
	1.219	CH ₂ O	5-Cl	3-OC ₆ H ₅
	1.220	CH ₂ O	5-Cl	4-OC ₆ H ₅
	1.221	CH ₂ O	5-Cl	2-C(O)C ₆ H ₅
15	1.222	CH ₂ O	5-Cl	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.223	CH ₂ O	5-Cl	4-C(O)C ₆ H ₅
	1.224	CH ₂ O	5-Cl	4-CN
	1.225	CH ₂ O	6-Cl	H
	1.226	CH ₂ O	6-Cl	2-Cl
20	1.227	CH ₂ O	6-Cl	3-Cl
	1.228	CH ₂ O	6-Cl	4-Cl
	1.229	CH ₂ O	6-Cl	2-F
	1.230	CH ₂ O	6-Cl	3-F
	1.231	CH ₂ O	6-Cl	4-F
25	1.232	CH ₂ O	6-Cl	2-CH ₃

	1.233	CH ₂ O	6-Cl	3-CH ₃
	1.234	CH ₂ O	6-Cl	4-CH ₃
	1.235	CH ₂ O	6-Cl	2-OCH ₃
	1.236	CH ₂ O	6-Cl	3-OCH ₃
5	1.237	CH ₂ O	6-Cl	4-OCH ₃
	1.238	CH ₂ O	6-Cl	2-CF ₃
	1.239	CH ₂ O	6-Cl	3-CF ₃
	1.240	CH ₂ O	6-Cl	4-CF ₃
	1.241	CH ₂ O	6-Cl	2-OCF ₃
10	1.242	CH ₂ O	6-Cl	3-OCF ₃
	1.243	CH ₂ O	6-Cl	4-OCF ₃
	1.244	CH ₂ O	6-Cl	2-OCF ₂ CF ₂
	1.245	CH ₂ O	6-Cl	3-OCF ₂ CF ₂
	1.246	CH ₂ O	6-Cl	4-OCF ₂ CF ₂
15	1.247	CH ₂ O	6-Cl	2-OC ₂ F ₆
	1.248	CH ₂ O	6-Cl	3-OC ₂ F ₆
	1.249	CH ₂ O	6-Cl	4-OC ₂ F ₆
	1.250	CH ₂ O	6-Cl	2-OC ₈ H ₆
	1.251	CH ₂ O	6-Cl	3-OC ₈ H ₆
20	1.252	CH ₂ O	6-Cl	4-OC ₈ H ₆
	1.253	CH ₂ O	6-Cl	2-C(O)C ₈ H ₅
	1.254	CH ₂ O	6-Cl	3-C(O)C ₈ H ₅
	1.255	CH ₂ O	6-Cl	4-C(O)C ₈ H ₅
	1.256	CH ₂ O	6-Cl	4-CN
25	1.257	CH ₂ O	5-Cl,6-F	H

92
87

	1.258	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-Cl
	1.259	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-Cl
	1.260	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-Cl
	1.261	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-F
5	1.262	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-F
	1.263	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-F
	1.264	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-CH ₃
	1.265	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-CH ₃
	1.266	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-CH ₃
10	1.267	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-OCH ₃
	1.268	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-OCH ₃
	1.269	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-OCH ₃
	1.270	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-CF ₃
	1.271	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-CF ₃
15	1.272	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-CF ₃
	1.273	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-OCF ₃
	1.274	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-OCF ₃
	1.275	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-OCF ₃
	1.276	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-OCF ₂ CF ₂
20	1.277	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-OCF ₂ CF ₂
	1.278	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-OCF ₂ CF ₂
	1.279	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-OC ₂ F ₅
	1.280	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-OC ₂ F ₅
	1.281	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-OC ₂ F ₅
25	1.282	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-OC ₆ H ₅

73
88

	1.283	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-OC ₆ H ₅
	1.284	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-OC ₆ H ₅
	1.285	CH ₂ O	5-Cl,6-F	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.286	CH ₂ O	5-Cl,6-F	3-C(O)C ₆ H ₅
5	1.287	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-C(O)C ₆ H ₅
	1.288	CH ₂ O	5-Cl,6-F	4-CN
	1.289	CH ₂ O	6-Cl,5-F	H
	1.290	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-Cl
	1.291	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-Cl
10	1.292	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-Cl
	1.293	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-F
	1.294	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-F
	1.295	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-F
	1.296	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-CH ₃
15	1.297	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-CH ₃
	1.298	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-CH ₃
	1.299	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-OCH ₃
	1.300	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-OCH ₃
	1.301	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-OCH ₃
20	1.302	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-CF ₃
	1.303	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-CF ₃
	1.304	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-CF ₃
	1.305	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-OCF ₃
	1.306	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-OCF ₃
25	1.307	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-OCF ₃

	1.308	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-OCF ₂ CF ₂
	1.309	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-OCF ₂ CF ₂
	1.310	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-OCF ₂ CF ₂
	1.311	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-OC ₂ F ₆
5	1.312	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-OC ₂ F ₆
	1.313	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-OC ₂ F ₆
	1.314	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-OC ₆ H ₅
	1.315	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-OC ₆ H ₅
	1.316	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-OC ₆ H ₅
10	1.317	CH ₂ O	6-Cl,5-F	2-C(O)C ₆ H ₅
	1.318	CH ₂ O	6-Cl,5-F	3-C(O)C ₆ H ₅
	1.319	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-C(O)C ₆ H ₅
	1.320	CH ₂ O	6-Cl,5-F	4-CN

15

Ejemplos Biológicos

20

1. Prueba In Vivo sobre Trichostrongylus colubriformis y Haemonchus contortus en jerbos mongoles (Meriones unguiculatus) usando aplicación peroral

25

Los jerbos mongoles de 6 a 8 semanas de edad se infectan mediante alimentación artificial con aproximadamente 2,000 larvas en la tercera etapa de *T. colubriformis* y *H. contortus*. Seis días después de la infección, los jerbos se anestesian ligeramente con N₂O, y se tratan mediante aplicación peroral con los compuestos de

prueba, disueltos en una mezcla de dos partes de sulfóxido de dimetilo y una parte de polietilenglicol (PEG 300), con cantidades de 100, 32, y 10-0.1 miligramos/kilogramo. En el día 9 (3 días después del tratamiento), cuando la mayoría de las larvas de *H. contortus* que todavía están presentes son larvas en la cuarta etapa tardía, y la mayoría de las *T. colubriformis* son adultas inmaduras, los jerbos se sacrifican con el objeto de contar los gusanos. La eficacia se calcula como porcentaje de reducción del número de gusanos en cada jerbo, comparándose con el promedio geométrico del número de gusanos de 8 jerbos infectados y no tratados.

En esta prueba, se logra una gran reducción en la infestación de nemátodos con los 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.

2. Actividad sobre larvas L₁ de *Lucilia sericata*

1 mililitro de una suspensión acuosa de la sustancia activa que se vaya a probar, se mezcla con 3 mililitros de un medio especial para reproducir larvas, a aproximadamente 50°C, de tal manera que se obtiene un homogenato con un contenido de ingrediente activo de 250 ó de 125 ppm. Se utilizan aproximadamente 30 larvas de *Lucilia* (L₁) en la muestra de cada tubo de ensayo. Después de 4 días, se determina el índice de mortalidad.

3. Actividad acaricida sobre *Boophilus microplus* (cepa Biarra)

Se une una cinta adhesiva horizontalmente a una hoja de PVC, de tal manera que 10 garrapatas hembras totalmente saciadas de *Boophilus microplus* (cepa Biarra) puedan adherirse a la misma por sus lomos, lado a lado, en una fila. Utilizando una aguja para inyección, se inyecta 1 microlitro de un líquido en cada garrapata. El líquido es una mezcla de 1:1 de polietilenglicol y acetona, y contiene, disuelta en el mismo, cierta cantidad de ingrediente activo seleccionado a partir de 1, 0.1, ó 0.01 microgramos por garrapata. Los animales de control reciben una inyección sin ingrediente activo. Después del tratamiento, los animales se mantienen bajo condiciones normales en un insectario a aproximadamente 28°C y con una humedad relativa del 80 por ciento, hasta que tenga lugar la oviposición y hayan eclosionado las larvas de los huevos de los animales de control. La actividad de una sustancia probada se determina por la IR₉₀, es decir, se hace una evaluación de la dosificación de ingrediente activo en la que 9 de 10 garrapatas hembras (= 90 por ciento) ponen huevos que son infértiles inclusive después de 30 días.

4. Actividad *in vitro* sobre hembras de *Boophilus microplus* saciadas (Biarra):

4 x 10 garrapatas hembras saciadas de la cepa Biarra resistente a OP se adhieren a una cinta adhesiva, y se cubren

durante 1 hora con un cotonete de algodón impregnado con una emulsión o suspensión del compuesto de prueba en concentraciones de 500, 125, 31, y 8 ppm, respectivamente. La evaluación tiene lugar 28 días después, basándose en la mortalidad, la oviposición, y la eclosión de larvas.

Una indicación de la actividad de los compuestos de prueba se muestra por el número de hembras que:

- mueren rápidamente, antes de poner huevos,
- sobreviven durante algún tiempo, sin poner huevos,
- 10 - ponen huevos en los que no se forman embriones,
- ponen huevos en los que se forman embriones, de los cuales no eclosionan larvas, y
- ponen huevos en los que se forman embriones, de los cuales eclosionan las larvas normalmente en 26 a 27 días.

15

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

Aproximadamente cinco ninfas en ayunas se colocan en un tubo de ensayo de poliestireno que contiene 2 mililitros del compuesto de prueba en solución, suspensión, o emulsión.

20

Después de sumergir durante 10 minutos y de agitar durante 2 x 10 segundos en una mezcladora de vórtex, se bloquean los tubos de ensayo con un cojín de lana de algodón apretado, y se rotan. Tan pronto como todo el líquido haya sido recogido por la bola de lana de algodón, ésta se empuja a la mitad del camino adentro del tubo de ensayo, el cual todavía se está rotando, de tal manera que se

25

exprime la mayor parte del líquido hacia afuera de la bola de lana de algodón y fluye hacia una caja de Petri colocada debajo.

Luego, los tubos de ensayo se mantienen a temperatura ambiente en una habitación con luz de día hasta la evaluación.

- 5 Después de 14 días, los tubos de ensayo se sumergen en un vaso de precipitados con agua en ebullición. Si las garrapatas empiezan a moverse en reacción al calor, la sustancia de prueba es inactiva en la concentración probada; de otra manera, se considera que las garrapatas están muertas, y se considera que las sustancias de
- 10 prueba son activas en la concentración probada. Todas las sustancias se prueban en un rango de concentración de 0.1 a 100 ppm.

6. Actividad contra *Dermanyssus gallinae*

- 15 2 a 3 mililitros de una solución que contiene 10 ppm de ingrediente activo y aproximadamente 200 ácaros (*Dermanyssus gallinae*) en diferentes etapas de desarrollo, se agregan a un recipiente de vidrio abierto en la parte superior. Luego el recipiente se cierra con un cojín de lana de algodón, se agita durante 10
- 20 minutos, hasta que se hayan humedecido completamente los ácaros, y luego se invierte brevemente, de tal manera que la solución de prueba restante pueda ser absorbida por la lana de algodón. Después de 3 días, se determina la mortalidad de los ácaros contando los individuos muertos, y esto se indica como un
- 25 porcentaje.

7. Actividad contra *Musca domestica*

Un cubo de azúcar se trata con una solución de la sustancia de prueba, de tal manera que la concentración de la sustancia de prueba en el azúcar, después de secarse durante la noche, sea de 250 ppm. El cubo tratado de esta manera se coloca sobre un plato de aluminio con lana de algodón húmeda y 10 *Musca domestica* adultas de una cepa resistente a OP, se cubre con un vaso de precipitados, y se incuba a 25°C. El índice de mortalidad se determina después de 24 horas.

10

15

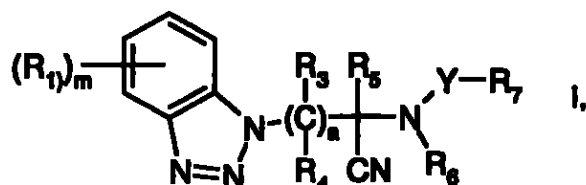
20

25

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula:

5



en donde:

10

R_1 significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioarilo, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquiloxilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino, arilo insustituido o sustituido, o fenoxilo insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos

25

de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono;

5 R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, significan hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los
10 sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno y alquilo de 1 a 6 átomos de carbono; fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser
15 independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a
20 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, o di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino;

 o R_4 y R_5 significan juntos alquileno de 2 a 6 átomos de carbono;

25 R_6 significa hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de

carbono; alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono-álquilo de 1 a 6 átomos de carbono, aminocarbonilo, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, o bencilo;

R₇ significa hidrógeno, álquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloálquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di(álquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino, piperonilo, fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, álquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloálquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloálquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilóxido de 3 a 6 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alquénilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquínilo de 2 a 6 átomos de carbono, cicloálquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alquénilóxido de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilóxido de 2 a 6 átomos de carbono, tioálquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioálquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilóxido de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono,

tioalquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halotioalquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino, alquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilamino de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilaminocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)aminocarbonilo; arilalquilo de 1 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilamino que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilcarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilcarboniloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, hetariloxialquilo de 1 a 6 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxycarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y fenilacetilenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independientes de los otros y se seleccionan a partir del grupo

que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono;

hetarilo insustituido o hetarilo que está sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, halotioalquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfinilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, y di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino;

o naftilo o quinolilo que están insustituídos o sustituidos una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alquénilóxido de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilóxido de 2 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfínilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfínilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquénilo de 2 a 6 átomos de carbono, halotioalquénilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquénilsulfínilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilsulfínilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquénilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, haloalquénilsulfonilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 6 átomos de carbono, y di(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)amino;

R_8 y R_9 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquiltiocarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, arilo, o heterilo;

Y significa un enlace directo, C(O), C(S), ó S(O)_n;

a significa 1, 2, ó 3;

25 m significa 0, 1, 2, 3, ó 4; y

n es 1 ó 2.

2. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₁ significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono o fenóxido insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono.

3. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₁ significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, o fenóxido insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono.

4. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₁ significa halógeno, ciano, nitro, alquilo

de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono.

5 5. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, son hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en
10 halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o
15 R_4 y R_5 son juntos alquileo de 2 a 6 átomos de carbono.

 6. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_3 , R_4 , y R_5 son, independientemente unos de otros, hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono; o cicloalquilo de 3
20 a 6 átomos de carbono.

 7. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_3 , R_4 , y R_5 son, independientemente unos de otros, hidrógeno, metilo, o halometilo.

 8. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la
25 reivindicación 1, en donde R_6 es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos

de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono; alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o bencilo.

5 9. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_6 es hidrógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, o bencilo.

10. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_6 es hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono.

10 11. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_7 significa fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo

15

20

25

de 2 a 4 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 4 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)amino, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; 5 arilalquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, 10 hetariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxicarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independientes de los otros y se seleccionan a partir 15 del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y 20 haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, 25 haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de

carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y
5 haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, o

naftilo o quinolilo que están insustituídos o sustituidos una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, halotioalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono.
10
15

12. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₇ significa arilo que está insustituído o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos
20
25

de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono; o

hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a

2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono.

5 13. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₇ significa arilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 10 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o 15 muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independiente de los otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono.

20 14. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R₈ y R₉, independientemente uno del otro, significan hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, o arilo.

25 15. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la

reivindicación 1, en donde R_8 y R_9 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono.

16. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R_8 y R_9 , independientemente uno del otro,
5 significan hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono.

17. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Y es $C(O)$ ó $S(O)_n$.

18. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Y es $C(O)$.

10 19. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde a es 1 ó 2.

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

15 21. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 1, 2, ó 3.

22. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 1 ó 2.

23. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde n es 2.

20 24. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde:

R_1 significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de
25 carbono, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono,

haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, o fenoxilo insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, son hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono; fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, y halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o R_4 y R_5 son juntos alquileno de 2 a 6 átomos de carbono;

R_6 es hidrógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono; alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o bencilo;

R_7 significa fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,

haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfoniloxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilsulfonilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquenilsulfonilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquilamino de 1 a 4 átomos de carbono, di(alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)amino, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxycarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, hetariloxialquilo de 1 a 4 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxycarbonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, arilsulfonilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independiente de los otros y se seleccionan a partir del grupo que

consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono; o

naftilo o quinolilo que están insustituidos o sustituidos una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, alqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, haloalqueniloxilo de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquenilo de 2 a 4

átomos de carbono, halotioalquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

5 R_8 y R_9 , independientemente uno del otro, significan hidrógeno, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, o arilo;

Y es $C(O)$ ó $S(O)_n$;

a significa 1 ó 2;

10 m es 1, 2, 3, y

n significa 2.

25. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde:

15 R_1 significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcóxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o fenóxilo insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, alquilo de 1
20 a 4 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono, y haloalcóxilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R_3 , R_4 , y R_5 , independientemente unos de otros, significan hidrógeno, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo
25 de 1 a 2 átomos de carbono; o cicloalquilo de 3 a 6 átomos de

carbono;

R₆ significa hidrógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono; alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, o bencilo;

5 R₇ significa fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 10 5 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono; 15 arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y 20 piridiloxilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos 25 de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono,

alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono; o

hetarilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, nitro, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, alquénilóxido de 2 a 4 átomos de carbono, haloalquénilóxido de 2 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalquilsulfonilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R₆ y R₆, independientemente uno del otro, significan hidrógeno o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

Y significa C(O);

a significa 1; y

m es 1 ó 2.

26. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde:

R₁ significa halógeno, ciano, nitro, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono;

R₃, R₄, y R₅, independientemente unos de otros, significan hidrógeno, metilo o halometilo;

R₆ significa hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

R₇ significa fenilo que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser independientes unos de otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilcarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 2 átomos de carbono; arilalquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, y ariloxialquilo de 1 a 2 átomos de carbono que está insustituido o sustituido una o muchas veces, en donde los sustituyentes pueden ser cada uno independiente de los otros y se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 2 átomos de carbono, y haloalcóxido de 1 a 2 átomos de carbono;

R₈ y R₉, independientemente uno del otro, significan hidrógeno o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono;

Y significa C(O);

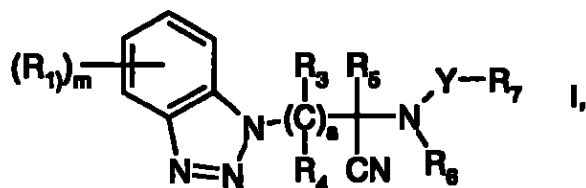
a significa 1; y

m es 1 ó 2.

27. Un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, con el nombre N-[1-ciano-1-metil-2-(5-

clorobenzotriazol-1-il)-etil]-4-trifluorometoxibenzamida.

28. Un procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula I, respectivamente en forma libre o en forma de sal, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde se hace reaccionar un compuesto de la fórmula:



el cual es conocido o se puede producir de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , a y m son como se definen para la fórmula I, con un compuesto de la fórmula:

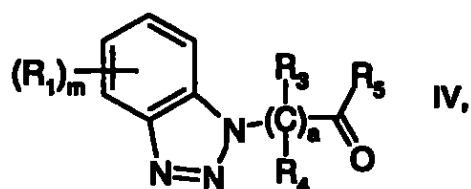
Q - Y - R_7 III,

el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde Y y R_7 se definen como se da para la fórmula I, y Q es un grupo saliente, opcionalmente en la presencia de un catalizador básico, y si se desea, un compuesto de la fórmula I que se pueda obtener de acuerdo con el método o de otra manera, respectivamente en forma libre o en forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula I, se separa una mezcla de isómeros que se pueda obtener de acuerdo con el método, y se aísla el isómero deseado, y/o un

compuesto libre de la fórmula I que se pueda obtener de acuerdo con el método, se convierte en una sal, o una sal de un compuesto de la fórmula I que se pueda obtener de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula I o en otra sal.

5 29. Un procedimiento para la preparación de compuestos de la fórmula II, respectivamente en forma libre o en forma de sal, de acuerdo con la reivindicación 28, en donde se hace reaccionar un compuesto de la fórmula:

10



el cual es conocido o se puede producir de una manera
 15 análoga a los compuestos conocidos correspondientes, en donde R_1 , R_3 , R_4 , R_5 , a y m son como se definen para la fórmula I, con un cianuro inorgánico u orgánico y con un compuesto de la fórmula R_6-NH_2 , el cual es conocido o se puede producir de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_6 es
 20 como se define para la fórmula I, y si se desea, un compuesto de la fórmula II que se pueda obtener de acuerdo con el método o de otra manera, respectivamente en forma libre o en forma de sal, se convierte en otro compuesto de la fórmula II, se separa de una mezcla de isómeros que se pueda obtener de acuerdo con el método,
 25 y se aísla el isómero deseado, y/o un compuesto libre de la fórmula

II que se pueda obtener de acuerdo con el método se convierte en una sal, o una sal de un compuesto de la fórmula II que se pueda obtener de acuerdo con el método se convierte en el compuesto libre de la fórmula II o en otra sal.

5 30. El uso de compuestos de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27, en el control de parásitos.

 31. Un método para controlar parásitos, mediante el cual, se utiliza una cantidad efectiva de cuando menos un compuesto
10 de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27, sobre los parásitos.

 32. El uso de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27, en un procedimiento para controlar parásitos en animales de sangre caliente.

15 33. El uso de un compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 27, en la preparación de una composición farmacéutica contra parásitos en animales de sangre caliente.

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

PCT/EP 03 / 1 0 0 4 7 -

International Application No.

10 SEP 2003 ✓

International Filing Date

(10.09.2003)

EUROPEAN PATENT OFFICE

PCT INTERNATIONAL APPLICATION

Name of receiving Office and "PCT International Application"

Applicant's or agent's file reference

(if desired) (12 characters maximum) H -32646A

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 the 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.

125
120

Continuation of Box No. III FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S)

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

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.)

DUCRAY, Pierre
8 rue des allées
68128 Village-Neuf
FR

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:

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: (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.)

GOEBEL, Thomas
Lettenweg 28B
79539 Lörrach
DE

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:

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: (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.)

GAUVRY, Noëlle
8F, rue des buissons
68680 Kembs-Loechele
FR

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:

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: (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.)

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:

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.

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

☒ **HA** **Harare 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	
☒ BB Barbados	☒ KE Kenya	☒ SC Seychelles
☒ BG Bulgaria	☒ KG Kyrgyzstan	☐ SD Sudan
☒ BR Brazil	☒ KP Democratic People's Republic of Korea	☒ SE Sweden
☒ BY Belarus	☒ KR Republic of Korea	☒ SG Singapore
☒ BZ Belize	☒ KZ Kazakhstan	☒ SK Slovakia
☒ CA Canada	☒ LC Saint Lucia	☐ SL Sierra Leone
☒ CH & LI Switzerland and Liechtenstein	☒ LK Sri Lanka	☒ TJ Tajikistan
☒ CN China	☐ LR Liberia	☒ TM Turkmenistan
☒ CO Colombia	☐ LS Lesotho	☒ TN Tunisia
☒ CR Costa Rica	☒ LT Lithuania	☒ TR Turkey
☒ CU Cuba	☒ LU Luxembourg	☒ TT Trinidad and Tobago
☒ CZ Czech Republic	☒ LV Latvia	
☒ DE Germany	☒ MA Morocco	☐ TZ United Republic of Tanzania
☒ DK Denmark	☒ MD Republic of Moldova	☒ UA Ukraine
☒ DM Dominica		☐ UG Uganda
☒ DZ Algeria	☐ MG Madagascar	☒ US United States of America
☒ EC Ecuador	☒ MK The former Yugoslav Republic of Macedonia	
☒ EE Estonia	☒ MN Mongolia	☒ UZ Uzbekistan
☒ ES Spain	☐ MW Malawi	☒ VC Saint Vincent and the Grenadines
☒ FI Finland	☒ MX Mexico	☒ VN Viet Nam
☒ GB United Kingdom	☐ MZ Mozambique	☒ YU Yugoslavia
☒ GD Grenada	☒ NO Norway	☒ ZA South Africa
☒ GE Georgia		☐ ZM Zambia
☒ GH Ghana		☒ ZW Zimbabwe

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

☒ NI Nicaragua ☐ ☐

☒ EG Egypt ☐ ☐

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.)

127
122

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.

124
123

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) 11 September 2002 ^v (11.09.02)	1542/02 ✓	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:	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):	Number of items
(a) In paper form, the following number of sheets:		
request (including declaration sheets) : 6	1. ☒ fee calculation sheet	: 1
description (excluding sequence listings and/or tables related thereto) : 43	2. ☒ original separate power of attorney	: 1
claims : 10	3. ☐ original general power of attorney	:
abstract : 1	4. ☒ copy of general power of attorney; reference number, if any: AV 36671 + 46171	: 2
drawings : 0	5. ☐ statement explaining lack of signature	:
Sub-total number of sheets : 60	6. ☒ priority document(s) identified in Box No. VI as item(s): (1)	: 1
sequence listings	7. ☐ translation of international application into (language):	:
tables related thereto	8. ☐ separate indications concerning deposited microorganism or other biological material	:
(for both, actual number of sheets if filed in paper form, whether or not also filed in computer readable form; see (c) below)	9. ☐ sequence listings in computer readable form (indicate type and number of carriers)	:
Total number of sheets : 60	(i) ☐ copy submitted for the purposes of international search under Rule 13ter only (and not as part of the international application):	:
(b) ☐ only in computer readable form (Section 801(a)(i))	(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	:
(i) ☐ sequence listings	(iii) ☐ together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the sequence listings mentioned in left column	:
(ii) ☐ tables related thereto	10. ☐ tables in computer readable form related to sequence listings (indicate type and number of carriers)	:
(c) ☐ also in computer readable form (Section 801(a)(ii))	(i) ☐ copy submitted for the purposes of international search under Section 802(b-quarter) only (and not as part of the international application)	:
(i) ☐ sequence listings	(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-quarter)	:
(ii) ☐ tables related thereto	(iii) ☐ together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the tables mentioned in left column	:
Type and number of carriers (diskette, CD-ROM, CD-R or other) on which are contained the	11. ☐ other (specify):	:
☐ sequence listings:		
☐ tables related thereto:		
(additional copies to be indicated under items 9(ii) and/or 10(ii), in right column)		

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

AW Grubb

21.08.2003

GRUBB, Philip AV 36671 + 46171

For receiving Office use only		2. Drawings: ☐ received: ☐ not received:
1. Date of actual receipt of the purported international application:	10 SEP 2003 (10.09.03)	
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:

120
125

(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
25 de Marzo del 2004 (25.03.2004)

(10) Número de Publicación Internacional
WO 2004/024704 A1

PCT

(51) Clasificación de Patente Inter.: C07D 249/18, A61K 31/4192, A01N 43/707, A61P 33/00, A01N 37/34

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

(21) Número de Solicitud Inter.: PCT/EP2003/010047

(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.

(22) Fecha de Presentación Inter.: 10 de Septiembre del 2003 (10.09.2003)

(25) Idioma de Presentación:

Inglés

(26) Idioma de Publicación:

Inglés

(30) Datos de Prioridad:

1542/02 11 de Septiembre del 2002 (11.09.2002) CH

(84) Estados Designados (*regional*): patente Eurasiática (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, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), patente OAPI (NE).

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

Publicada:

- Con informe de búsqueda internacional

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

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.

(72) Inventores: y

(75) Inventores/Solicitantes: DUCRAY, Pierre [FR/FR]; 8, rue des halléis, F-68128 Village-Neuf (FR). GOEBEL, Thomas [DE/DE]; Lettenweg 28B, 79539 Lörrach (DE). GAUVRY, Noëlle [FR/FR]; 8P, rue des buissones, F-68680 Kembs-Loechele (FR).

(54) Título: COMPUESTOS ORGANICOS

(57) Resumen:

La invención se refiere a compuestos de la fórmula general: (I) en donde R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, Y, a y m tienen los significados dados en la reivindicación 1, y opcionalmente enantiómeros de los mismos. Los ingredientes activos tienen propiedades plaguicidas convenientes. Son especialmente adecuados para controlar parásitos en animales de sangre caliente.

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
25 March 2004 (25.03.2004)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2004/024704 A1

(51) International Patent Classification⁷: C07D 249/18,
A61K 31/4192, A01N 43/707, A61P 33/00, A01N 37/34

Lörrach (DE). GAUVRY, Noëlle [FR/FR]; 8F, rue des
buissons, F-68680 Kembs-Loechle (FR).

(21) International Application Number:
PCT/EP2003/010047

(74) Agent: GRUBB, Philip; Novartis AG, Corporate Intellec-
tual Property, 4002 Basel (CH).

(22) International Filing Date:
10 September 2003 (10.09.2003)

(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, EG, ES, FI, GB, GD, GE,
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.

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
1542/02 11 September 2002 (11.09.2002) CH

(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), OAPI patent
(NE).

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

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

Published:
— with international search report

(72) Inventors; and

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

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: ORGANIC COMPOUNDS

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

WO 2004/024704 A1

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

Applicant's or agent's file reference H-32646A	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 03/10047	International filing date (day/month/year) 10/09/2003	(Earliest) Priority Date (day/month/year) 11/09/2002
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 5 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:

BENZOTRIAZOL-1-YL-AMINOACETONITRILE (COMPOUNDS AND THEIR USE) IN THE CONTROL OF PARASITE DISEASE

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 03/10047

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D249/18 A61K31/4192 A01N43/707 A61P33/00 A01N37/34

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A61K A01N

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

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

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 02 49641 A (NOVARTIS ERFINDE VERWALT GMBH ;NOVARTIS AG (CH); BOUVIER JACQUES (C) 27 June 2002 (2002-06-27) claims 1-6	1-32
A	EP 0 953 365 A (KAWASUMI LAB INC) 3 November 1999 (1999-11-03) cited in the application claims 1,4,5; example 152	1-32
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 016, no. 358 (C-0970), 4 August 1992 (1992-08-04) -& JP 04 112872 A (NIPPON KAYAKU CO LTD), 14 April 1992 (1992-04-14) compound 14 in Table 1, p.6 abstract	1-32
	-/-	



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.

"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

9 December 2003

Date of mailing of the international search report

19/12/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 851 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Schuemacher, A

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 03/10047

124
129

C (Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 00 73290 A (ASSMANN LUTZ ;BAYER AGROCHEM KK (JP); ARAKI YASUO (JP); SAWADA HAR) 7 December 2000 (2000-12-07) claims 1,5; examples 122,127 page 17, line 18 - line 19 page 10, line 1 - line 5	1-32
P,X	WO 03 042184 A (NOVARTIS PHARMA GMBH ;NOVARTIS AG (CH); GOEBEL THOMAS (DE); DUCRAY) 22 May 2003 (2003-05-22)	30-32
Y	claims 1,30-34; example 1	1-29

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP 03/10047

25
130

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 30-32 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.

INTERNATI NAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/10047

136
131

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0249641	A	27-06-2002	AU 3458802 A CA 2432388 A1 WO 0249641 A2	01-07-2002 27-06-2002 27-06-2002
EP 0953365	A	03-11-1999	JP 11313896 A EP 0953365 A2	16-11-1999 03-11-1999
JP 04112872	A	14-04-1992	NONE	
WO 0073290	A	07-12-2000	JP 2000336080 A AU 4923200 A BR 0011029 A CN 1353700 T WO 0073290 A1 EP 1185519 A1 JP 2003500482 T US 2003013750 A1	05-12-2000 18-12-2000 19-02-2002 12-06-2002 07-12-2000 13-03-2002 07-01-2003 16-01-2003
WO 03042184	A	22-05-2003	WO 03042184 A1	22-05-2003

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.

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-32646A	
International application No. PCT/EP 03/10047	International filing date (day/month/year) 10. September 2003 (10.09.03)	(Earliest) Priority date (day/month/year) 11. September 2002 (11.09.02)	
Title of invention BENZOTRIAZOL-1-YL-AMINOACETONITRILE COMPOUNDS AND THEIR USE IN THE CONTROL OF PARASITE DISEASE			
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 68168 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.			

Sheet No. 2.

International application No.
PCT/EP 03/10047

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
Lettenweg 28B
79539 Lörrach
DEState *(that is, country)* of nationality:
DEState *(that is, country)* of residence:
DEName 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.)*GAUVRY, Noëlle
8F, rue des buissons
68680 Kembs-Loechele
FRState *(that is, country)* of nationality:
FRState *(that is, country)* of residence:
FRName 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.

Sheet No. 3

International application No.
PCT/EP 03/10047

Box No. III AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE; OR ADDRESS FOR CORRESPONDENCE

The 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 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.

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 the applicable time limit under Rule 69.1(d).4. ☐ The applicant expressly wishes the international preliminary examination to start earlier than at the expiration of the applicable time limit under Rule 54bis.1(a).

* 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 filing of this demand constitutes the election of all Contracting States which are designated and are bound by Chapter II of the PCT.

Sheet No. . 4

International application No.
PCT/EP 03/10047

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 listing in computer readable form |
| 3. ☐ original general power of attorney | 7. ☐ tables in computer readable form related to a sequence listing |
| 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



08.03.2004

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. | 6. ☐ The date of receipt of the demand is AFTER the expiration of the time limit under Rule 54bis.1(a) and item 7 or 8, below, does not apply. |
| 4. ☐ The date of receipt of the demand is WITHIN the time limit of 19 months from the priority date as extended by virtue of Rule 80.5. | 7. ☐ The date of receipt of the demand is WITHIN the time limit under Rule 54bis.1(a) 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. | 8. ☐ Although the date of receipt of the demand is after the expiration of the time limit under Rule 54bis.1(a), the delay in arrival is EXCUSED pursuant to Rule 82. |

For International Bureau use only

Demand received from IPEA on:

PCT

FEE CALCULATION SHEET

Annex to the Demand

International application No. PCT/EP 03/10047 Applicant's or agent's file reference H-32646A Applicant Novartis AG et al.	For International Preliminary Examining Authority use only
CALCULATION OF PRESCRIBED FEES 1. Preliminary examination fee EUR 1530.- P 2. Handling fee (<i>Applicants from certain States are entitled to a reduction of 75% of the handling fee. Where the applicant is (or all applicants are) so entitled, the amount to be entered at H is 25% of the handling fee.</i>) EUR 129.- H 3. Total of prescribed fees Add the amounts entered at P and H and enter total in the TOTAL box EUR 1659.- TOTAL	
MODE OF PAYMENT ☒ authorization to charge deposit account with the IPEA (see below) ☐ cash ☐ cheque ☐ revenue stamps ☐ postal money order ☐ coupons ☐ bank draft ☐ other (specify):	
AUTHORIZATION TO CHARGE (OR CREDIT) DEPOSIT ACCOUNT <i>(This mode of payment may not be available at all IPEAs)</i> ☒ Authorization to charge the total fees indicated above. IPEA/EP _____ ☒ <i>(This check-box may be marked only if the conditions for deposit accounts of the IPEA so permit)</i> Authorization to charge any deficiency or credit any overpayment in the total fees indicated above. Deposit Account No.: 2811 0031 Date: 08.03.04 Name: Novartis AG Signature:	

PATENT COOPERATION TREATY

Corporate Intellectual Property				
- 1 April 2004				
F/F	M/D	F/L	PS	Copy

PCT

137

From :
INTES

To:

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

WRITTEN OPINION

(PCT Rule 66)

Date of mailing
(day/month/year) 30/03/2004

Applicant's or agent's file reference
H-32646A

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

International application No.

PCT/EP03/10047

International filing date (day/month/year)

10/09/2003

Priority date (day/month/year)

11/09/2002

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

C07D249/18

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 66.8.

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: 11/01/2005

Name and mailing address of the IPEA/

European Patent Office
D-80296 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.

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

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-32646A	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IP/EA/416)	
International application No. PCT/EP03/10047	International filing date (day/month/year) 10/09/2003	Priority date (day/month/year) 11/09/2002
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D249/18		
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 607 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 09/03/2004	Date of completion of this report 25/06/2004
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 GELLIE B R Tel. (+49-89) 2399 2828

Form PCT/IP/EA/409 (cover sheet) P20476 (October 2002)



145
140

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).

Folios 146 y 147
- tarjetos
Q

141
148

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION	()	()
- 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:

SECRETARÍA DE ECONOMÍA
REGISTRACIÓN DE MARCAS Y DISEÑOS INDUSTRIALES
FECHA (AÑO): 2002-03-17 14:04:16
USUARIO : VIL PLI-PRIMERI JVS PASC NOLI ALL PASC NOLI
DEPENDENCIA: CENY DIVISION DE MARCAS Y DISEÑOS INDUSTRIALES



149

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

142

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 05 - 25154

Fecha: 27 de abril de 2005

Se certifica que:

Desde fecha 16 de abril de 1997,
del folio 90.643 al folio 90.650 del
libro de Protocolo N° 311, obra el poder
N° 17.398 conferido por NOVARTIS AG
(NOVARTISSA) (NOVARTIS INC.)
domiciliado(a) en Basilea - Suiza
al doctor JIMENA ESCOBAR URIBE y/o IGNACIO
ESCOBAR URIBE.
Representante en Santafé de Bogotá D.C. Los
mismos.

Facultad para desistir y sustituir SI.

Revisado 202027.

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
E-mail: Info@slc.gov.co
www.slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia



143

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Folio 150

2020
Bogotá DCDoctor(a)
JIMENA ESCOBAR URIBE
Apoderado(a)
NOVARTIS AG

REFERENCIA:	Radicación No.	05 - 25154
	Solicitud Internacional	PCT/EP2003/010047
	Fecha límite inicio fase Nacional	11-04-2005
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	418
	Oficio No.	208
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá-DC

13 MAYO 2005


DORIS ELENA POLO CORDOBA
Jefe de la División de Nuevas Creaciones (E)

202027

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
E-mail: info sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia